



(19) REPUBLIKA HRVATSKA
DRŽAVNI ZAVOD ZA
INTELEKTUALNO VLASNIŠTVO

(10) Identifikator
dokumenta:



HR P20120379 T1

HR P20120379 T1

(12) **PRIJEVOD PATENTNIH ZAHTJEVA
EUROPSKOG PATENTA**

(51) MKP:

C07F 9/6558 (2006.01)
C07D 403/04 (2006.01)

(46) Datum objave prijevoda patentnih zahtjeva: 31.05.2012.

(21) Broj predmeta: P20120379T

(22) Datum podnošenja zahtjeva u HR: 04.05.2012.

(86) Broj međunarodne prijave: PCT/CA2004000793
Datum podnošenja međunarodne prijave: 28.05.2004.

(96) Broj europske prijave patenta: EP 04735171.3
Datum podnošenja europske prijave patenta: 28.05.2004.

(87) Broj međunarodne objave: WO 2004106328
Datum međunarodne objave: 09.12.2004.

(97) Broj objave europske prijave patenta: EP 1644363 A1
Datum objave europske prijave patenta: 12.04.2006.

(97) Broj objave europskog patenta: EP 1644363 B1
Datum objave europskog patenta: 22.02.2012.

(31) Broj prve prijave: 474741 P

(32) Datum podnošenja prve prijave: 30.05.2003.

(33) Država ili organizacija podnošenja prve prijave: US

(73) Nositelj patenta:

**Gemin X Pharmaceuticals Canada Inc., 3576 Avenue du Parc, Montréal ,
H2X 2H7 QC, CA**

(72) Izumitelj:

**Giorgio Attardo, 2740 Boul. Prudential, Vimont, H7K 3M1 QC, CA
Kenza Dairi, 777 Gosford Street, Appt 403, Montreal, H2Y 4BY QC, CA
Jean-Francois Lavallee, 28 Scraire, Milles-Iles, J0R 1A0 QC, CA
Elise Rioux, 3696 Boul. St-Joseph East, Montreal, H1X 1W6 QC, CA
Sasmita Tripathy, 4451 King Street, Pierrefonds, H9H 2G2 QC, CA
Xavier Billot, 5287 Marquette, Montreal, H2J 3Z4 QC, CA
Terrence W. Doyle, 5 Wellsweep Lane, Killingworth, 06419 CT, US**

(74) Zastupnik:

PRODUCTA d.o.o., 10000 Zagreb, HR

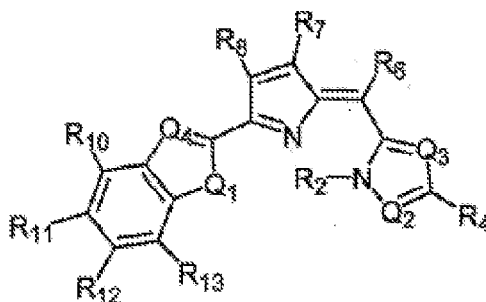
(54) Naziv izuma:

TRIHETEROCIKLIČKI SPOJEVI, PRIPRAVCI I POSTUPCI ZA LIJEČENJE KARCINOMA

HR P20120379 T1

PATENTNI ZAHTEJVI

5 1. Spoj formule (Ia)



(Ia)

ili njegova farmaceutska prihvatljiva sol **naznačen time** da

Q₁ je -N(R₁)-;

Q₂ je -C(R₃)-;

Q₃ je -C(R₅)-;

Q₄ je -C(R₉)-;

R₁ je -Y_m(R_a), pri čemu -R_a je -H, -OH, -C₁-C₈ alkil, -C₂-C₈ alkenil, -C₂-C₈ alkinil, -C₃-C₁₂ cikloalkil, -fenil, -naftil, -3- do 9-člani heterocikal, -OR₁₄, -O(CH₂)_n OR₁₄, -C(O)R₁₄, -O-C(O)R₁₄, -C(O)(CH₂)_n -R₁₄, -O-C(O)OR₁₄, -O-C(O)NHR₁₄, -O-C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)OR₁₄, -C(O)NHR₁₄, -S-R₁₄, -SOR₁₄, -S(O)₂R₁₄, -NHC(O)R₁₄, -NHSR₁₄, -NHSOR₁₄, -NHS(O)₂R₁₄, -OS(O)₂O⁻, O-C(S)R₁₄, O-C(S)OR₁₄, O-C(S)NHR₁₄, O-C(S)N(R₁₄)₂, -C(S)OR₁₄, -C(S)NHR₁₄, -C(S)N(R₁₄)₂, -NHC(S)R₁₄, -NR₁₄C(S)R₁₄, -NHC(S)NHR₁₄, -NHC(S)N(R₁₄)₂, -NR₁₄C(S)NHR₁₄, ili -N R₁₄C(S)N(R₁₄)₂;

