

(12)

PREVOD ZAHTEVKOV EVROPSKEGA PATENTA

(21) Številka predmeta: **201231274**

(51) Int. Cl. (2018.01)

(22) Datum prijave: **04.10.2012**

C07D 401/00 C07D 405/00
C07D 413/00 C07D 498/00
A61K 31/00 A61P 35/00

(46) Datum objave prevoda zahtevkov:

29.06.2018

(96) Evropska patentna prijava:

04.10.2012 EP 12766997.6

(30) Prednostna pravica:

06.10.2011 EP 11184061

(87) Objava mednarodne patentne prijave:

WO 2013/050438, 11.04.2013

(86) Mednarodna patentna prijava:

04.10.2012 WO PCT/EP2012/069562

(97) Objava evropskega patenta:

EP 2763982 B1, 10.01.2018

(72) Izumitelji: **HITCHCOCK Marion, 14129 Berlin, DE;**
MENGEL Anne, 13187 Berlin, DE;
PUTTER Vera, 10439 Berlin, DE;
SIEMEISTER Gerhard, 13503 Berlin, DE;
WENGNER Antje Margret, 13189 Berlin, DE;
BRIEM Hans, 10719 Berlin, DE;
EIS Knut, 13587 Berlin, DE;
SCHULZE Volker, 16562 Bergfelde, DE;
FERNANDEZ-MONTALVAN Amaury Ernesto, 10437 Berlin, DE;
PRECHTL Stefan, 10439 Berlin, DE;
HOLTON Simon, 12159 Berlin, DE;
FANGHANEL Jorg, 10405 Berlin, DE;
LIENAU Philip, 10967 Berlin, DE;
PREUSSE Cornelia, 13467 Berlin, DE;
GNOTH Mark Jean, 40822 Mettmann, DE

(73) Imetnika: **Bayer Pharma Aktiengesellschaft,**
Muellerstrasse 178, 13353 Berlin, DE;
Bayer Intellectual Property GmbH,
Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, DE

(74) Zastopnik: **MARK-INVENTA d.o.o., Glinška 14, 1000 Ljubljana, SI**

(54) **SUBSTITUIRANI BENZILINDAZOLI ZA UPORABO KOT INHIBITORJI BUB KINAZE V ZDRAVLJENJU
HIPERPROLIFERATIVNIH BOLEZNI**

Bayer Pharma Aktiengesellschaft
Müllerstrasse 178, 13353 Berlin, DE

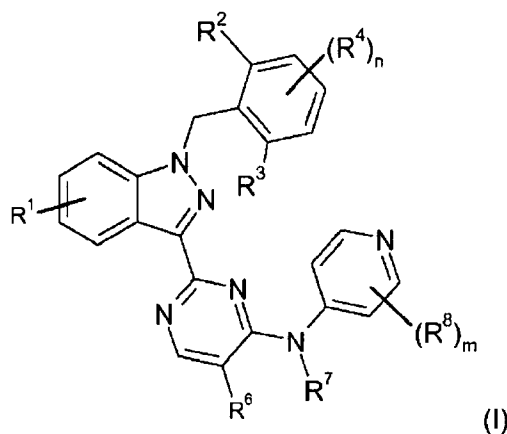
EP 2 763 982 B1
MIP – 9647 – SI

Bayer Intellectual Property GmbH
Alfred-Nobel-Strasse 10, 40789 Monheim, DE

Substituirani benzilindazoli za uporabo kot inhibitorji Bub kinaze
v zdravljenju hiperproliferativnih bolezni

Patentni zahtevki

1. Spojina s formulo (I)



v kateri

R^1 predstavlja vodik, halogen, 1-3C-alkil,

R^2/R^3 sta medsebojno neodvisno vodik, halogen, ciano, hidroksi 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, 1-6C-alkoksi,

R^4 je neodvisno vodik, hidroksi, halogen, ciano, NO_2 , 1-6C-alkil, 2-6C-alkenil, 2-6C-alkinil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-hidroksialkil, 1-6C-alkoksi, -O-(2-6C-alkilen)-O-C(O)-(1-6C-alkil), 1-6C-haloalkoksi, -C(O)OR⁹, -(1-6C-alkilen)-C(O)OR⁹, -C(O)-(1-6C-alkil), -C(O)NR¹⁰R¹¹, 3-7C-cikloalkil, -S-(1-6C-haloalkil), SF_5 , -SO₂NH-(3-7C-cikloalkil), -SO₂NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰R¹¹, heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, C(O)OR⁹, C(O)NR¹⁰R¹¹,

kjer lahko dva izmed R^2 , R^3 (R^4)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, z

ogljikovimi atomi na katere sta pripeta tvorita, heterociklični 5-, 6- ali 7-obroč,
ki vsebuje 1 ali 2 heteroatome izbrane izmed O ali N in neobvezno vsebuje
dodatno dvojno vez in/ali je neobvezno substituiran s skupino okso (=O) in/ali
skupino 1-4C-alkil,

n je od 0 do 3

R^6 je (a) vodik;

(b) hidroksi;

(c) ciano;

(d) 1-6C-alkoksi neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat z

(d1) OH,

(d2) -O-(1-6C-alkil),

(d3) C(O)OR⁹,

(d4) C(O)NR¹⁰R¹¹,

(d5) NR¹⁰R¹¹,

(d6) -S-(1-6C-alkil),

(d7) -S(O)-(1-6C-alkil),

(d8) -SO₂-(1-6C-alkil),

(d9) SO₂NR¹⁰R¹¹,

(d10) heterociklil, ki je neobvezno substituiran s C(O)OR⁹ ali
okso (=O),

(d11) heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat
ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi,
C(O)OR⁹, C(O)NR¹⁰R¹¹, (1-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil),

(e) SO₂NR¹⁰R¹¹,

(f) 3-7C-cikloalkoksi,

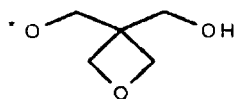
(g) 1-6C-haloalkoksi,

(h) COOR⁹,

(i) -C(O)NR¹⁰R¹¹,

(j) -O-heteroaril neobvezno substituiran s CN,

(k)

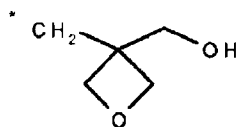


kjer je * točka pripetja,

(l) -O-(2-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil), ki je neobvezno substituiran s hidroksi, $\text{NH}(\text{CO})\text{OR}^9$,

