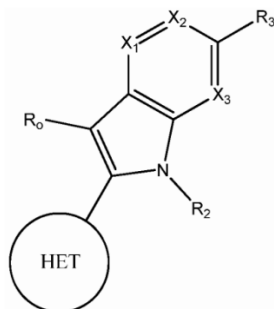


## PATENTNI ZAHTJEVI

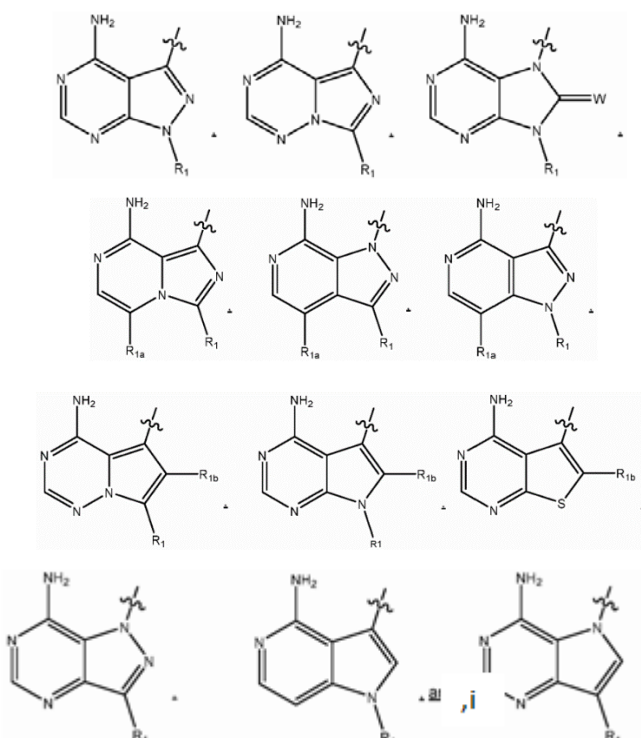
1. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, koji ima dolje prikazanu strukturnu formulu:



le

5

pri čemu:  
HET se bira iz jednog od sljedećih:



10

pri čemu



označava mjesto vezivanja;

R<sub>1</sub> je izabran između vodika, (1-4C) haloalkil, (1-4C) haloalkoksi i skupina formule:



15

pri čemu:

L nije prisutan ili je (1-5C) alkenil opciono supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih od (1-2C) alkila i okso;

Y nije prisutan ili je O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R<sub>a</sub>), C(O), C(O)O, OC(O), C(O)N(R<sub>a</sub>), N(R<sub>a</sub>)C(O), N(R<sub>a</sub>)C(O)N(R<sub>b</sub>), N(R<sub>a</sub>)C(O)O, OC(O)N(R<sub>a</sub>), S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>a</sub>), ili N(R<sub>a</sub>)SO<sub>2</sub>, pri čemu R<sub>a</sub> i R<sub>b</sub> su svaki neovisno izabrani iz vodika i (1-4C) alkil; i

20

Q je vodik, (1-6C)alkil, (2-6C)alkenil, (2-6C)alkinil, aril, (3-10C)cikloalkil, (3-10C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; pri čemu je Q opciono supstituiran s jednom ili više skupina supstituenata neovisno izabran od (1-4C) alkil, halo, (1-4C) haloalkil, (1-4C) haloalkoksi, amino, (1-4C) aminoalkil, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido, NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub>, OR<sub>c</sub>, C(O)R<sub>c</sub>, C(O)OR<sub>c</sub>, OC(O)R<sub>c</sub>, C(O)N(R<sub>d</sub>)R<sub>c</sub>, N(R<sub>d</sub>)C(O)R<sub>c</sub>, S(O)<sub>y</sub>R<sub>c</sub> gdje y je 0, 1 ili 2, SO<sub>2</sub>N(R<sub>d</sub>)R<sub>c</sub>, N(R<sub>d</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>c</sub>, Si(R<sub>d</sub>)(R<sub>c</sub>)R<sub>e</sub> I (CH<sub>2</sub>)<sub>z</sub>NR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> gdje z je 1, 2 ili 3; pri čemu su svaki R<sub>c</sub>, R<sub>d</sub> i R<sub>e</sub> neovisno izabrani od vodika, (1-6C)alkil i (3-6C) cikloalkil; ili R<sub>c</sub> i R<sub>d</sub> mogu biti povezani tako da zajedno s atomom dušika na koje su spojene, tvore 4-7močlani heterociklički

25

prsten koji je po izboru supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih između (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano i hidroksil; ili Q je opcionalno zamijenjen grupom formule:



pri čemu:

$L_1$  nije prisutan ili je (1-3C)alkilen, izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih iz (1-2C)alkil i okso;

$L_{Q1}$  nije prisutan ili je izabran između O, S, SO, SO<sub>2</sub>, N(R<sub>f</sub>), C(O), C(O)O, OC(O), C(O)N(R<sub>f</sub>), N(R<sub>f</sub>)C(O),

N(R<sub>g</sub>)C(O)N(R<sub>f</sub>), N(R<sub>f</sub>)C(O)O, OC(O)N(R<sub>f</sub>), S(O)<sub>2</sub>N(R<sub>f</sub>), i N(R<sub>f</sub>)SO<sub>2</sub>, gdje su R<sub>f</sub> i R<sub>g</sub> svaki neovisno izabrani od vodika i (1-2C)alkila; i

$Z_1$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, koji je teroaril ili heterociklil; gdje je  $Z_1$  je izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih između (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido, aril, heteroaril, heterocicil, (3-6C) cikloalkil, NR<sub>h</sub>R<sub>i</sub>, OR<sub>h</sub>, C(O)R<sub>h</sub>, C(O)OR<sub>h</sub>, OC(O)R<sub>h</sub>, C(O)N(R<sub>i</sub>)R<sub>h</sub>, N(R<sub>i</sub>)C(O)R<sub>h</sub>, S(O)<sub>ya</sub>R<sub>h</sub> gdje  $y^a$  je 0, 1 ili 2, SO<sub>2</sub>N(R<sub>i</sub>)R<sub>h</sub>, N(R<sub>i</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>h</sub> i (CH<sub>2</sub>)<sub>za</sub>NR<sub>i</sub>R<sub>h</sub> gdje  $Z^a$  je 1, 2 ili 3; gdje su R<sub>h</sub> i R<sub>i</sub> i svaki neovisno izabrani od vodika, (1-4C)alkila i (3-6C)cikloalkila;

R<sub>1a</sub> i R<sub>1b</sub> su izabrani od vodika, (1-4C) alkil, halogen, (1-4C) haloalkil, (1-4C) haloalkoksi, (1-4C) alkoksi, (1-4C) alkilamino, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil i merkpto;

W je izabran od O, S i NR<sub>j</sub>, gdje R<sub>j</sub> je izabran od H i (1-2C) alkil;

X<sub>1</sub> i X<sub>2</sub> su svaki neovisno izabrani od N i CR<sub>k</sub>;

pri čemu

R<sub>k</sub> je izabran od vodika, halo, (1-4C)alkila, (1-4C)alkoksi, amino, (1-4C)alkilamino, (1-4C) dialkilamino, cijano, (2C)alkinil, C(O)R<sub>k1</sub>, C(O)OR<sub>k1</sub>, OC(O)R<sub>k1</sub>, C(O)N(R<sub>k2</sub>)R<sub>c</sub>, N(R<sub>k2</sub>)C(O)R<sub>k1</sub>, S(O)<sub>y<sup>b</sup></sub>R<sub>k1</sub> gdje  $y^b$  je 0, 1 ili 2, SO<sub>2</sub>N(R<sub>k2</sub>)R<sub>k1</sub>, N(R<sub>k2</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>k1</sub> i (CH<sub>2</sub>)<sub>z<sup>b</sup></sub>NR<sub>k1</sub>R<sub>k2</sub> gdje  $z^b$  je 1, 2 ili 3; gdje spomenuti (1-4C) alkil je po izboru supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih između amino, hidroksi, (1-2C) alkoksi i halo; i R<sub>k1</sub> i R<sub>k2</sub> su svaki neovisno izabrani između vodika i (1-4C) alkil;

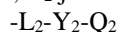
X<sub>3</sub> je izabran između N i CR<sub>m</sub>;

pri čemu:

R<sub>m</sub> je izabran od vodika, halo, (1-4C) alkila, (1-4C) alkoksi, amino, (1-4C) alkilamino, (1-4C) dialkilamino, cijano, (2C) alkinil, C(O)R<sub>m1</sub>, C(O)OR<sub>m1</sub>, OC(O)R<sub>m1</sub>, C(O)N(R<sub>m2</sub>)R<sub>m1</sub>, N(R<sub>m2</sub>)C(O)R<sub>m1</sub>, S(O)<sub>y<sup>c</sup></sub>R<sub>m1</sub> gdje  $y^c$  is 0, 1 ili 2, SO<sub>2</sub>N(R<sub>m2</sub>)R<sub>m1</sub>, N(R<sub>m2</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>m1</sub> i (CH<sub>2</sub>)<sub>z<sup>c</sup></sub>NR<sub>m1</sub>R<sub>m2</sub> gdje  $z^c$  je 1, 2 ili 3; pri čemu je navedeni (1-4C)alkil je izborno supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih od amino, hidroksi, (1-2C) alkoksi i halo; i

