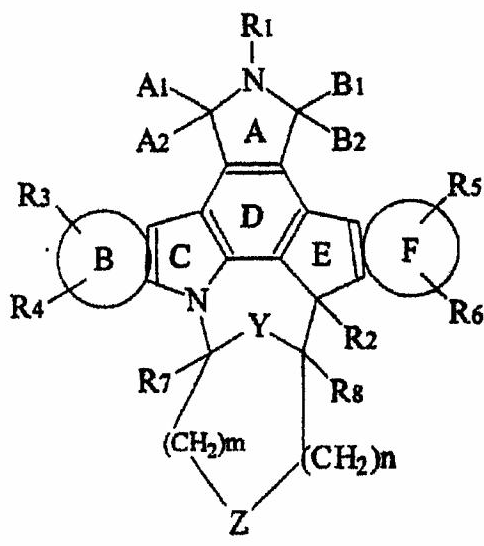


1. Інденопіролокарбазоли формули I



де:

кільце В і кільце F, незалежно один від одного і кожне разом з атомами вуглецю, з якими воно пов'язане, вибрано з групи, що складається з

а) ненасиченого 6-членного карбоциклічного ароматичного кільця, в якому від 1 до 3 атомів вуглецю можуть бути замінені атомами азоту;

б) ненасиченого 5-членного карбоциклічного ароматичного кільця і

с) ненасиченого 5-членного карбоциклічного ароматичного кільця, в якому або

1) один атом вуглецю замінений атомом кисню, азоту або сірки, або

2) два атоми вуглецю замінені атомом сірки і азоту, атомом кисню і азоту або двома атомами азоту, або

3) три атоми вуглецю замінені трьома атомами азоту;

R^1 вибраний з групи, що складається з

а) H, заміщеного або незаміщеного алкілу, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, заміщеного або незаміщеного арилу, заміщеного або незаміщеного арилалкілу, заміщеного або незаміщеного гетероарилу або заміщеного або незаміщеного гетероарилалкілу;

б) $-C(=O)R^9$, де R^9 вибраний з групи, що складається з алкілу, арилу і гетероарилу;

с) $-OR^{10}$, де R^{10} вибраний з групи, що складається з H і алкілу, що має від 1 до 4 атомів вуглецю;

д) $-C(=O)NH_2$, $-NR^{11}R^{12}$, $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$, $-(CH_2)_pOR^{10}$, $-O(CH_2)_pOR^{10}$ і $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$,

де p приймає значення від 1 до 4; і де або

1) R^{11} і R^{12} кожний незалежно один від одного вибраний з групи, що складається з H, алкілу, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, або

2) R^{11} і R^{12} разом утворюють зв'язуючу групу формули $-(CH_2)_2-X^1-(CH_2)_2-$, де X^1 вибраний з групи, що складається з $-O-$, $-S-$ і $-CH_2-$;

R^2 вибраний з групи, що складається з H, алкілу, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, -OH, алкокси, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, $-OC(=O)R^9$, $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$, $-O(CH_2)_pOR^{10}$, заміщеного або незаміщеного ариалкілу, що має від 6 до 10 атомів вуглецю, заміщеного або незаміщеного гетероарилалкілу;

R^3 , R^4 , R^5 і R^6 кожний незалежно вибраний з групи, що складається з

a) H, арилу, гетероарилу, F, Cl, Br, I, -CN, CF_3 , $-NO_2$, -OH, $-OR^9$, $-O(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$, $-OC(=O)R^9$, $-OC(=O)NR^2R^7$, $-OC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-O(CH_2)_pOR^{10}$, $-CH_2OR^{10}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{10}S(=O)_2R^9$, $-NR^{10}C(=O)_2R^9$;

b) $-CH_2OR^{14}$, де R^{14} являє собою залишок амінокислоти після видалення гідроксильної групи карбоксильної групи;

c) $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-CO_2R^2$, $-C(=O)R^2$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-CH=NOR^2$, $-CH=NR^9$, $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$, $-(CH_2)_pNHR^{14}$ або $-CH=NNR^2R^{2A}$, де R^{2A} такий же, як R^2 ;

d) $-S(O)_yR^2$, $-(CH_2)_pS(O)_yR^9$, $-CH_2S(O)_yR^{14}$, де y дорівнює 0, 1 або 2;

e) алкіл, що має від 1 до 8 атомів вуглецю, алкеніл, що має від 2 до 8 атомів вуглецю, і алкініл, що має від 2 до 8 атомів вуглецю, де