R^7 je

- (a) vodik,
- (b) 1-6C-alkil, ki je neobvezno substituiran s heteroarilom,
- (c) 1-6C-haloalkil,
- (d) 1-6C-hidroksialkil,
- (e)



kjer je * točka pripetja,

- (f) -C(O)-(1-6C-alkil),
- (g) -C(O)-(1-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil),
- (h) -C(O)-(1-6C-alkilen)-O-(2-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil),
- (i) -C(O)-heterociklil,
- (j) benzil, kjer je fenilni obroč neobvezno substituiran z od 1 do 5 substituenti, neodvisno izbranimi iz skupine, ki vsebuje vodik, halogen, 1-4C-alkil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-alkoksi, 1-4C-haloalkoksi, ciano, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$,
- (k) heteroaril

ali

neobvezno, R^6 in R^7 skupaj z dušikovim atomom na katerega je pripet R^7 tvorita 6-členski obroč, ki lahko vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S, N,

in, ki je neobvezno substituiran s (1-6C-alkil)-OH, (1-6C-alkil)- $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

R^8 je vodik, halogen, hidroksi, ciano, 1-6C-alkil, 1-6C-hidroksialkil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

m je od 0 do 4

R^9 je (a) vodik,

(b) 1-6C-alkil, ki je neobvezno substituiran s hidroksi,

R^{10} , R^{11} sta medsebojno neodvisno vodik, 1-4C-alkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-alkoksi, $-(CO)-(1-6C-alkil)$, CHO, COOR⁹, ali

skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 4-6-členski heterociklični obroč, ki neobvezno vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S ali N in, ki je neobvezno substituiran s 1-2 fluorovimi atomi ali COOR⁹,

ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

2. Spojina s formulo (I) po zahtevku 1,

kjer

R^1 predstavlja vodik, halogen, 1-3C-alkil,

R^2/R^3 sta medsebojno neodvisno vodik, halogen, ciano, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi,

R^4 je neodvisno vodik, halogen, ciano, 1-6C-alkil, 2-6C-alkenil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-hidroksialkil, 1-6C-alkoksi, 1-6C-haloalkoksi, $-C(O)OR^9$, $-(1-6C-alkilen)-C(O)OR^9$, $-C(O)-(1-6C-alkil)$, $-C(O)NR^{10}R^{11}$, 3-7C-cikloalkil, - S-(1-6C-haloalkil), SF₅, $-SO_2NH-(3-7-cikloalkil)$, $-SO_2NR^{10}R^{11}$, heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, $C(O)OR^9$, $C(O)NR^{10}R^{11}$,

kjer lahko dva izmed R^2 , R^3 (R^4)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, z ogljikovimi atomi na katere sta pripeta tvorita, heterociklični 5-, 6- ali 7-obroč, ki vsebuje 1 ali 2 heteroatome izbrane izmed O ali N, in neobvezno dodatno dvojno vez in/ali karbonilno skupino in/ali skupino 1-4C-alkil,

n je od 0 do 3

R^6 je (a) vodik;

(b) hidroksi;

(c) ciano;

(d) 1-6C-alkoksi neobvezno substituiran z

(d1) 1-2 OH,

(d2) $NR^{10}R^{11}$,

(d3) $SO_2NR^{10}R^{11}$,

(d4) heterociklil,

(d5) heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, $C(O)OR^9$, $C(O)NR^{10}R^{11}$,

(e) $SO_2NR^{10}R^{11}$, ;

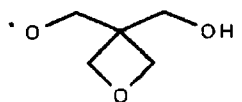
(f) 3-7C-cikloalkoksi,

(g) 1-6C-haloalkoksi,

(h) $-C(O)NR^{10}R^{11}$,

(i) -O-heteroaril neobvezno substituiran s CN,

(j)



kjer je * točka pripetja,

R^7 je

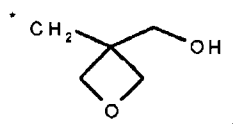
(a) vodik,

(b) 1-6C-alkil, ki je neobvezno substituiran s heteroaril,

(c) 1-6C-haloalkil,

(d) 1-6C-hidroksialkil,

(e)



kjer je * točka pripetja,

(f) $-C(O)-(1-6C-alkil)$,

(g) $-C(O)-(1-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil)$,

(h) $-C(O)-(1-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkilen)-O-(1-6C-alkil)$,

(i) $-C(O)$ -heterociklil,

(j) benzil, kjer je fenilni obroč neobvezno substituiran z 1-5 substituenti neodvisno izbranimi iz skupine, ki vsebuje vodik, halogen, 1-4C-alkil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-alkoksi, 1-4C-haloalkoksi, ciano, $C(O)OR^9$,

(k) heteroaril,

ali

neobvezno R^6 in R^7 skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 6-členski obroč, ki lahko vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S, N in, ki je neobvezno substituiran s hidroksi-(1-6alkil),

R^8 je vodik, halogen, ciano, 1-6C-haloalkil, 1-6C-haloalkoksi, $C(O)OR^9$, $C(O)NR^{10}R^{11}$,

m je od 0 do 4

R^9 je (a) vodik,

(b) 1-6C-alkil, ki je neobvezno lahko substituiran s hidroksi,

R^{10} , R^{11} sta medsebojno neodvisno vodik, 1-4C-alkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-alkoksi ali skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 5-6-členski heterociklični obroč, ki neobvezno vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S ali N, ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

3. Spojina s formulo (I) po zahtevku 1,

kjer

R^1 predstavlja vodik, halogen, 1-3C-alkil,

R^2/R^3 sta medsebojno neodvisno vodik, halogen, ciano, hidroksi, 1-3C-haloalkil, 1-3C-haloalkoksi, 1-3C-alkoksi,

R^4 je neodvisno vodik, hidroksi, halogen, ciano, NO_2 , 1-3C-alkil, 2-3C-alkenil, 2-3C-alkinil, 1-3C-haloalkil, 1-3C-hidroksialkil, 1-3C-alkoksi, -O-(2-3C-alkilen)-O-C(O)-(1-3C-alkil), 1-3C-haloalkoksi, -C(O)OR⁹, -(1-3C-alkilen)-C(O)OR⁹, -C(O)-(1-3C-alkil), -C(O)NR¹⁰R¹¹, 3-7C-cikloalkil, -S-(1-3C-haloalkil), SF_5 , -SO₂NH-(3-7C-cikloalkil), -SO₂NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰R¹¹, heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-3C-alkil, 1-3C-haloalkil, 1-3C-haloalkoksi, $C(O)OR^9$, $C(O)NR^{10}R^{11}$,

kjer lahko dva izmed R^2 , R^3 (R^4)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, z ogljikovimi atomi na katere sta pripeta tvorita heterociklični 5-, 6- ali 7-obroč, ki vsebuje 1 ali 2 heteroatome izbrane izmed O ali N in neobvezno vsebuje

dodatno dvojno vez in/ali neobvezno substituiran s skupino okso (=O) in/ali an skupino 1-3C-alkil,

n je od 0 do 3

R^6 je (a) vodik;