R₂ je -H, -C₁-C₈ alkil ili -OH;

R₃ i R₄ su neovisno -Y_m(R_b), pri čemu R_b je -H, halogen, -NH₂, -CN, -NO₂, -SH, -N₃, -C₁-C₈ alkil, -O-(C₁-C₈ alkil), -C₂-C₈ alkenil, -C₂-C₈ alkinil, -C₃-C₁₂ cikloalkil, -fenil, -naftil, -3- do 9-člani heterocikal, -OR₁₄, -O(CH₂)_nOR₁₄, -C(O)R₁₄, -O-C(O)R₁₄, -C(O)(CH₂)_n -R₁₄, -O-C(O)OR₁₄, -O-C(O)NHR₁₄, -O-C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)OR₁₄, -C(O)NHR₁₄, -S-R₁₄, -SOR₁₄, -S(O)₂R₁₄, -NHC(O)R₁₄, -NHSR₁₄, -NHSOR₁₄, -NHS(O)₂R₁₄, O-C(S)R₁₄, O-C(S)OR₁₄, O-C(S)NHR₁₄, O-C(S)N(R₁₄)₂, -C(S)OR₁₄, -C(S)NHR₁₄, -C(S)N(R₁₄)₂, -NHC(S)R₁₄, -NR₁₄C(S)R₁₄, -NHC(S)NHR₁₄, -NHC(S)N(R₁₄)₂, -NR₁₄C(S)NHR₁₄, -N R₁₄C(S)N(R₁₄)₂ ili R₃ i R₄, zajedno sa atomom ugljika, na koji je svaki spojen, formiraju 5- do 9-člani prsten;

R₅ je -C₁-C₈ alkil ili -O-(C₁-C₈ alkil);

R₆ je -H, halogen, -OH, -NH₂, -C₁-C₈ alkil, ili -O-(C₁-C₈ alkil);

R₇ je -Y_m(R_c), pri čemu -R_c je -C₁-C₈ alkil, -O-(C₁-C₈ alkil), -O-benzil, -OH, -NH₂, -NH(C₁-C₅ alkil), -N(C₁-C₅ alkil)₂, -NH(fenil), -N(fenil)₂, -NH(naftil), -N(naftil)₂, -CN, -NO₂, -N₃, -C₂-C₈ alkinil, -OR₁₄, -O(CH₂)_n OR₁₄, -C(O)R₁₄, -O-C(O)R₁₄, -C(O)(CH₂)_n-R₁₄, -O-C(O)OR₁₄, -O-C(O)NHR₁₄, -O-C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)OR₁₄, -C(O)NHR₁₄, -S-R₁₄, -SOR₁₄, -S(O)₂R₁₄, -NHC(O)R₁₄, -NHSR₁₄, -NHSOR₁₄, -NHS(O)₂R₁₄, -O(CH₂)_n C(O)O(CH₂)_n CH₃, O-C(S)R₁₄, O-C(S)OR₁₄, O-C(S)NHR₁₄, O-C(S)N(R₁₄)₂, -C(S)OR₁₄, -C(S)NHR₁₄, -C(S)N(R₁₄)₂, -NHC(S)R₁₄, -NR₁₄C(S)R₁₄, -NHC(S)NHR₁₄, -NHC(S)N(R₁₄)₂, -NR₁₄C(S)NHR₁₄, -N R₁₄C(S)N(R₁₄)₂;

R₈ je -Y_m(R_d), pri čemu -R_d je -H, -OH, halogen, amino, -NH(C₁-C₅ alkil), -N(C₁-C₅ alkil)₂, -NH(fenil), -N(fenil)₂, -NH(naftil), -N(naftil)₂, -CN, -NO₂, -N₃, -C₁-C₈ alkil, -C₁-C₈ alkinil, -OH, -O-(C₁-C₈ alkil), -C₂-C₈ alkenil, -C₂-C₈ alkinil, -C₃-C₁₂ cikloalkil, -fenil, -naftil, -3- do 9-člani heterocikal, -OR₁₄, -O(CH₂)_nOR₁₄, -C(O)R₁₄, -O-C(O)R₁₄, -C(O)(CH₂)_n-R₁₄, -O-C(O)OR₁₄, -O-C(O)NHR₁₄, -O-C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)OR₁₄, -C(O)NHR₁₄, -S-R₁₄, -SOR₁₄, -S(O)₂R₁₄, -NHC(O)R₁₄, -NHSR₁₄, -NHSOR₁₄, -NHS(O)₂R₁₄, O-C(S)R₁₄, O-C(S)OR₁₄, O-C(S)NHR₁₄, O-C(S)N(R₁₄)₂, -C(S)OR₁₄, -C(S)NHR₁₄, -C(S)N(R₁₄)₂, -NHC(S)R₁₄, -NR₁₄C(S)R₁₄, -NHC(S)NHR₁₄, -NHC(S)N(R₁₄)₂, -NR₁₄C(S)NHR₁₄, -N R₁₄C(S)N(R₁₄)₂;

