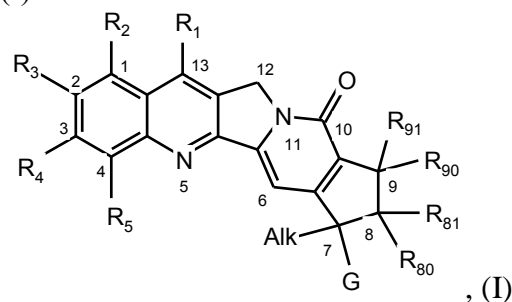


1. Сполука формули (I):



в якій:

Alk являє собою алкільну групу,

R_1 , R_2 , R_3 , R_4 і R_5 незалежно вибирають з атома водню, атома галогену, алкільної групи, алкенільної групи, алкінільної групи, полігалоалкільної групи, необов'язково заміщеної циклоалкільної групи, необов'язково заміщеної циклоалкілалкільної групи, гідроксигрупи, гідроксіалкільної групи, алкоксигрупи, алкоксиалкільної групи, нітрогрупи, ціаногрупи, ацилоксигрупи, $-C(O)-R$ -групи і груп $-(CH_2)_p-NR_aR_b$, $-O-C(O)-N-R_aR_b$ і $-Z-Ar$, де:

R являє собою алкільну групу, алкоксигрупу або аміногрупу (необов'язково заміщену на атомі азоту однією або двома алкільними групами),

p являє собою ціле число від 0 до 6,

R_a і R_b незалежно являють собою атом водню, алкільну групу, циклоалкільну групу, циклоалкілалкільну групу, ацильну групу, необов'язково заміщену арильну групу або необов'язково заміщену арилалкільну групу, або R_a і R_b утворюють разом з атомом азоту, який їх несе, піролілну, піперидилну або піперазинільну групу, кожна з цих циклічних груп може бути необов'язково заміщена,

Z являє собою зв'язок, атом кисню, атом сірки або групу, яку вибирають з $-Z'-S(O)-$, $-S(O)_r-Z'-$ і $-Z'-(CR_cR_d)_q-Z''-$,

Ar являє собою необов'язково заміщену арильну або необов'язково заміщену гетероарильну групу,

Z' і Z'' , які є однаковими або відрізняються, являють собою атом кисню, атом сірки, групу $-NR_e-$ або зв'язок,

R_c , R_d і R_e , які є однаковими або відрізняються, являють собою атом водню або алкільну групу,

q являє собою ціле число від 1 до 6,

r являє собою ціле число 1 або 2,

або дві сусідні групи з R_2 , R_3 , R_4 і R_5 утворюють разом з атомами вуглецю, які їх несуть, групу $-T-(CR_gR_h)_t-T'-$, де T і T' , які є однаковими або відрізняються, являють собою атом кисню, атом сірки або групу $N-R_i$;

R_g і R_h , які є однаковими або відрізняються, являють собою атом водню або атом галогену; t являє собою ціле число від 1 до 3 включно; R_i являє собою атом водню, алкільну групу або бензильну групу,

R_{80} і R_{90} незалежно являють собою атом водню, гідроксигрупу, алкільну групу або алкоксигрупу,

R_{81} і R_{91} незалежно являють собою атом водню, алкільну групу, алкенільну групу або алкінільну групу, або, взяті в парах на сусідніх атомах вуглецю, разом утворюють зв'язок або епоксидну групу, або дві групи (R_{80} і R_{81}) і/або (R_{90} і R_{91}), приєднані до одного і того ж атома, разом утворюють оксогрупу або групу $-O-(CH_2)_{t_1}-O$, t_1 являє собою ціле число від 1 до 3 включно,

G являє собою групу $-XN$ або $-X-C(X')-Alk'-G'$, де:

$*$ являє собою точку прикріплення до C_7 атома вуглецю,


X і X' , які є однаковими або відрізняються, являють собою атом кисню, атом сірки, аміногрупу або алкіламіногрупу,


Alk' являє собою алкіленовий, алкеніленовий або алкініленовий ланцюг,

G' являє собою атом водню або групу NR_6R_7 , в якій:

i) або R_6 і R_7 являють собою, кожний незалежно від іншого, атом водню, алкільну групу, циклоалкільну групу, необов'язково заміщену арильну групу, необов'язково заміщену арилалкільну групу, необов'язково заміщену циклоалкільну групу, необов'язково заміщену циклоалкілалкільну групу, необов'язково заміщену гетероарильну групу або необов'язково заміщену гетероарилалкільну групу,

ii) або R_6 і R_7 утворюють разом з атомом азоту 5-8-членну моно циклічну

гетероциклоалкільну групу  або 5-11-членну біциклічну гетероциклоалкільну

групу , в якій:

Y являє собою атом азоту, атом кисню або CH_2 -групу, і

R_8 являє собою атом водню, алкільну групу, необов'язково заміщену циклоалкільну групу, необов'язково заміщену циклоалкілалкільну групу, необов'язково заміщену арильну групу, необов'язково заміщену арилалкільну групу, необов'язково заміщену гетероциклоалкільну групу, необов'язково заміщену гетероциклоалкілалкільну групу, необов'язково заміщену гетероарильну групу або необов'язково заміщену гетероарилалкільну групу,

її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою,

зрозумілим є, що щонайменше один із замісників $\text{R}_1\text{-R}_5$ являє собою групу $-\text{Z-Ar}$,

і зрозумілим є, що:

термін алкіл означає лінійний або розгалужений ланцюг від 1 до 6 атомів вуглецю,

термін алкеніл означає лінійний або розгалужений ланцюг від 2 до 6 атомів вуглецю, що містить від 1 до 3 подвійних зв'язків,

термін алкініл означає лінійний або розгалужений ланцюг від 2 до 6 атомів вуглецю, що містить від 1 до 3 потрійних зв'язків,

термін алкілен означає лінійний або розгалужений двовалентний радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

термін алкенілен означає лінійний або розгалужений двовалентний радикал, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю і від 1 до 3 подвійних зв'язків,

термін алкінілен означає лінійний або розгалужений двовалентний радикал, що містить від 2 до 6 атомів вуглецю і від 1 до 3 потрійних зв'язків,

термін ацил означає лінійний або розгалужений алкілкарбонільний радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

термін алкокси означає алкілоксирадикал, алкільна група якого є лінійною або розгалуженою і містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

термін ацилокси означає ацилоксирадикал, ацильна група якого являє собою лінійний або розгалужений алкілкарбонільний радикал,

термін арилоксіалкіл означає арилоксіалкільну групу, алкільна група якої є лінійною або розгалуженою і містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

терміни арилалкіл, циклоалкілалкіл, гетероарилалкіл і гетероциклоалкілалкіл означають арилалкільний, циклоалкілалкільний, гетероарилалкільний і гетероциклоалкілалкільний радикали, алкільні групи яких означають лінійний або розгалужений ланцюг від 1 до 6 атомів вуглецю,

термін полігалоалкіл означає лінійний або розгалужений вуглецевий ланцюг, який містить від 1 до 3 атомів вуглецю і від 1 до 7 атомів галогену,

термін галоген означає атоми фтору, хлору, бромю або йоду,

термін арил означає фенільну, нафтильну, інданільну, інденільну, дигідронафтильну або тетрагідронафтильну групу,

термін циклоалкіл означає моноциклічну або біциклічну вуглеводневу групу, яка містить від 3 до 11 атомів вуглецю і необов'язково є ненасиченою 1 або 2 ненасиченими зв'язками,

термін гетероарил означає моноциклічну або біциклічну групу, в якій щонайменше одне з кілець є ароматичним, що містить від 5 до 11 кільцевих членів і містить від 1 до 4 гетероатомів, які вибирають з азоту, кисню і сірки,

термін гетероциклоалкіл означає моно- або біциклічну групу, насичену або ненасичену 1 або 2 ненасиченими зв'язками, що містить від 4 до 11 кільцевих членів і містить від 1 до 4 гетероатомів, які вибирають з азоту, кисню і сірки,

вираз "необов'язково заміщений", коли його використовують відносно арильної або арилалкільної, циклоалкільної або циклоалкілалкільної, гетероарильної або гетероарилалкільної і гетероциклоалкільної або гетероциклоалкілалкільної груп, означає, що відповідна арильна, циклоалкільна, гетероарильна і гетероциклоалкільна групи можуть бути заміщені за допомогою від 1 до 3 однаковими або різними замісниками, які вибирають з атома галогену і груп алкілу, алкокси, алкілтію, алкілсульфінілу, алкілсульфонілу, гідрокси, меркапто, ціано, нітро, аміно (необов'язково заміщеного однією або двома алкільними групами), ацилу, формілу, амінокарбонілу (необов'язково заміщеного на атомі азоту однією або двома алкільними групами), ациламіно (необов'язково заміщеного на атомі азоту алкільною групою), алкоксикарбонілу, карбокси і сульфо,

вираз "необов'язково заміщений", коли його використовують відносно груп піролілу, піперидилу або піперазинілу, означає, що групи, про які йде мова, можуть бути заміщені за допомогою від 1 до 3 однакових або різних груп, які вибирають з алкілу, алкокси, арилу, арилалкілу, арилокси і арилоксіалкілу.