(b) hidroksi;

(c) ciano;

(d) 1-6C-alkoksi neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat z

(d1) OH,

(d2) -O-(1-3C-alkil),

(d3) $C(O)OR^9$,

(d4) $C(O)NR^{10}R^{11}$,

(d5) $NR^{10}R^{11}$,

(d6) -S-(1-3C-alkil),

(d7) -S(O)-(1-3C-alkil),

(d8) -SO₂-(1-3C-alkil),

(d9) SO₂NR¹⁰R¹¹,

(d10) heterociklil, ki je neobvezno substituiran s $C(O)OR^9$ ali okso (=O),

(d11) heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-3C-alkil, 1-3C-haloalkil, 1-3C-haloalkoksi, $C(O)OR^9$, $C(O)NR^{10}R^{11}$, (1-3C-alkilen)-O-(1-3C-alkil),

(e) SO₂NR¹⁰R¹¹,

(f) 3-7C-cikloalkoksi,

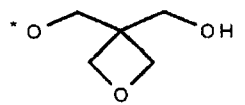
(g) 1-6C-haloalkoksi,

(h) COOR⁹,

(i) -C(O)NR¹⁰R¹¹,

(j) -O-heteroaril neobvezno substituiran s CN,

(k)



kjer je * točka pripetja,

(I) -O-(2-3C-alkilen)-O-(1-3C-alkil), ki je neobvezno substituiran s hidroksi, $\text{NH}(\text{CO})\text{OR}^9$,

R^7 je

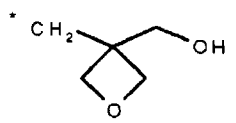
(a) vodik,

(b) 1-3C-alkil, ki je neobvezno substituiran s heteroaril

(c) 1-3C-haloalkil,

(d) 1-3C-hidroksialkil,

(e)



kjer je * točka pripetja,

(f) -C(O)-(1-3C-alkil),

(g) -C(O)-(1-3C-alkilen)-O-(1-3C-alkil),

(h) -C(O)-(1-3C-alkilen)-O-(2-3C-alkilen)-O-(1-3C-alkil),

(i) -C(O)-heterociklil,

(j) benzil, kjer je fenilni obroč neobvezno substituiran z od 1 do 5 substituenti neodvisno izbranimi iz skupine, ki vsebuje vodik, halogen, 1-4C-alkil, 1-4C-alkoksi, 1-4C-haloalkoksi, ciano, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$, (k) heteroaril

ali

neobvezno, R^6 in R^7 skupaj z dušikovim atomom na katerega je pripet R^7 tvorita 6-členski obroč, ki lahko vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S, N, in, ki je neobvezno substituiran s (1-3C-alkil)-OH, (1-3C-alkil)- $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

R^8 je vodik, halogen, hidroksi, ciano, 1-3C-alkil, 1-3C-hidroksialkil, 1-3C-haloalkil, 1-3C-haloalkoksi, $\text{C}(\text{O})\text{OR}^9$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,

m je od 0 do 4

R^9 je (a) vodik,

(b) 1-3C-alkil, ki je neobvezno substituiran s hidroksi,

R^{10} , R^{11} sta medsebojno neodvisno vodik, 1-3C-alkil, 1-3C-hidroksialkil, 1-3C-alkoksi, $-(\text{CO})-(1-3\text{C-alkil})$, CHO, COOR^9 ali

skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 4-6-členski heterociklični obroč, ki neobvezno vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S ali N, ki je neobvezno substituiran z 1-2 fluorovimi atomi ali COOR⁹, ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

4. Spojina s formulo (I) po zahtevku 1,

v kateri

R¹ je vodik, 1-3C-alkil,

R²/R³ sta medsebojno neodvisno vodik, halogen, ciano, hidroksi, 1-4C-haloalkil, 1-4C-alkoksi,

R⁴ je neodvisno vodik, hidroksi, halogen, ciano, 1-4C-alkil, 2-4C-alkenil, 2-4C-alkinil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-alkoksi, -O-(2-4C-alkilen)-O-C(O)-(1-4C-alkil), 1-4C-haloalkoksi, -C(O)OR⁹, -(1-4C-alkilen)-C(O)OR⁹, -C(O)-(1-4C-alkil), -C(O)NR¹⁰R¹¹, 3-7C-cikloalkil, -S-(1-4C-haloalkil), SF₅, -SO₂NH-(3-7C-cikloalkil), -SO₂NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰R¹¹, heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-haloalkoksi, C(O)OR⁹, C(O)NR¹⁰R¹¹,

kjer lahko dva izmed R², R³ (R⁴)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, z ogljikovimi atomi na katere sta pripeta tvorita, heterociklični 5-, 6- ali 7-obroč, ki vsebuje 1 ali 2 heteroatome izbrane izmed O ali N in neobvezno vsebuje dodatno dvojno vez in/ali neobvezno substituiran s skupino okso (=O) in/ali s skupino 1-4C-alkil,

n je od 0 do 3

R⁶ je (a) vodik;

(b) hidroksi;

(d) 1-4C-alkoksi neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat z

(d1) OH,

(d2) -O-(1-4C-alkil),

(d3) C(O)OR⁹,

(d4) C(O)NR¹⁰R¹¹,

- (d5) $\text{NR}^{10}\text{R}^{11}$,
- (d6) -S-(1-4C-alkil),
- (d7) -S(O)-(1-4C-alkil),
- (d8) -SO₂-(1-4C-alkil),
- (d9) SO₂NR¹⁰R¹¹,
- (d10) heterociklil, ki je neobvezno substituiran s C(O)OR⁹ ali okso (=O),
- (d11) heteroaril, ki je neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat s ciano, 1-4C-alkil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-haloalkoksi, C(O)OR⁹, C(O)NR¹⁰R¹¹, (1-4C-alkilen)-O-(1-4C-alkil),

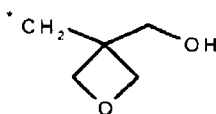
- (e) SO₂NR¹⁰R¹¹,
- (f) 3-7C-cikloalkoksi,
- (g) 1-6C-haloalkoksi,
- (h) COOR⁹,
- (i) -C(O)NR¹⁰R¹¹,
- (j) -O-heteroaril neobvezno substituiran s CN,
- (k)



kjer je * točka pripetja,

- (I) -O-(2-4C-alkilen)-O-(1-4C-alkil), ki je neobvezno substituiran s hidroksi, NH(CO)OR⁹,
- R⁷ je