R₉, R₁₀, R₁₁, R₁₂, i R₁₃ neovisno su -Y_m(R_e), pri čemu -R_e je -H, halogen, -NH₂, -C₁-C₈ alkil, -NH(C₁-C₅ alkil), -N(C₁-C₅ alkil)₂, -NH(fenil), -N(fenil)₂, -NH(naftil), -N(naftil)₂, -C(O)NH(C₁-C₅ alkil), -C(O)N(C₁-C₅ alkil)₂, -NHC(O)(C₁-C₅ alkil), -NHC(=NH₂⁺)NH₂, -CN, -NO₂, -N₃, -3- do 9-člani heterocikal, -OR₁₄, -O(CH₂)_n OR₁₄, -C(O)R₁₄, -O-C(O)R₁₄, -C(O)(CH₂)_n -R₁₄, -O-C(O)OR₁₄, -O-C(O)NHR₁₄, -O-C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)N(R₁₄)₂, -C(O)OR₁₄, -C(O)NHR₁₄, -S-R₁₄, -SOR₁₄, -S(O)₂R₁₄, -NHC(O)R₁₄, -NHSR₁₄, -NHSOR₁₄, -NHS(O)₂R₁₄, O-C(S)R₁₄, O-C(S)OR₁₄, O-C(S)NHR₁₄, O-C(S)N(R₁₄)₂, -C(S)OR₁₄, -C(S)NHR₁₄, -C(S)N(R₁₄)₂, -NHC(S)R₁₄, -NR₁₄C(S)R₁₄, -NHC(S)NHR₁₄, -NHC(S)N(R₁₄)₂, -NR₁₄C(S)NHR₁₄, -N R₁₄C(S)N(R₁₄)₂ ili R₁₁ i R₁₂ zajedno sa atomom ugljika, na koji je svaki spojen, formiraju 5-9 člani prsten;

svaki R₁₄ je nezavisno -H, -C₁-C₈ alkil, -C₃-C₁₂ cikloalkil, -fenil, -naftil, -3- do 9-člani heterocikal, -C₂-C₈ alkenil, ili -C₂-C₈ alkinil;

svaki Y je nezavisno -C₁-C₈ alkenil-, -C₂-C₈ alkenil- ili -C₂-C₈ alkinil-;

svaki m je nezavisno 0 ili 1; i svaki n je nezavisno cijeli broj od 0 do 6;

pri čemu:

svaka navedena -C₁-C₈ alkilna skupina je nesupstituirana ili supstituirana sa jednim ili više halogenom, -NH₂, -OH, -O(C₁-C₈ alkil), fenil ili naftil skupinama;

svaki -C₂-C₈ alkenil i -C₂-C₈ alkinil je nesupstituiran ili supstituiran sa fenilnom ili naftilnom skupinom; a svaki -O-benzil i -fenil je nesupstituiran ili supstituiran sa: halogenom odabranim od klora, joda, bromina ili fluora; C₁₋₆alkilom; C₂₋₆ alkenilom; C₂₋₆ alkinilom; hidroksilom, C₁₋₆ alkoksilom; amino; nitro; tiolom; tioeterom; iminom; cijano; amido; fosfonatom; fosfinom; karboksilom; tiokarbonilom; sulfonilom; sulfonamidom; ketonom; aldehidom; esterom; kisikom (=O); haloalkilom kao što su trifluorometil; karbociklički cikloalkil, koji može biti monociklički ili kondenziran ili ne-kondenziran policiklički, kao što su ciklopropil, ciklobutil, ciklopentil ili cikloheksil, ili heterocikloalkil, koji može biti monociklički ili kondenziran ili ne-kondenziran, kao što su pirolidinil, piperidinil, piperazinil, morfolinil ili tiazinil; karbociklički ili heterociklički, monociklički ili kondenziran ili ne-kondenziran policiklički aril, kao što su fenil, naftil, pirolil, indolil, furanil, tiofenil, imidazolil, oksazolil, izoksazolil, tiazolil, triazolil, tetrazolil, pirazolil, piridinil, kinolinil, izokinolinil, akridinil, pirazinil, piridazinil, pirimidinil, benzimidazolil, benzotiofenil ili benzofuranil; benziloksi; primarni, sekundarni ili tercijarni amino; -N(CH₃)₂; O-niži alkil; O-aril; aril; aril-niži alkil; CO₂CH₃; -OCH₂CH₃; metoksi; CONH₂; OCH₂CONH₂; NH₂; SO₂NH₂; OCHF₂; CF₃; te OCF₃; koji supstituenti su proizvoljno supstituirani sa kondenziranom-prstenastom strukturom ili mostom kao što je -OCH₂O-.

2. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da Q₁ je -NH.

3. Spoj prema zahtjevu 2, **naznačen time** da

Q₄ je -CH; i

R₂ i R₆ su -H.

4. Spoj prema zahtjevu 3, **naznačen time**, da R₄, R₈ i R₁₀ do R₁₃ su -H.

5. Spoj prema zahtjevu 4, **naznačen time**, da

Q₂ je -C(C₁-C₈ alkil)-;

Q₃ je -C(C₁-C₈ alkil)-; i

R₇ je -O(C₁-C₈ alkil)-.

6. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da je R₅ metil ili -O-metil.

7. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da R₆ je -H.

8. Spoj prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da je spoj odabran između:

2-[5-(4-jodo-3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;

2-[4-metoksi-5-(3-metoksi-1H-pirol-2-ilmetilen)-5H-pirol-2-il]-1H-indola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-5,6-dimetoksi-1H-indola;

5-bromo-2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;

tere-butil ester 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-5,6-dimetoksi-indol-1-karboksilne kiseline;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-3-(4-fenil-piperazin-1-ilmetil)-1H-indola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-3-morfolin-4-ilmetil-1H-indola;

2-(2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-3-hidroksimetil-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-ilmetil)-amino)-etanola;

[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-2-(3-metilaminometil-1H-indol-2-il)-5H-pirol-3-il]-5,6-metanola;

[2-(3-alilaminometil-1H-indol-2-il)-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-3-il]-metanola;

{5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-2-[3-(izopropilamino-metil)-1H-indol-2-il]-4-metoksi-5H-pirol-3-il}-metanola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;

{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-tiofen-3-il-metanona;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-etoksi-5H-pirol-2-il]-3-(2-morfolin-4-il-etil)-1H-indola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-5-metoksi-1H-indola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-3-(2-pirolidin-2-il-etil)-1H-indola;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-karboksilne kiseline;

metil ester 5-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-5-okso-pentanojeve kiseline;

3-jodo-2-[5-(4-jodo-3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;

etil ester {2-[5-(4-etoksiisalil-3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-okso-octene kiseline;

terc-butil ester 5-bromo-2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne kiseline;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-etoksi-5H-pirol-2-il]-3-(2-pirolidin-2-il-etil)-1H-indola;

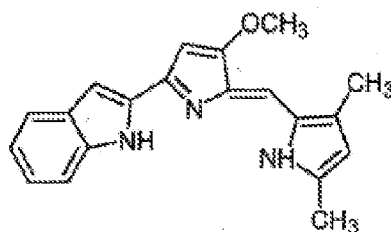
{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-(5-piridin-2-il-tiofen-2-il)-metanona;

1-{2-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-etanona;

{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-izoksazol-3-il-metanona;