R<sub>m1</sub> i R<sub>m2</sub> su neovisno izabrani od vodika i (1-4C)alkila;

R<sub>o</sub> je izabran od halo, (1-4C) alkil, (1-4C)alkoksi, amino, (1-4C)alkilamino, (1-4C)dialkilamino, cijano, (2C) alkinil, C(O)R<sub>o1</sub>, C(O)OR<sub>o1</sub>, OC(O)R<sub>o1</sub>, C(O)N(R<sub>o2</sub>)R<sub>o1</sub>, N(R<sub>o2</sub>)C(O)R<sub>o1</sub>, S(O)<sub>y<sup>d</sup></sub>R<sub>o1</sub> gdje  $y^d$  is 0, 1 ili 2, SO<sub>2</sub>N(R<sub>o2</sub>)R<sub>o1</sub>, N(R<sub>o2</sub>)SO<sub>2</sub>R<sub>o1</sub> i (CH<sub>2</sub>)<sub>z<sup>d</sup></sub>NR<sub>o1</sub>R<sub>o2</sub> gdje  $z^d$  je 1, 2 ili 3; pri čemu je navedeni (1-4C)alkil izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih između amino, hidroksi, (1-2C) alkoksi i halo; I R<sub>o1</sub> i R<sub>o2</sub> se svaki neovisno bira između vodika i (1-4C) alkil; R<sub>2</sub> je izabran iz vodika, (1-4C) alkil i skupina formule:



pri čemu:

$L_2$  nije prisutan ili je (1-3C)alkilen, izborno supstituiran s jednim ili više substit uents izabrana od (1-2C) alkil i okso;

$Y_2$  nije prisutan ili je C(O), C(O)O, ili C(O)N(R<sub>p</sub>), pri čemu p je izabran između vodika i (1-4C)alkil; i

$Q_2$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; pri čemu  $Q_2$  izborno supstituiran s jednom ili više supstituirajućih skupina koje se neovisno bira između (1-4C) alkil, halogen, (1-4C) haloalkil, (1-4C) haloalkoksi, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, NR<sub>q</sub>R<sub>r</sub>, i OR<sub>q</sub>, pri čemu R<sub>q</sub> i R<sub>r</sub> su svaki neovisno izabrani između vodika, (1-4C) alkil i (3-6C) cikloalkil;

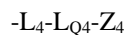
R<sub>3</sub> je izabran iz skupine formule:



pri čemu:

$Y_3$  je C(O), C(O)N(R<sub>y</sub>), C(O)N(R<sub>y</sub>)O, N(R<sub>y</sub>)(O)C, C(O)O, OC(O), N(R<sub>y</sub>)C(O)N(R<sub>y1</sub>), SO<sub>2</sub>N(R<sub>y</sub>), N(R<sub>y</sub>)SO<sub>2</sub>, oksazolil, triazolil, oksadiazolil, tiazolil, imidazolil, tiadiazolil, piridinil, pirazolil, pirolil ili tetrazolil, pri čemu su R<sub>y</sub> i R<sub>y1</sub> neovisno izabrani od vodika i (1-2C)alkila; i

$Q_3$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; gdje je  $Q_3$  po izboru supstituiran s jednom ili više supstituirajućih skupina koje se neovisno bira iz (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, NR<sub>z</sub>R<sub>aa</sub> i OR<sub>z</sub>, gdje su R<sub>z</sub> i R<sub>aa</sub> neovisno izabrani od vodika, (1-4C) alkila i (3-6C) cikloalkil; ili  $Q_3$  po izboru supstituiran sa skupinom formule:



pri čemu:

$L_4$  nije prisutan ili je (1-3C) alkilen po izboru supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih iz (1-2C)alkil i okso;