- (a) vodik,
- (b) (1-4C-alkil)-heteroaril,
- (c) 1-4C-haloalkil,
- (d) 1-4C-hidroksialkil,
- (e)



kjer je * točka pripetja,

- (f) -C(O)-(1-4C-alkil),
- (g) -C(O)-(1-4C-alkilen)-O-(1-4C-alkil),
- (h) -C(O)-(1-4C-alkilen)-O-(2-4C-alkilen)-O-(1-4C-alkil),
- (i) -C(O)-heterociklil,
- (j) benzil, kjer je fenilni obroč neobvezno substituiran z od 1 do 5 substituenti neodvisno izbranimi iz skupine, ki vsebuje vodik, halogen, 1-4C-alkil, 1-4C-alkoksi, 1-4C-haloalkoksi, ciano, C(O)OR⁹,
- (k) heteroaril
- ali

neobvezno, R⁶ in R⁷ skupaj z dušikovim atomom na katerega je pripet R⁷ tvorita 6-členski obroč, ki lahko vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S, N,

in, ki je neobvezno substituiran s (1-4C-alkil)-OH, (1-4C-alkil)-NR¹⁰R¹¹,

R⁸ je vodik, halogen, hidroksi, ciano, C(O)NR¹⁰R¹¹, 1-4C-alkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-haloalkil, 1-4C-haloalkoksi,

m je od 0 do 2,

R⁹ je vodik, 1-4C-alkil, ki je neobvezno substituiran s hidroksi,

R¹⁰, R¹¹ sta medsebojno neodvisno vodik, 1-4C-alkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-alkoksi, -C(O)-(1-4C-alkil) ali COOR⁹ ali skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 4-6-členski heterociklični obroč, ki neobvezno vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S ali N, ki je neobvezno substituiran z od 1 do 2 fluorovimi atomi ali COOR⁹, ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

5. Spojina s formulo (I) po zahtevku 1,

kjer,

R¹ predstavlja vodik,

R²/R³ je neodvisno vodik, fluor, klor, brom, ciano, hidroksi, CF₃, -O-CH₃ ali -O-CH₂-CF₃,

R⁴ je medsebojno neodvisno vodik, fluor, klor, brom ali jod, ciano, NO₂, hidroksi, -CH₃, -C₃H₇, ciklopropil, 1-propenil, -C=CH, -CF₃, -CH₂-OH, -CH₂-

CH₂-OH, -C(CH₃)₂-OH, -CH₂-C(CH₃)₂-OH, -C(CH₃)₂-CH₂-OH, -OCH₃, -O-CH₂-CH₃, -OCF₃, -OCF₂H, -OCH₂CF₃, -O-(CH₂)₂-O-C(O)-CH₃, -C(O)CH₃, -COOH, -C(O)OCH₃, -C(O)OC₂H₅, -C(O)OC(CH₃)₃, -CH₂-COOH, -CH₂-COOC₂H₅, -C(CH₃)₂-COOC₂H₅, -C(O)NH₂, -C(O)NH(CH₃), -C(O)N(CH₃)₂, -C(O)NH-(CH₂)₂-OH, -C(O)-(N-morfolinil), -SO₂-NH-ciklopropil, -SO₂-(N-morfolino), NH₂, NH-C(O)(CH₃), 5-metil-oksa-diazol-3-il, N-pirolil, N-pirazolil, -S-CF₃, SF₅, kjer dva izmed R², R³ (R⁴)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, skupaj tvorita -O-CH₂-CH₂-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-, -(CH₃)C=CH-(C=O)-O-, -CH₂-(C=O)-O-, -(CH₂)₂-(C=O)-NH-, ki skupaj z dvema ogljikovima atomoma na katera sta pripeta tvorijo 5-, 6- ali 7-členski obroč,

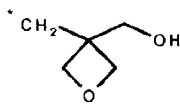
n je 0, 1, 2, 3,

R⁶ je vodik, hidroksi, ciano, -O-ciklopropil, -OCH₃, -OCF₃, -OCF₂H, -OCH₂CF₃, -O-(CH₂)₂-OH, -O-(CH₂)₂-NH₂, -O(CH₂)₂-N(CH₃)₂, -O-(CH₂)₂-O-CH₃, -O-(CH₂)₂-O-(CH₂)₂-OH, -O-CH₂-CH(OH)-CH₂OH, -O-CH₂-CH(OH)-CH₂-NH-C(O)OC(CH₃)₃, -O-CH₂-COOH, -O-CH₂-COOC₂H₅, C(O)NH₂, -O-CH₂-C(O)-(3-fluoro-N-azetidin), -O-CH₂-C(O)-(3,3-difluoro-N-azetidin), -O-CH₂-CH(OH)-CH₂-N-piperidinil, -O-(CH₂)₂(morfolin-4-il), -O-CH₂-(morfolin-2-il), -O-CH₂-(morfolin-2-il-4-tert.-butoksikarboksilat), -O-CH₂-(pirolidin-2-on-5-il), -O-(CH₂)₂-S-CH₃, -O-(CH₂)₂-SO-CH₃, -O-(CH₂)₂-SO₂-CH₂, -O-CH₂-SO₂NH₂, -SO₂-CH(CH₃)₂,



kjer je * točka pripetja, -O-(CH₂)₂-tetrazolil, -O-CH₂-tetrazolil, -O-piridin-4-il, -O-(3-cianopiridin-4-il) ali -O-CH₂-(oksadiazol)-CH₂-O-CH₃,