2. Сполука формули (I) за п. 1, в якій Alk являє собою етильну групу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

3. Сполука формули (I) за п. 1, в якій R₈₀ і R₈₁ разом утворюють оксогрупу, або в якій R₉₀ і R₉₁ разом утворюють оксогрупу, або в якій R₈₀ і R₈₁, а також R₉₀ і R₉₁ утворюють дві оксогрупи, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

4. Сполука формули (I) за п. 1, в якій R₅ являє собою атом водню, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

5. Сполука формули (I) за п. 1, в якій R₃ і R₄ разом утворюють метилендіокси або етилендіоксигрупу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

6. Сполука формули (I) за п. 1, в якій R₂ являє собою атом водню, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

7. Сполука формули (I) за п. 1, в якій R₁ являє собою необов'язково заміщену арильну групу або необов'язково заміщену арилалкільну групу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

8. Сполука формули (I) за п. 1, в якій G являє собою гідроксигрупу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

9. Сполука формули (I) за п. 1, в якій G являє собою *-X-C(X')-Alk'-G', в якій G' являє собою атом водню, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

10. Сполука формули (I) за п. 1, в якій G являє собою групу *-X-C(X')-Alk'-NR₆R₇, в якій R₆ і R₇ утворюють разом з атомом азоту 5-8-членну моноциклічну гетероциклоалкільну



групу, в якій Y являє собою атом азоту, атом кисню або групу CH₂ і R₈ являє собою атом водню або алкільну групу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з

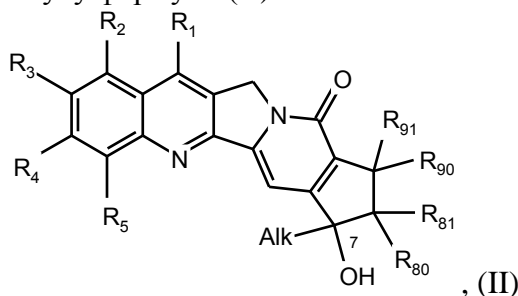
фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

11. Сполука формули (I) за п. 1, в якій Alk' являє собою алкіленову групу, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

12. Сполука формули (I) за п. 1, в якій X і X', які є однаковими або відрізняються, являють собою атом кисню або атом сірки, її енантіомери і діастереоізомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

13. Сполука формули (I) за п. 1, яка являє собою 7-етил-7-гідрокси-2,3-метилendioкси-13-(4-метилфеніл)-9,12-дигідро-7H-циклопента[6,7]індолізино-[1,2-b]хінолін-8,10-діон, її енантіомери і її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

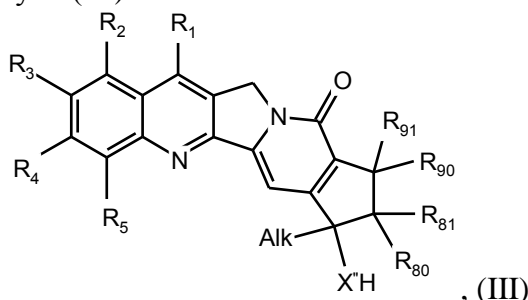
14. Спосіб одержання сполук формули (I), який **відрізняється** тим, що як вихідний матеріал використовують сполуку формули (II):



в якій Alk, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₈₀, R₈₁, R₉₀ і R₉₁ є такими ж, як визначено для формули (I),

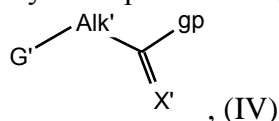
в якій гідроксигрупу на C₇ перетворюють у X''H, в якій X'' являє собою SH, аміно або алкіламіногрупу,

з одержанням сполуки формули (III)



в якій Alk, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₈₀, R₈₁, R₉₀ і R₉₁ є такими ж, як визначено для формули (I), і X'' є таким же, як визначено тут вище,

сполуки формули (II) або (III) конденсують з реактивом (IV):



де G', Alk' і X' є такими ж, як визначено для формули (I), і gp являє собою відхідну групу, таку як Hal, OH, SH, NR'R'' або OC(O)R', в якій R' і R'' являють собою алкільні групи, з одержанням сполук формули (I), де сполуки формули (I) можуть бути очищені, якщо необхідно, відповідно до звичайної методики очищення,

їх розділяють, де прийнятно, на їх стереоізомери відповідно до звичайної методики розділення,

їх перетворюють, якщо бажано, на їх адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

15. Фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт щонайменше одну сполуку за будь-яким з пп. 1-13, одну або в поєднанні з одним або більше інертними, нетоксичними, фармацевтично прийнятними наповнювачами або носіями.

16. Фармацевтична композиція за п. 15, яка містить щонайменше один активний

інгредієнт за будь-яким з пп. 1-13, для застосування у виробництві лікарських засобів для використання у лікуванні захворювань на рак.