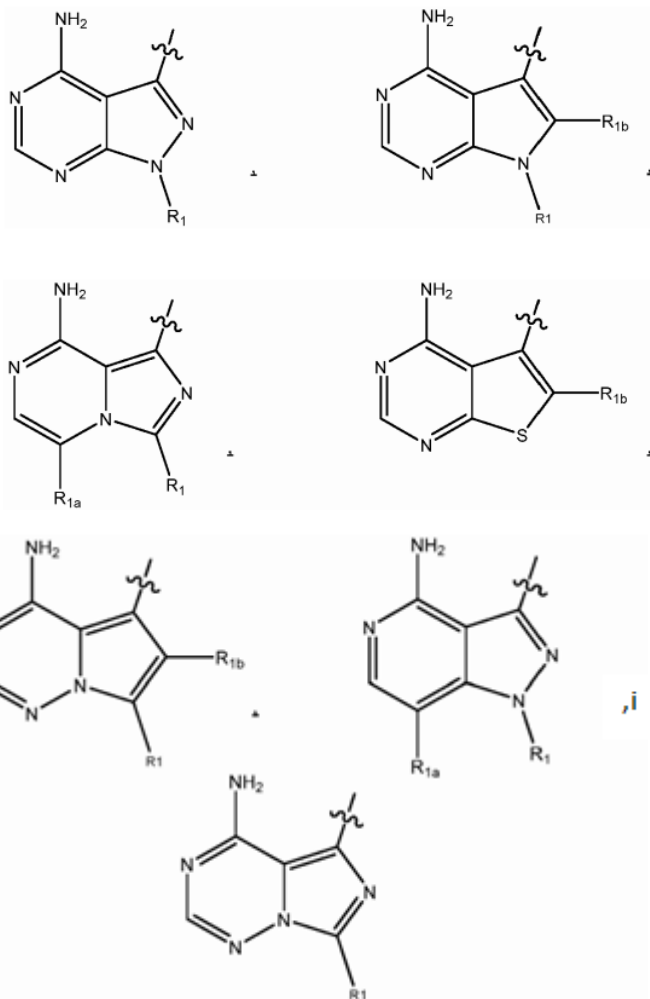
$Q_4$  nije prisutan ili je izabran između O, S, SO,  $SO_2$ ,  $N(R_{ab})$ , C(O), C(O)O, OC(O), C(O) $N(R_{ab})$ ,  $(R_{ab})C(O)$ ,  $N(R_{ac})C(O)N(R_{ab})$ ,  $N(R_{ab})C(O)O$ , OC(O) $N(R_{ab})$ ,  $S(O)_2N(R_{ab})$ , i  $N(R_{ab})SO_2$ , gdje  $R_{ab}$  i  $R_{ac}$  su svaki neovisno izabrani od vodika i (1-2C)alkila;

$Z_4$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; pri čemu je  $Z_4$  je izborno supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih između (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido, aril, heteroaril, heterocicil, (3-6C) cikloalkil,  $NR_{ad}R_{ae}$ ,  $OR_{ad}$ , C(O) $R_{ad}$ , C(O) $OR_{ad}$ , OC(O) $R_{ad}$ , C(O) $N(R_{ae})R_{ad}$ ,  $N(R_{ae})C(O)R_{ad}$ ,  $S(O)_{y^e}R_{ad}$  gdje  $y^e$  je 0, 1 ili 2,  $SO_2N(R_{ae})R_{ad}$ ,  $N(R_{ae})SO_2R_{ad}$  i  $(CH_2)_{z^e}NR_{ad}R_{ae}$  gdje je  $z^e$  je 1, 2 ili 3; pri čemu  $R_{ad}$  i  $R_{ae}$  su svaki neovisno izabrani od vodika, (1-4C)alkila i (3-6C) cikloalkila; ili

$Q_3$  i  $R_y$  su povezani tako da zajedno s atomom dušika na koji su vezani tvore 4-7-člani heterociklički prsten koji je po izboru supstituiran jednim ili više izabranih supstituenata iz (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano i hidroksil;

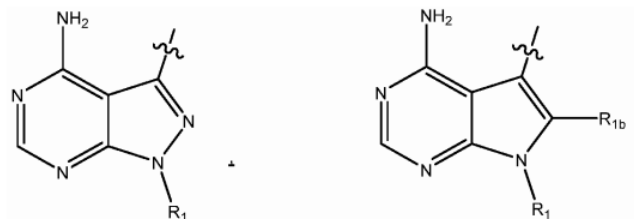
s tim da samo jedan ili dva od  $X_1$ ,  $X_2$  ili  $X_3$  mogu biti N.

2. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, prema zahtjevu 1, naznačen time, da HET je izabran između jednog od sljedećeg:

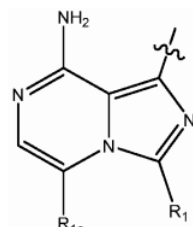


gdje su  $R_1$ ,  $R_{1a}$  i  $R_{1b}$  su kao što je definirano u zahtjevu 1.