R⁷ je vodik, metil, difluorometil, hidroksietil,



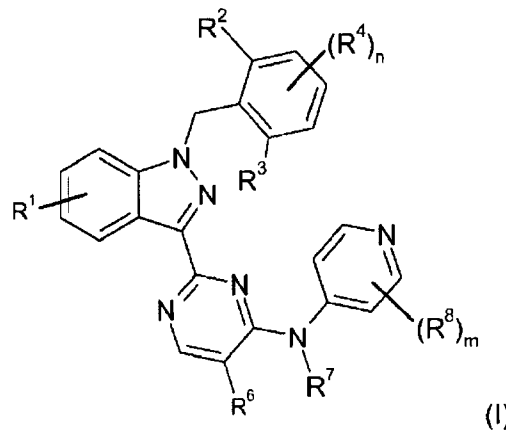
kjer je * točka pripetja, -(CH₂)₂-tetrazolil, piridin-4-il, -C(O)-tetrahidropiran-4-il, -C(O)-CH₂-O-CH₃, -C(O)-CH₃, -C(O)CH₂-O-(CH₂)₂-O-CH₃, C(O)OCH₂-CH=CH₂ ali benzil, ki je neobvezno substituiran, enkrat ali večkrat s fluorom, klorom, bromom, ciano, metilom, difluorometilom, metoksi, etoksi, difluormetoksi, trifluormetoksi, -O-CH₂-CF₃, -C(O)OCH₃, ali

neobvezno, R^6 in R^7 skupaj z duškovim atomom na katerega je pripet R^7 tvorita 6-členski obroč, ki lahko vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O, S, N in, ki je poleg tega neobvezno substituiran s $-\text{CH}_2\text{-OH}$ ali $-\text{CH}_2\text{-NH-CHO}$,

R^8 je vodik, fluor, hidroksi, ciano, CH_3 , CF_3 , $\text{CH}_2\text{-OH}$, OCH_3 , C(O)OH , C(O)OCH_3 , $\text{C(O)OC}_2\text{H}_5$, $\text{C(O)O(CH}_2)_2\text{-OH}$, C(O)NH_2 , C(O)NHCH_3 ,
m je 0, 1 ali 2

ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

6. Spojina s formulo (I)



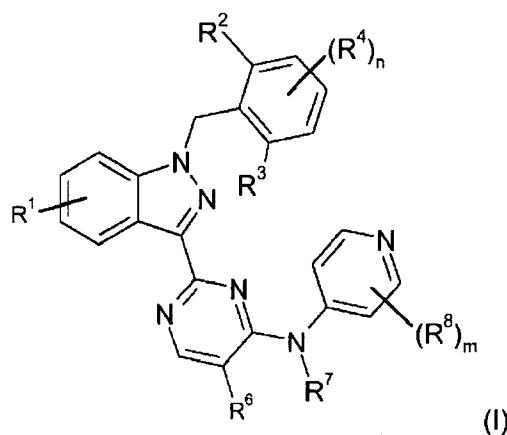
v kateri

R^1 , R^2 , R^3 , n, R^6 , R^7 , R^8 in m pomenijo, kot je opisano v zahtevku 5, in
 R^4 je medsebojno vodik, fluor, klor, brom ali jod, ciano, NO_2 , hidroksi, $-\text{CH}_3$, $-\text{C}_3\text{H}_7$, ciklopropil, 1-propenil, $-\text{C}=\text{CH}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{CH}_2\text{-OH}$, $-\text{CH}_2\text{-CH}_2\text{-OH}$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-OH}$, $-\text{CH}_2\text{-C}(\text{CH}_3)_2\text{-OH}$, $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{-CH}_2\text{-OH}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{O-CH}_2\text{-CH}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCF}_2\text{H}$, $-\text{OCH}_2\text{CF}_3$, $-\text{O-(CH}_2)_2\text{-O-C(O)-CH}_3$, $-\text{C(O)CH}_3$, $-\text{COOH}$, $-\text{C(O)OCH}_3$, $-\text{C(O)OC}_2\text{H}_5$, $-\text{C(O)OC(CH}_3)_3$, $-\text{CH}_2\text{-COOH}$, $-\text{CH}_2\text{-COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{C(CH}_3)_2\text{-COOC}_2\text{H}_5$, $-\text{C(O)NH}_2$, $-\text{C(O)NH(CH}_3)_2$, $-\text{C(O)N(CH}_3)_2$, $-\text{C(O)NH-(CH}_2)_2\text{-OH}$, $-\text{C(O)-(N-morfolinil)}$, $-\text{SO}_2\text{-NH-ciklopropil}$, $-\text{SO}_2\text{-(N-morfolino)}$, NH_2 , $\text{NH-C(O)(CH}_3)$, 5-metil-oksa-diazol-3-il, N-pirolil, N-pirazolil, in $-\text{S-CF}_3$, SF_5 ,

kjer je omenjena skupina neobvezno substituirana, enkrat ali večkrat, enako ali različno, s substituentom izbranim iz skupine, ki vsebuje: hidroksi, halogen,

ciano, 1-6C-alkil, 1-4C-haloalkil, in 1-6C-alkoksi,
 kjer dva izmed R^2 , R^3 (R^4)_n, kadar sta na medsebojnem položaju orto, skupaj
 tvorita -O-CH₂-CH₂-CH₂-O-, -O-CH₂-CH₂-, -(CH₃)C=CH-(C=O)-O-, -CH₂-
 (C=O)-O-, -(CH₂)₂-(C=O)-NH-, ki skupaj z dvema ogljikovima atomoma na
 katera so pripeti tvorita 5-, 6- ali 7-členski obroč,
 al N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega
 N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

7. Spojina s formulo (I)



v kateri

R^1 , R^2 , R^3 , n , R^6 , R^7 , R^8 in m pomenijo, kot je opisano v zahtevku 5, in
 R^4 je izbran iz skupine, ki vsebuje vodik, halogen, ciano, 1-3C-alkil, 3-6C-
 cikloalkil, 2-3C-alkenil, 1-3C-haloalkil, 1-3C-hidroksialkil, 1-3C-alkoksi, 1-3C-
 haloalkoksi, -C(O)-(1-3C-alkil), COOH, (1-3C-alkilen)-COOH, -(1-3C-alkilen)-
 COO-(1-3C-alkil), -COO-(1-4C-alkil), -C(O)NH₂, -C(O)NH(1-3C-alkil),
 -C(O)N(1-3C-alkil)₂, -C(O)NH-(1-3C-alkil)-OH, -C(O)-(N-heterociklil), -SO₂-
 NH-(3-6C-cikloalkil), -SO₂-(N-heterociklil),

kjer je omenjena skupina neobvezno substituirana, enkrat ali večkrat, enako ali
 različno, s substituentom izbranim iz skupine, ki vsebuje:

hidroksi, halogen, ciano, 1-6C-alkil, 1-4C-haloalkil, in 1-6C-alkoksi,

ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega
 N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

8. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer R^1 predstavlja vodik.
9. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer, sta R^2 in R^3 halogen, še posebej fluor, klor ali brom, prednostno fluor ali klor.
10. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer je R^4 neodvisno 1-6C-alkil, 1-6C-hidroksialkil, 1-6C-alkoksi, -O-(2-6C-alkilen)-O-C(O)-(1-6C-alkil), 1-6C-haloalkoksi ali 3-7C-cikloalkil.
11. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer, je R^4 neodvisno 1-4C-alkil, 1-4C-hidroksialkil, 1-4C-alkoksi, -O-(2-4C-alkilen)-O-C(O)-(1-4C-alkil), 1-4C-haloalkoksi ali 3-7C-cikloalkil.
12. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer je R^4 izbran iz skupine, ki vsebuje 1-3C-alkil, 3-6C-cikloalkil, 1-3C-hidroksialkil, 1-3C-alkoksi, 1-3C-haloalkoksi.
13. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer je n enako 1.
14. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer R^6 predstavlja
(d) 1-6C-alkoksi neobvezno substituiran neodvisno, enkrat ali večkrat z
(d1) OH,
(d5) $NR^{10}R^{11}$.
15. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer R^6 predstavlja
-O(1-3C-alkil), -O(1-3C-haloalkil), -O(1-3C-alkilen neobvezno substituiran s skupino hidroksi)-OH ali -O(1-3C-alkilen neobvezno substituiran s skupino hidroksi)- $NR^{10}R^{11}$, prednostno 1-3C-alkoksi, -O-(1-3C-alkilen)-OH, -O-(1-3C-alkilen)- NH_2 , -O-(1-3C-alkilen)-NH(1-3C-alkil) ali -O-(1-3C-alkilen)-N(1-3C-alkil)₂.
16. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer je R^7 vodik.

17. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 4, kjer je R⁸ halogen, 1-6C-alkil ali 1-6C-haloalkil.
18. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer je R⁸ fluor, 1-3C-alkil, 1-3C-haloalkil.
19. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer je m enako 0, 1 ali 2.
20. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, kjer sta R¹⁰, R¹¹, medsebojno neodvisno, vodik, 1-4C-alkil ali skupaj z dušikovim atomom na katerega sta pripeta tvorita 4-6-členski heterociklični obroč, ki neobvezno vsebuje en dodatni heteroatom, izbran iz skupine, ki vsebuje O ali N in, ki je neobvezno substituiran z 1-2 halogenimi atomi, še posebej fluorovimi atomi.
21. Spojina s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 5, ki je izbrana iz skupine, ki vsebuje:
 - 2-[1-(6-kloro-2-fluoro-3-metilbenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - 2-[1-(6-kloro-2-fluoro-3-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - 5-metoksi-2-{1-[3-(5-metil-1,2,4-oksadiazol-3-il)benzil]-1H-indazol-3-il}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - 2-[1-(2-kloro-4,5-dimetilbenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - 5-metoksi-2-{1-[4-(pentafluoro-λ⁶-sulfanil)benzil]-1H-indazol-3-il}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - 2-[1-(2,6-difluoro-3-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 - N-(2,6-difluoro-3-metoksibenzil)-2-[1-(2,6-difluoro-3-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

2-{1-[(6-bromo-1,3-benzodioxol-5-il)metil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzonitril,
 2-[1-(2-kloro-4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-6-ilmetil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(2,6-difluorobenzil)-2-[1-(2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-(1-{3-[(trifluorometil)sulfanil]benzil}-1H-indazol-3-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2,3-difluoro-4-metilbenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(2,3-difluoro-4-metilbenzil)-2-[1-(2,3-difluoro-4-metilbenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-2-{1-[4-(1H-pirazol-1-il)benzil]-1H-indazol-3-il}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin
 2-[1-(2,6-diklorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(2,6-diklorobenzil)-2-[1-(2,6-diklorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-(1-{4-[(trifluorometil)sulfanil]benzil}-1H-indazol-3-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-klorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

N-(2-klorobenzil)-2-[1-(2-klorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 metil 3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzoat,
 metil 3-kloro-4-{{(2-{1-[2-kloro-4-(metoksikarbonil)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksipirimidin-4-il)(piridin-4-il)amino}metil}benzoat,
 2-[1-(4-bromo-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-kloro-4-fluoro-3-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,3-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(4-etoksi-2,3-difluorobenzil)-2-[1-(4-etoksi-2,3-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-{1-[2,3,5,6-tetrafluoro-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-N-[2,3,5,6-tetrafluoro-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)benzil]-2-{1-[2,3,5,6-tetrafluoro-4-(2,2,2-trifluoroetoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}pirimidin-4-amin,
 metil 2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzoat,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-[1-(2,4,6-trifluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-N-(2,4,6-trifluorobenzil)-2-[1-(2,4,6-trifluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin
 2-[1-(2,4-diklorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-fluoro-4-jodobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

2-[1-(2-bromobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(2-bromobenzil)-2-[1-(2-bromobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 [3-fluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]ocetna kislina,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-[1-(2,3,5,6-tetrafluoro-4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-2-[1-(4-propilbenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-{1-[2,6-dikloro-4-(trifluorometoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-[2,6-dikloro-4-(trifluorometoksi)benzil]-2-{1-[2,6-dikloro-4-(trifluorometoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 7-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-3,4-dihidrokinolin-2(1H)-on,
 2-[1-(2-kloro-4-jodobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(3,5-dimetoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-{1-[2-kloro-6-(trifluorometil)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-kloro-5-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 7-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-4-metil-2H-kromen-2-on,
 3-fluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzonitril,
 4-{{2-[1-(4-ciano-2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}(piridin-4-il)amino}metil}-3-fluorobenzonitril,

2-{1-[2,6-dikloro-3-(trifluorometil)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 etil [3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]acetat,
 2-[1-(4-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-ciklopropil-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzenesulfonamid,
 6-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-1-benzofuran-2(3H)-on,
 2-{1-[4-(difluorometoksi)-2,6-difluorobenzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 tert-butil 3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzoat,
 etil 2-[3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]-2-metilpropanoat,
 4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzonitril,
 5-metoksi-2-{1-[4-(morfolin-4-ilsulfonil)benzil]-1H-indazol-3-il}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2,6-dikloro-3-nitrobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzonitril,
 N-[4-(difluorometoksi)-2,6-difluorobenzil]-2-{1-[4-(difluorometoksi)-2,6-difluorobenzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-N-(piridin-4-il)-2-{1-[3-(1H-pirol-1-il)benzil]-1H-indazol-3-il}pirimidin-4-amin,
 3,5-difluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzonitril
 5-metoksi-2-{1-[2-metoksi-4-(trifluorometil)benzil]-1H-indazol-3-il}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