2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-karbaldehida;
 {2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-furan-3-il-metanona;
 terc-butil ester 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-5-metoksi-indol-1-karboksilne
 kiseline;
 5 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-etoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;
 (2-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-etoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-etil)-dimetil-amina;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-3-(2-morfolin-4-il-etil)-1H-indola;
 2-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-etil)-dimetil-amina;
 10 2-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-5-(1H-indol-2-il)-2H-pirol-3-ola;
 {2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-il}-metanola;
 1-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-2-metil-propan-1-ona;
 ester tert-butil estera 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-4-il ugljične
 kiseline;
 15 ester tert-butil estera 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-4-il ugljične
 kiseline;
 dimetilamid 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne kiseline;
 2-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-etanola;
 {2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-fenil-metanona;
 20 3-{5-[5-(1H-indol-2-il)-3-metoksi-pirol-2-ilidenemetil]-2,4-dimetil-1H-pirol-3-il}-propan-1-ola;
 2,3-dihidroksi-propil ester 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne
 kiseline;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-5-fluoro-1H-indola;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-6-fluoro-1H-indola;
 25 6-kloro-2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indola;
 (3-hidroksi-propil)-amid 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-3-karboksilne
 kiseline;
 2-{5-[1-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-il)-etiliden]-4-metoksi-5H-pirol-2-il}-1H-indola;
 tert-butil ester 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne kiseline;
 30 2-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-5-(1H-indol-2-il)-2H-pirol-3-ol;
 etil ester [2-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-5-(1H-indol-2-il)-2H-pirol-3-iloksi]-octene kiseline;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-(3-metoksi-benziloksi)-5H-pirol-2-il]-1H-indola;
 (4-benziloksi-fenil)-amid 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne
 kiseline;
 35 (4-dimetilamino-fenil)-amid 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-karboksilne
 kiseline;
 (4-bromo-fenil)-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-metanona;
 4-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-ilmetil}-fenola;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-6-ola;
 40 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-4-ola;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-izopropoksi-5H-pirol-2-il]-1H-indol-4-ola;
 6-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-5H-[1,3]-dioksolo[4,5-f]indola;
 [2-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-5-(1H-indol-2-il)-2H-pirol-3-il]-(4-metoksi-fenil)-amina;
 2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-ilmetil ester 2,2-dimetil-propionske
 45 kiseline;
 {2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-ocetne kiseline;
 natrijeva sol estera mono-(2-{2-[5-(3,5-dimetil-1H-pirol-2-ilmetilen)-4-metoksi-5H-pirol-2-il]-indol-1-il}-etil)
 sumporne kiseline; te
 metil ester 3-{5-[5-(1H-indol-2-il)-3-metoksi-pirol-2-ilidenemetil]-2,4-dimetil-1H-pirol-3-il}-propionske kiseline;
 50 i njegove farmaceutske prihvatljive soli.

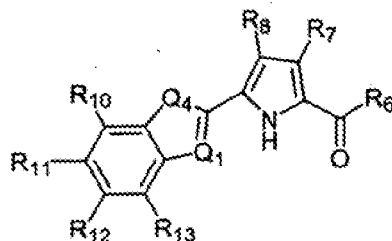
9. Spoj prema zahtjevu 1 **naznačen time** da ima formulo



ili njegove farmaceutske prihvatljive soli.

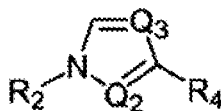
10. Spoj prema zahtjevu 9, **naznačen time**, da je farmaceutske prihvatljiva sol tartaratna ili meslatna sol.

11. Farmaceutski pripravak, **naznačen time**, da sadrži spoj prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 10, te farmaceutski prihvatljiv nosač ili prijenosnik.
12. Spoj prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 10 **naznačen time**, da je uporabu u postupku liječenja ljudskog ili životinjskog tijela.
- 5 13. Spoj prema bilo kojem zahtjevu od 1 do 10 **naznačen time**, da je uporabu kod liječenja karcinoma.
14. Spoj za uporabu prema zahtjevu 13, **naznačen time**, da se spoj koristi sa dodatnim kemoterapijskim sredstvom.
15. Postupak za dobivanje spoja formule (Ia) ili njegove farmaceutski prihvatljive soli prema zahtjevu 1, **naznačen time**, da sadrži kontaktiranje spoja formule II



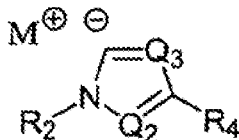
(II)

- 10 pri čemu Q₁, Q₄, R₅ do R₈ i R₁₀ do R₁₃ imaju značenja kako je navedeno u zahtjevu 1; sa spojem formule (iv)



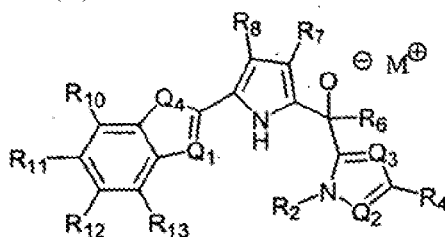
(iv)

- 15 pri čemu Q₂, Q₃, R₂ i R₄ predstavljaju, kako je navedeno u zahtjevu 1; u prisutnosti organskog otapala i protične kiseline, tijekom vremena i kod temperature koja je dovoljna da se dobije spoj formule (Ia) ili
- i) sa spojem formule (v)