3. Spoj, ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, prema zahtjevu 1 ili 2, naznačen time, da HET se bira između jednog od sljedećeg:

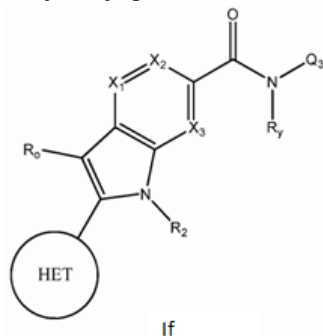


i



gdje su  $R_1$ ,  $R_{1a}$  i  $R_{1b}$  su kao što je definirano u zahtjevu 1.

- 5 4. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 3, pri čemu spoj ima strukturnu formulu kako je dolje prikazano:



gdje su HET,  $X_1$ ,  $X_2$ ,  $X_3$ ,  $R_0$ ,  $R_2$ ,  $Q_3$  i  $R_Y$  kao što je definirano u patentnom zahtjevu 1.

5. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 4, naznačen time, da se  $X_1$  i  $X_2$  svaki neovisno bira između N i  $CR_k$ , pri čemu je  $R_k$  je izabran iz vodika, halo, (1-4C)alkil i amino.
6. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 5, naznačen time, da se  $X_3$  bira između N i  $CR_m$ , pri čemu  $R_m$  je izabran od vodika, halo, (1-4C)alkil i amino.
7. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 6, pri čemu je  $R_0$  izabran od halo, (1-4C)alkil, (1-4C)alkoksi, amino, (1-4C)alkilamino, (1-4C) dialkilamino, cijano i (2C) alkinil.
8. Spoj ili f njegova armaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 1 do 3, naznačen time, da  $R_3$  je izabran iz skupine s formulom:



pri čemu:

$Y_3$  je C(O), C(O)N( $R_y$ ), C(O)N( $R_y$ )O, N( $R_y$ )(O)C, C(O)O, ili OC(O), pri čemu je  $R_y$  izabran između vodika i (1-2C)alkil; i

$Q_3$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; gdje je  $Q_3$  po izboru supstituiran s jednim ili više supstituenata skupina neovisno izabranih od (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil,  $NR_zR_{aa}$ , i  $OR_z$ , gdje  $R_z$  i  $R_{aa}$  su svaki neovisno izabrani između vodika, (1-4C)alkil ili (3-6C)cikloalkil; ili  $Q_3$  po izboru supstituiran skupinom formule:



pri čemu:

$L_4$  nije prisutan ili je (1-3C)alkilen po izboru supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih od (1-2C)alkila i okso;

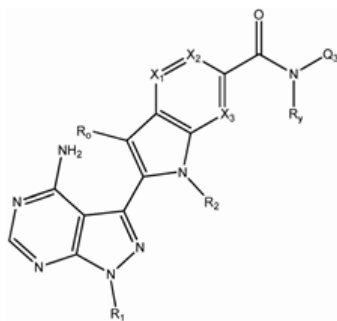
$L_{Q4}$  nije prisutan ili je izabran između O, N( $R_{ab}$ ), C(O), C(O)O, OC(O), C(O)N( $R_{ab}$ ), N( $R_{ab}$ )C(O), S(O)<sub>2</sub>N( $R_{ab}$ ), i N( $R_{ab}$ )SO<sub>2</sub>, gdje je  $R_{ab}$  je izabran između vodika i (1-2C)alkil; i

$Z_4$  je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; gdje je  $Z_4$  je opcionalno supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih od (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano, hidroksi, karboksi,

karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido, aril, heteroaril, heterocicil, (3-6C) cikloalkil,  $NR_{ad}R_{ae}$ ,  $OR_{ad}$ ,  $C(O)R_{ad}$ ,  $C(O)OR_{ad}$ ,  $OC(O)R_{ad}$ ,  $C(O)N(R_{ae})R_{ad}$ ,  $N(R_{ae})C(O)R_{ad}$ ,  $S(O)_{ye}R_{ad}$  gdje  $y^e$  je 0, 1 ili 2,  $SO_2N(R_{ae})R_{ad}$ ,  $N(R_{ae})SO_2R_{ad}$  i  $(CH_2)_{ze}NR_{ad}R_{ae}$  gdje  $z^e$  je 1, 2 ili 3; gdje su  $R_{ad}$  i  $R_{ae}$  svaki neovisno izabrani od vodika n, (1-4C)alkil i (3-6C)cikloalkil; ili

$Q_3$  i  $R_y$  su povezani tako da tvore 4-7močlani heterociklički prsten koji je izborno supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih između (1-4C)alkila, haloa, (1-4C)haloalkila, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano i hidroksil.

9. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 8, pri čemu spoj ima dolje prikazanu strukturnu formulu Ig:



Ig

gdje su  $R_1$ ,  $R_0$ ,  $R_2$ ,  $R_y$  i  $Q_3$  su kao što je definirano u bilo kojem od zahtjeva 1 do 8.

10. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 9, pri čemu je  $R_0$  izabran između halo, (1-4C)alkila i amino.
11. Spoj ili njegova prihvatljiva sol, hidrat ili solvat prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 10, pri čemu  $R_0$  halogen.
12. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 11, pri čemu  $R_1$  je izabran između vodika, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi i skupina formule:



pri čemu:

L nije prisutan ili je (1-3C)alkilen po izboru supstituiran jednim ili više supstituenata izabranih od (1-2C) alkila i okso;

Y nije prisutan ili je  $C(O)$ ,  $C(O)O$ ,  $OC(O)$ ,  $C(O)N(R_a)$  ili  $N(R_a)C(O)$ , gdje je  $R_a$  i  $R_b$  svaki neovisno izabran od vodika i (1-4C) alkila; i

Q je vodik, (1-6C)alkil, (2-6C)alkenil, (2-6C)alkinil, aril, (3-10C)cikloalkil, (3-10C)cikloalkenil, heteroaryl ili heterociklil; pri čemu je Q izborno supstituiran s jednom ili više skupina supstituenata neovisno izabranih iz (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, amino, (1-4C)aminoalkil, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido,  $NR_cR_d$ ,  $OR_c$ ,  $C(O)R_c$ ,  $C(O)OR_c$ ,  $OC(O)R_c$ ,  $C(O)N(R_d)R_c$ ,  $N(R_d)C(O)R_c$ ,  $S(O)_yR_c$  gdje je  $y$  0, 1 ili 2,  $SO_2N(R_d)R_c$ ,  $N(R_d)SO_2R_c$ ,  $Si(R_d)(R_c)R_e$  i  $(CH_2)_zNR_dR_c$  gdje  $z$  je 1, 2 ili 3; gdje su svaki  $R_c$ ,  $R_d$  i  $R_e$  neovisno izabrani od vodika, (1-6C)alkila i (3-6C)cikloalkila.

13. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 12, pri čemu  $R_1$  se bira između vodika, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, (1-6C)alkil, (2-6C)alkenil, (2-6C)alkinil, aril, (3-10C)cikloalkil, (3-10C)cikloalkenil, heteroaril i heterociklil; gdje svaki od navedenih supstituenata je po izboru dalje supstituiran jednom ili više supstituentnih skupina neovisno izabranih od (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, amino, (1-4C)aminoalkil, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, merkpto, ureido,  $NR_cR_d$ ,  $OR_c$ ,  $C(O)R_c$ ,  $C(O)OR_c$ ,  $OC(O)R_c$ ,  $C(O)N(R_d)R_c$ ,  $N(R_d)C(O)R_c$ ,  $S(O)_yR_c$ , gdje je  $y$  0, 1 ili 2,  $SO_2N(R_d)R_c$ ,  $N(R_d)SO_2R_c$ ,  $Si(R_d)(R_c)R_e$  i  $(CH_2)_zNR_dR_c$  gdje je  $z$  1, 2 ili 3; pri čemu su  $R_c$ ,  $R_d$  i  $R_e$  svaki neovisno izabran između vodika, (1-6C)alkila i (3-6C) cikloalkila.
14. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 13, pri čemu je  $R_1$  se bira između vodika, (1-6C)alkila i (3-10C)cikloalkila; gdje je svaki od navedenih supstituenata opciono supstituiran s jednom ili više supstitucijskih skupina neovisno izabranih od (1-4C)alkila, halo, amino, (1-4C)aminoalkil, cijano, hidroksi, karboksi,  $NR_cR_d$ ,  $OR_c$  i  $Si(R_d)(R_c)R_e$ ; gdje su  $R_c$ ,  $R_d$  i  $R_e$  svaki neovisno izabrani od vodika i (1-4C)alkila.
15. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 14, pri čemu je  $R_2$  je izabran između vodika, (1-4C)alkila, a skupina sljedeće formule:



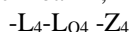
pri čemu:

$Y_2$  je  $C(O)N(R_p)$ , pri čemu  $p$  je izabran između vodika i (1-4C) alkila; i

$Q_2$  je (1-6C)alkil, aril, (3-8C)cikloalkil, heteroaril ili heterociklil; gdje je  $Q_2$  opciono supstituiran s jednim ili više grupa supstituenata neovisno izabranih između (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkila, (1-4C)haloalkoksi, amino, cijano i hidroksi.

16. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, u skladu s bilo kojim od patentnih zahtjeva 1 do 15, pri čemu je  $R_2$  je vodik.

17. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiv sol, hidrat ili solvat, prema bilo kojem od zahtjeva 9 do 16, pri čemu Q<sub>3</sub> je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C) cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; gdje je Q<sub>3</sub> po izboru supstituiran s jednim ili više skupina neovisno izabranih od (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkila, (1-4C)haloalkoksi, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, NR<sub>a</sub>-R<sub>aa</sub> i OR<sub>z</sub> gdje R<sub>z</sub> i R<sub>aa</sub> su svaki neovisno izabran od vodika, (1-4C)alkil i (3-6C)cikloalkil; ili Q<sub>3</sub> opciono supstituiran sa skupinom formule:



pri čemu:

L<sub>4</sub> nije prisutan ili je (1-3C) alkilen;

L<sub>Q<sub>4</sub></sub> nije prisutan ili je izabran iz O, N(R<sub>ab</sub>), C(O), C(O)O, i C(O)N(R<sub>ab</sub>), gdje je R<sub>ab</sub> izabran od vodika i (1-2C)alkila; i

Z<sub>4</sub> je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; pri čemu je Z<sub>4</sub> je opciono supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih od (1-4C)alkila, halo, (1-4C)haloalkila, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano i hidroksi.

18. Spoj ili njegova farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, prema bilo kojem od zahtjeva 9 do 17, pri čemu Q<sub>3</sub> je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, (3-8C)cikloalkenil, heteroaril ili heterociklil; gdje je Q<sub>3</sub> po izboru supstituiran s jednom ili više supstituirajućih skupina koje se neovisno bira između (1-4C)alkil, halo, (1-4C)haloalkil, (1-4C)haloalkoksi, amino, cijano, hidroksi, karboksi, karbamoil, sulfamoil, NR<sub>z</sub>R<sub>aa</sub> i OR<sub>z</sub>, gdje R<sub>z</sub> i R<sub>aa</sub> su svaki neovisno izabrani između vodika i (1-4C) alkila; ili Q<sub>3</sub> je izborna supstituiran skupinom formule:



pri čemu:

L<sub>Q<sub>4</sub></sub> nije prisutan ili je izabran između O, N(R<sub>ab</sub>), C(O), C(O)O, i C(O)N(R<sub>ab</sub>), gdje je u R<sub>ab</sub> izabran od vodika i (1-2C)alkila; i

Z<sub>4</sub> je vodik, (1-6C)alkil, aril, aril (1-2C)alkil, (3-8C)cikloalkil, heteroaril ili heterociklil; gdje je Z<sub>4</sub> je opciono supstituiran s jednim ili više supstituenata izabranih između (1-4C)alkila, halo, (1-4C) haloalkila, (1-4C)haloalkoksi, (1-4C)alkoksi, (1-4C)alkilamino, amino, cijano i hidroksil.

19. Spoj ili farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili njegov solvat, koji je izabran iz bilo kojeg od sljedećeg:

2-(4-amino-1-izopropil-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-tert-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-tert-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-N-(1-metil pirazol-3-il)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-izopropil-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-(terc-butyl) -1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-brom-N-metil-1H-indol-6- karboksamid ;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N- (2-metoksietil)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N-[2-(dimetilamino)etil]-1H-indol-6-karboksamid;2-(4-amino-1-terc-but il-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N- (2-morfolinoetil)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N- (3-morfolinopropil)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-tert-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N-metoksi-1 H-indol-6-karboksamid;

[2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-1H-indol-6-il]-piperidin-1-il-metanon;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N, N-dimetil-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N- [2- (2-metoksietoksi) etil]-1H- indol- 6- karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N- (3-metoksipropil) -1H-idol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N- (2-hidroksietil)-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il) -3-kloro-N- [2- (2-morfolinoetoksi) etil] -1H- indol-6- karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3 -klor-N-[2-[2-(dimetilamino) etoksi] etil]-1H-indol-6- karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N-[3- (dimetilamino) propil]-1H -indol-6- karboksamid;

2-(4-amino-1-terc -butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il) -3-klor-N-[3- (1-piperidil) propil] -1H- indol-6- karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-(3-izopropoksipropil)-1H-indol-6- karboksamid;

2-[4-amino-1- (2-hidroksietil) pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il]-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2 [4-amino-1-(3-metoksipropil) pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il]-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2-[4-amino-1-(1-metilsulfonil-4-piperidil) pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il]-3-kloro-N-metil-1H-indol-6- karboksamid;

2-(4-amino-1-metil-pirazolo [3 , 4-d] pirimidin-3-il)-3-klor-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;

2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il) -3-kloro-N-[1-(2-metoksietil) pirazol-3-il]-1H-indol-6- karboksamid;

- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-[1-(2-morfolinoetil) pirazol-3-il]-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-[1-[2-(dimetilamino) etil] pirazol-3-il]-1H-indol-6-karboksamid;
- 5 2-(4-Ami no-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro N-[1-[2-(4-metilpiperazin-1-il) etil] pirazol-3-il]-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-1-(2-aminoetil) pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il]-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-[1-(2-hidroksetil) pirazol-3-il]-1H-indol-6-karboksamid;
- 10 2-{4-amino-1-ciklobutil-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-cikloheksil-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-ciklopentil-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-7-izopropil-7H-pirol) [2,3-d] pirimidin-5-il)-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(8-amino-3-izopropil-imidazo [1,5-a] pirazin-1-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksilna kiselina;
- 15 2-(8-amino-3-izopropil-imidazo [1,5-a] pirazin-1-il)-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-N-metil-3H-benzimidazol-5-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-fluoro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-cikloheksil-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 20 2-(4-amino-7-izopropil-7H-pirol) [2,3-d] pirimidin-5-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-(tert-butyl)-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-1H-indol-6-karboksilna kiselina;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-(oksan-4-il)-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-(propan-2-il)-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-etil-1H-indol-6-karboksamid;
- 25 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-ciklopropil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-fenil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-1-(propan-2-il)-1H-pirazolo [4,3-c] piridin-3-il]-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-1-(propan-2-il)-1H-pirazolo [4,3-c] piridin-3-il]-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-1-(propan-2-il)-1H-pirazolo [4,3-c] piridin-3-il]-3-bromo-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 30 2-{4-arrunotieno [2,3-d] pirimidin-5-il}-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-arrunotieno [2,3-d] pirimidin-5-il}-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-7-(propan-2-il) pirol) [2,1-f] [1,2,4] triazin-5-il)-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-7-(propan-2-il) pirol) [2,1-f] [1,2,4] triazin-5-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-[4-amino-7-(propan-2-il) imidazo [4,3-f] [1,2,4] triazin-5-il)-3-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 35 2-[4-amino-7-kloro-1-(propan-2-il)-1H-pirazolo [4,3-c] piridin-3-il]-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-N-metil-1H-pirol) [2,3-b] piridin-6-karboksamid;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-N-metil-1H-pirol) [2,3-b] piridin-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-(terc-butyl)-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-1-metil-1H-indol-6-karboksilna kiselina;
- 40 2-(4-amino-1-(terc-butyl)-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-5-kloro-N-metil-1H-indol-6-karboksamid;
- N-(2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-1H-indol-6-il) acetamid;
- 1-(2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-3-kloro-1H-indol-6-il) propan-1-jedan;
- 2-{4-amino-1-terc-butyl-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il}-N,1-dimetil-1H-indol-6-karboksamid;
- 2-(4-amino-1-(1-metilpiperidin-4-il)-1H-pirazolo [3,4-d] pirimidin-3-il)-3-kloro-N-ciklopropil-1H-indole-6-karboksamid;
- 45 3-[3-kloro-6-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-indol-2-il]-1-izopropil-pirazolo [3,4-d] pirimidin-4-amin;
- 3-(3-kloro-6-oksazol-2-il)-1H-indol-2-il)-1-izopropil-pirazolo [3,4-d] pirimidin-4-amin;
- 1-izopropil-3-[6-(1,3,4-tiadiazol-2-il)-1H-indol-2-il] pirazolo [3,4-d] pirimidin-4-amin; i
- 1-izopropil-3-(6-oksazol-2-il)-1H-indol-2-il) pirazolo [3,4-d] pirimidin-4-amin.
- 50 20. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 19, ili farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat za uporabu u terapiji.
21. Farmaceutski pripravak koji sadrži spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 19, ili farmaceutski prihvatljivu sol, hidrat ili solvat i farmaceutski prihvatljiv nosač ili ekspicijent.
22. Spoj prema bilo kojem od zahtjeva 1 do 19, ili farmaceutski prihvatljiva sol, hidrat ili solvat, ili njegov farmaceutski pripravak prema zahtjevu 21, za uporabu u liječenju karcinoma.
- 55 23. Spoj ili farmaceutski pripravak za uporabu u skladu s patentnim zahtjevom 22, gdje je navedeni karcinom:
- (a) leukemija, karcinom pluća, karcinom debelog crijeva, karcinom dojke, karcinom jajnika, karcinom prostate, karcinom jetre, karcinom pankreasa, karcinom mozga, karcinom kože, medularni karcinom štitnjače ili karcinom pluća; i/ili
- (b) zloćudna neoplazma ili zloćudni tumor.