- 2-[1-(2,6-difluoro-3-metilbenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
- 2-[1-(2-fluoro-6-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
- 3,5-difluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzamid,
- 2-[3,5-difluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenoksi]etil acetat,
- 2-[1-(2,6-difluoro-4-propoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
- 2-[1-(4-etoksi-2-fluoro-6-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
- 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-ol
- 2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-ol,
- 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-ol,
- 2-[1-(4-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-ol,
- {3-[(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]oksetan-3-il}metanol,
- {3-[(2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]oksetan-3-il}metanol,
- (3-{[(2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-{3-(hidroksimetil)oksetan-3-il}metoksi}pirimidin-4-il)(piridin-4-il)amino]metil}oksetan-3-il)metanol,
- 1-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metanesulfonamid,
- 5-[2-(dimetilamino)etoksi]-2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
- 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)-5-[2-(1H-tetrazol-5-il)etoksi]pirimidin-4-amin,
- 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)-5-[2-(1H-tetrazol-5-il)etoksi]-N-[2-(1H-tetrazol-5-il)etil]pirimidin-4-amin,

5-[2-(dimetilamino)etoksi]-2-[1-(4-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)-5-(1H-tetrazol-5-ilmetoksi)pirimidin-4-amin,
 5-[2-(dimetilamino)etoksi]-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 1-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)-3-(piperidin-1-il)propan-2-ol,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-metoksietoksi)-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 tert-butil 2-[(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]morfolin-4-karboksilat,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(morfolin-4-il)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-{[3-(metoksimetil)-1,2,4-oksadiazol-5-il]metoksi}-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 etil ({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)acetat,
 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etanon,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(metilsulfanil)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[2-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etoksi]etanol,
 mravljična kislina - (5S)-5-[(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]pirolidin-2-on (1:1),
 (5R)-5-[(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]pirolidin-2-on,
 tert-butil {2-[2-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etoksi]etil}karbamat,
 2-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanon,

(5S)-5-[(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)metil]pirolidin-2-on,
tert-butil [2-(2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etil]karbamat,
N-((2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-8-(piridin-4-il)-7,8-dihidro-6H-pirimido[5,4-b][1,4]oksazin-7-il}metil)formamid,
2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
2-[1-(4-ciklopropil-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
2-(1-{2,6-difluoro-4-[(1E)-prop-1-en-1-il]benzil}-1H-indazol-3-il)-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
1-[3,5-difluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]etanon,
[2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]metanol,
2-[3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]etanol,
2-[3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]-2-metilpropan-1-ol,
[4-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-il]metanol,
2-[3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]propan-2-ol,
1-[3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]-2-metilpropan-2-ol,
2-[2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]propan-2-ol,
5-(difluorometoksi)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

5-(difluorometoksi)-N-(difluorometil)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 4-[(difluorometil)(piridin-4-il)amino]-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-5-ol,
 2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)-5-(2,2,2-trifluoroetoksi)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)-5-(2,2,2-trifluoroetoksi)pirimidin-4-amin,
 3-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)propan-1,2-diol,
 (2S)-3-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)propan-1,2-diol,
 (2R)-3-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)propan-1,2-diol,
 2-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etanol,
 2-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etanol,
 etil 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-hidroksietoksi)pirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilat,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-hidroksietoksi)pirimidin-4-il}amino)-N-metilpiridin-3-karboksamid,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-hidroksietoksi)pirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 2-hidroksietil 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-hidroksietoksi)pirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilat,
 5-(ciklopropiloksi)-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin hidroklorid (1:1),
 (2S)-3-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)propan-1,2-diol hidroklorid (1:1),

2-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)etanol hidroklorid (1:1),
 2-[1-(2,6-diklorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin hidroklorid (1:1),
 [2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil]metanol hidroklorid (1:1),
 (2R)-3-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)propan-1,2-diol hidroklorid (1:1),
 N-{2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}-N-(piridin-4-il)acetamid,
 N-{2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}-2-metoksi-N-(piridin-4-il)acetamid,
 N-{2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}-N-(piridin-4-il)tetrahidro-2H-piran-4-karboksamid,
 N-{2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}-2-(2-metoksietoksi)-N-(piridin-4-il)acetamid,
 2-[{2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}(piridin-4-il)amino]etanol,
 (3-{[2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}(piridin-4-il)amino]metil}oksetan-3-il)metanol,
 2-{1-[4-bromo-2-fluoro-6-(2,2,2-trifluoroetoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-{1-[4-bromo-2,6-bis(2,2,2-trifluoroetoksi)benzil]-1H-indazol-3-il}-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzojska kislina,
 ({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-il}oksi)ocetna kislina,
 2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-N-metilbenzamid,
 2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzamid,

2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-N,N-dimetilbenzamid,

2,4-dikloro-N-(2-hidroksietil)-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzamid,

[2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)fenil](morfolin-4-il)metanon,

3,5-difluoro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-N-metilbenzamid,

2-[1-(4-etinil-2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

{2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-8-(piridin-4-il)-7,8-dihidro-6H-pirimido[5,4-b][1,4]oksazin-7-il}metanol,

2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-metil-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karbonitril,

2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N,N-di(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

metil 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilat,

2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

4-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karbonitril,

2-[(3-{4-[(2,6-dimetilpiridin-4-il)amino]-5-metoksipirimidin-2-il}-1H-indazol-1-il)metil]-5-etoksi-3-fluorofenol,

4-({5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}amino)piridin-2(1H)-on,

4-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-2(1H)-on,

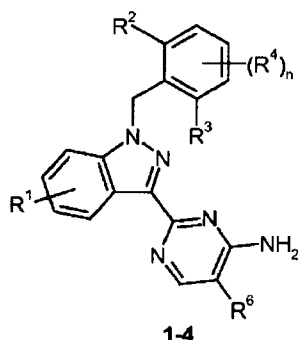
4-({5-metoksi-2-[1-(4-propilbenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}amino)nikotinonitril,

4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 4-({5-metoksi-2-[1-(4-propilbenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 4-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 4-({2-[1-(2,6-difluoro-4-hidroksibenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-hidroksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karbonitril,
 4-({4-[(3-cianopiridin-4-il)amino]-2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-5-il}oksi)piridin-3-karbonitril,
 5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-N-[3-(trifluorometil)piridin-4-il]pirimidin-4-amin,
 3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)benzojska kislina,
 mravljična kislina-3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-N-metilbenzamid (1:1),
 3-kloro-4-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il}metil)-N-metilbenzamid,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-hidroksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksamid,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-hidroksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilna kislina,
 etil 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-hidroksipirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilat,
 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-karbonitril
 2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-5-karboksamid,
 4-({2-[1-(2-fluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(2-hidroksietoksi)pirimidin-4-il}amino)piridin-3-karboksilna kislina hidroklorid (1:1),