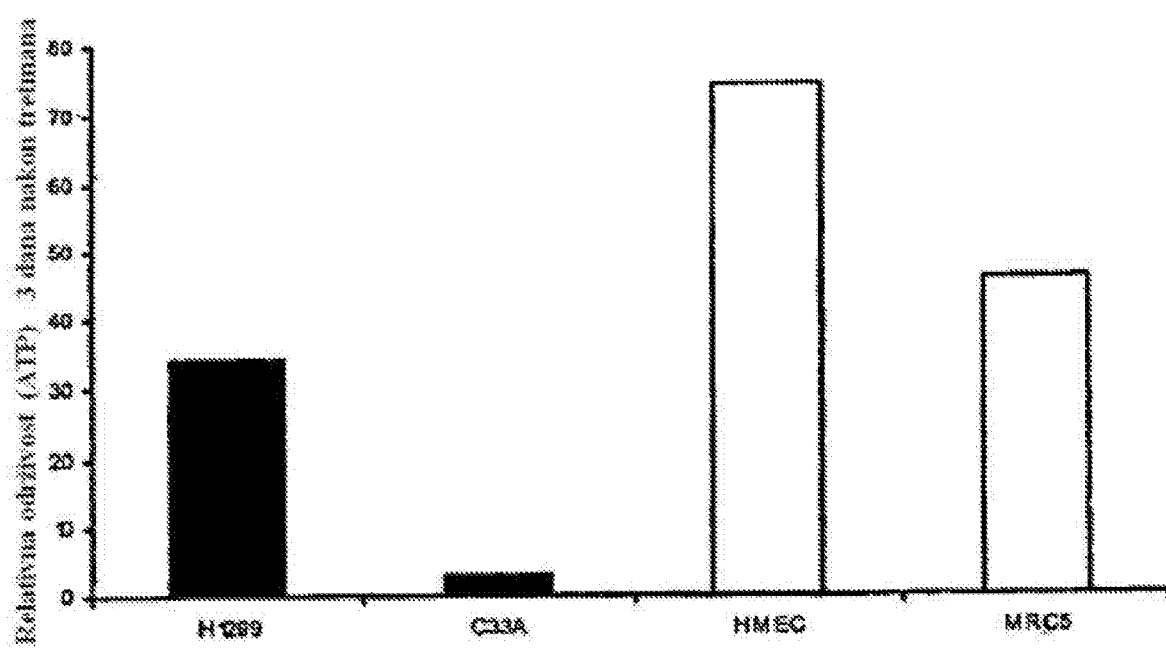
(v)

- 20 pri čemu M je Li, Na, K, Rb, ili Cs, i Q₂, Q₃, R₂ i R₄ imaju značenja kako je navedeno u zahtjevu 1; u prisutnosti u osnovi bezvodnog, aprotičnog organskog otapala, tijekom vremena i kod temperature koja je dovoljna da se dobije spoj formule (vi)

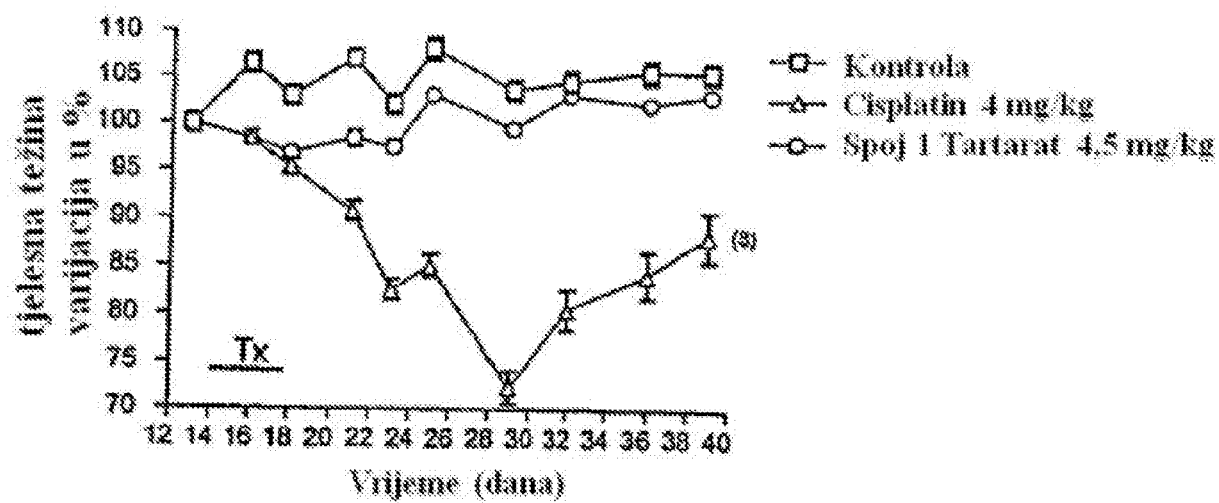


(vi)

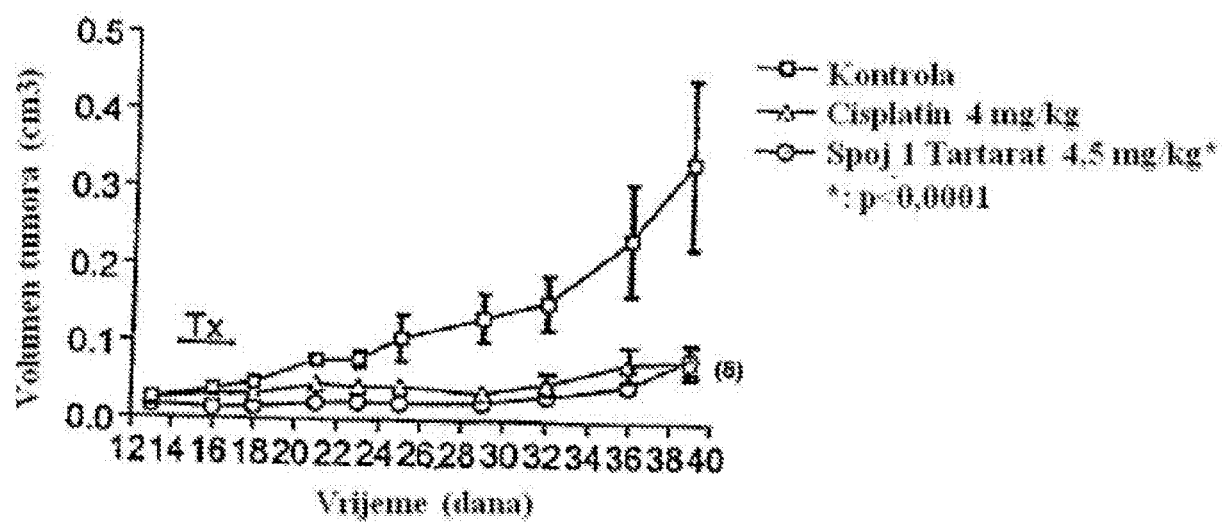
- 25 pri čemu M, Q₁ do Q₄, R₂, R₄, R₆ do R₈ i R₁₀ do R₁₃ imaju gore navedena značenja, te
- ii) protonaciju spoja formule (vi) sa H⁺ donorem tijekom vremena i kod temperature koja je dovoljna da se dobije spoj formule (Ia).
16. Postupak prema zahtjevu 15, **naznačen time** da je u postupku a) organsko otapalo alkohol.
17. Postupak prema zahtjevu 16, **naznačen time** da alkohol je metanol ili etanol.
18. Postupak prema bilo kojem zahtjevu od 15 do 17, **naznačen time** da je u postupku a) kiselina vodena otopina klorovodične kiseline ili vodena otopina bromovodične kiseline.
19. Postupak prema zahtjevu 15, **naznačen time**, da je u postupku b) aprotično otapalo tetrahidrofuran ili dietil eter.