N-(2-fluoropiridin-4-il)-5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 N-(2,6-difluoropiridin-4-il)-5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 N-(3-fluoropiridin-4-il)-5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]pirimidin-4-amin,
 5-metoksi-2-[1-(4-metoksibenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(2-metilpiridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-(difluorometil)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(metilsulfinil)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(metilsulfinil)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin (enantiomer 1),
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(metilsulfinil)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin (enantiomer 2),
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-[2-(metilsulfonil)etoksi]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 5-(2-aminoetoksi)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-(morfolin-2-ilmetoksi)-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 etil 4-({2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-il} amino)piridin-3-karboksilat,
 N-(3,5-difluoropiridin-4-il)-2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksipirimidin-4-amin,
 2-[1-(3-amino-2,6-diklorobenzil)-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,
 N-[2,4-dikloro-3-({3-[5-metoksi-4-(piridin-4-ilamino)pirimidin-2-il]-1H-indazol-1-il} metil)fenil]acetamid,
 2-[1-(4-etoksi-2,6-difluorobenzil)-4-metil-1H-indazol-3-il]-5-metoksi-N-(piridin-4-il)pirimidin-4-amin,

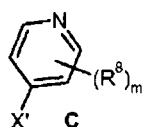
ali N-oksid, sol, tautomer ali stereoizomer omenjene spojine ali sol omenjenega N-oksida, tautomera ali stereoizomera.

22. Postopek izdelave spojin s splošno formulo (I) po zahtevkih 1 do 21, kjer je R^7 vodik, kot je prikazano v formuli (Ia), značilen po tem, da spojino s formulo (1-4)

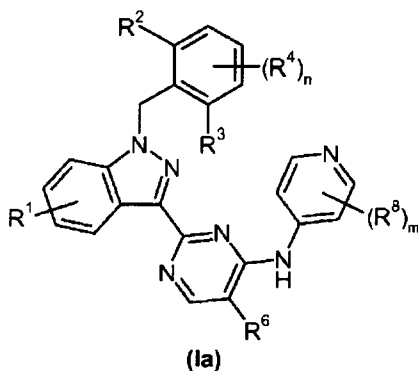


kjer R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 in n pomenijo, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 21,

reagiramo s spojino s formulo (C)

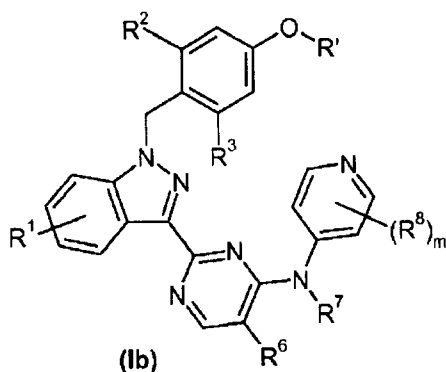


kjer R^8 in m pomenita, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 20, in X' predstavlja F, Cl, Br, I, boronska kislina ali ester boronske kisline v prisotnosti primerne baze v primarnem paladijevem katalizatorju, neobvezno v prisotnosti primerne liganda, da tvorimo spojino s formulo (Ia)

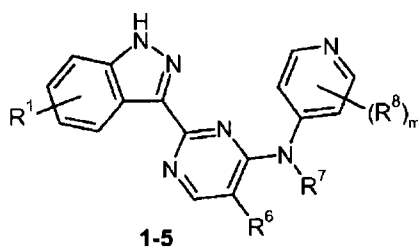


kateri je neobvezno naknadno odstranimo zaščito, da tvorimo spojino s splošno formulo (I) kjer R^7 predstavlja vodik in $R^1, R^2, R^3, R^4, R^6, R^8$ in n in m pomenijo, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 21.

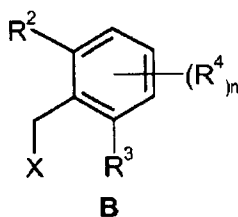
23. Postopek izdelave spojin s splošno formulo (I) po zahtevkih od 1 do 21, kjer spojino s formulo (Ib)



kjer $R^1, R^2, R^3, R^6, R^7, R^8$ in m pomenijo, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 20 in R' predstavlja 1-6C-alkil ali benzil, obdelamo s primernim kislinskim sistemom, da cepimo benzilno skupino, da dobimo spojino formulo 1-5



čemer sledi reakcija spojine s formulo 1-5 s spojino s splošno formulo (B),

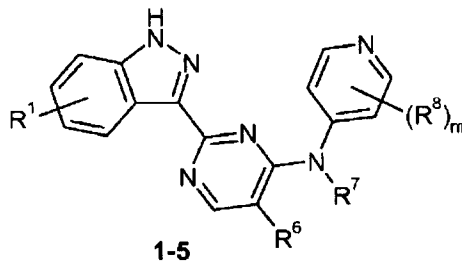


kjer R^2, R^3, R^4 in n pomenijo, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 21 in

X predstavlja Cl, Br, I, aril sulfonat, kot je p-toluen sulfonat ali alkil sulfonat, kot je metan sulfonat ali skupina trifluorometan sulfonat, v primernem sistemu topil, v prisotnosti primerne baze, v temperaturnem območju od sobne

temperature do vrelišča ustreznega topila, da dobimo spojino s splošno formulo (I).

24. Vmesna spojina s splošno formulo (1-5) po zahtevku 23,



kjer R^1 , R^6 , R^7 , R^8 in m pomenijo, kot je opisano v kateremkoli zahtevku od 1 do 21.

25. Uporaba spojine s formulo 1-5 po zahtevku 24, za izdelavo spojine s formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 21.

26. Spojina s splošno formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 21, za uporabo v zdravljenju ali profilaksi bolezni.

27. Spojina s splošno formulo (I) po zahtevku 26, kjer so bolezni hiperproliferativne bolezni in/ali motnje, ki se odzivajo na indukcijo apoptoze.

28. Spojina s splošno formulo (I) po zahtevku 27, kjer so hiperproliferativne bolezni in/ali motnje, ki se odzivajo na indukcijo apoptoze hematološki tumorji, trdni tumorji in/ali njihove metastaze.

29. Spojina s formulo (I) po zahtevku 28, kjer so tumorji cervikalni, tumorji na dojki, nedrobnocelični pljučni, tumorji prostate, tumorji debelega črevesa ali melanomi in/ali njihove metastaze.

30. Farmacevtski sestavek, ki vsebuje vsaj eno spojino s splošno formulo (I) po kateremkoli zahtevku od 1 do 21, skupaj z vsaj enim farmacevtsko sprejemljivim pomožnim sredstvom.

Mark - Inventa