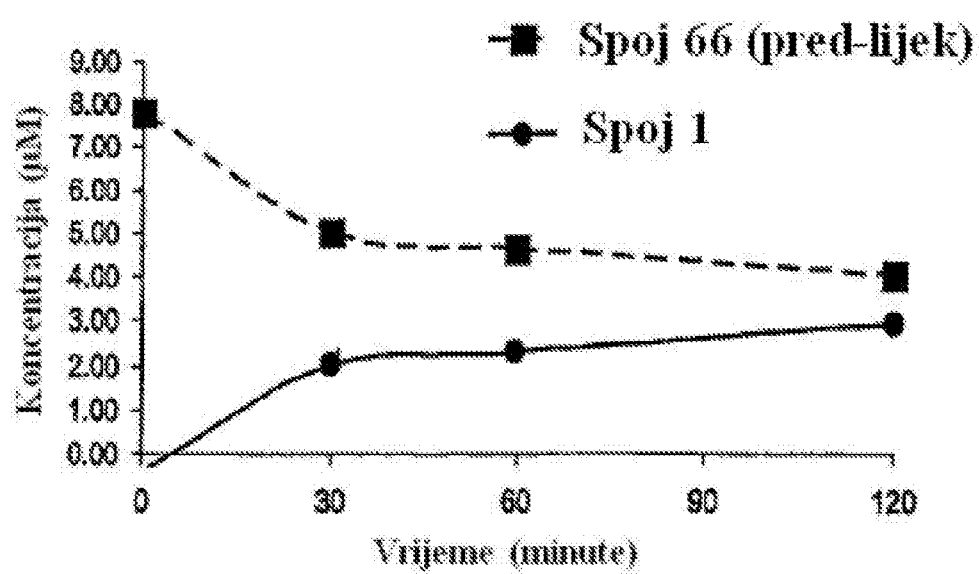
Slika 1



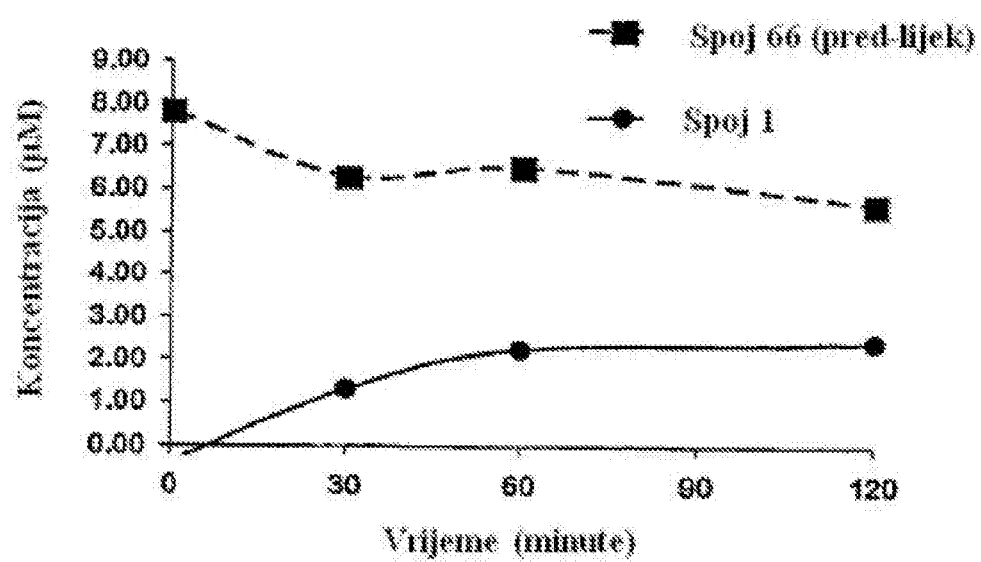
Slika 2



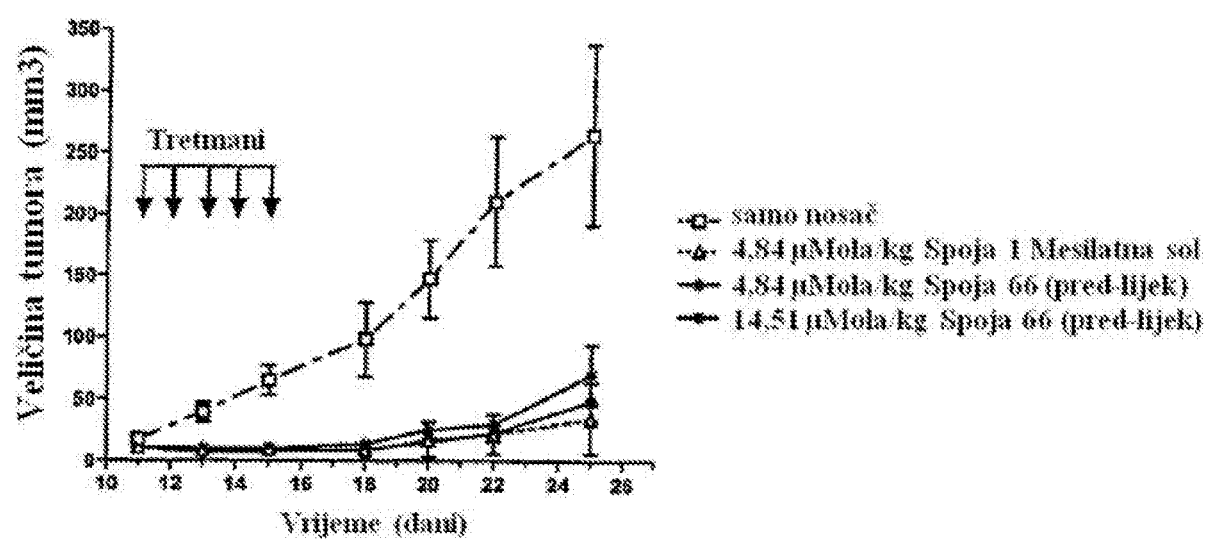
Slika 3



Slika 4



Slika 5



Slika 6