1) кожна алкільна, алкенільна або алкінільна група є незаміщеною або

2) кожна алкільна, алкенільна або алкінільна група є заміщеною 1-3 групами, вибраними з групи, що складається з арилу, що має від 6 до 10 атомів вуглецю, гетероарилу, арилалкокси, гетероциклоалкокси, гідроксіалкокси, алкілоксіалкокси, гідроксіалкілтію, алкоксіалкілтію, F, Cl, Br, I, -CN, $-NO_2$, -OH, $-OR^9$, $-X^2(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$, $-X^2(CH_2)_pC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-X^2(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$, $-X^2(CH_2)_pCO_2R^9$, $-X^2(CH_2)_pS(O)_yR^9$, $-X^2(CH_2)_pNR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-OC(=O)R^9$, $-OCONHR^2$, -O-тетрагідропіранілу, $-NR^{11}R^{12}$, $-NR^{10}C(=O)R^9$, $-NR^{10}CO_2R^9$, $-NR^{10}C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-NHC(=NH)NH_2$, $-NR^{10}S(O)_2R^9$, $-S(O)_yR^9$, $-CO_2R^2$, $-C(=O)NR^{11}R^{12}$, $-C(=O)R^2$, $-CH_2OR^{10}$, $-CH=NNR^2R^{2A}$, $-CH=NOR^2$, $-CH=NR^9$, $-CH=NNHCH(N=NH)NH_2$, $-S(=O)_2NR^2R^{2A}$, $-P(=O)(OR^{10})_2$, $-OR^{14}$, і моносахариду, що має від 5 до 7 атомів вуглецю, де кожна гідроксильна група моносахариду незалежно одна від одної або є незаміщеною, або заміщена на H, алкіл, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, алкілкарбонілокси, що має від 2 до 5 атомів вуглецю, або алкокси, що має від 1 до 4 атомів вуглецю;

X^2 являє собою O, S або NR^{10} ;

R^7 і R^8 незалежно один від одного вибирають з групи, що складається з H, алкілу, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, алкокси, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, заміщеного або незаміщеного арилалкілу, що має від 6 до 10 атомів вуглецю, заміщеного або незаміщеного гетероарилалкілу, $-(CH_2)_pOR^{10}$, $-(CH_2)_pOC(=O)NR^{11}R^{12}$ і $-(CH_2)_pNR^{11}R^{12}$;

або R^7 і R^8 разом утворюють зв'язуючу групу формули $-\text{CH}_2-\text{X}^3-\text{CH}_2-$, де X^3 являє собою X^2 або зв'язок;

R^8 може приймати значення $-\text{CO}_2\text{Et}$;

m і n незалежно один від одного являють собою 0, 1 або 2;

Y вибраний з групи, що складається з $-\text{O}-$, $-\text{S}-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{N}^+(\text{O}^-)(\text{R}^{10})-$, $-\text{N}(\text{OR}^{10})-$ і $-\text{CH}_2-$;

Z вибраний з групи, що складається із зв'язку, $-\text{O}-$, $-\text{CH}=\text{CH}-$, $-\text{S}-$, $-\text{C}(=\text{O})-$, $-\text{CH}(\text{OR}^{10})-$, $-\text{N}(\text{R}^{10})-$, $-\text{N}(\text{OR}^{10})-$, $\text{CH}(\text{NR}^{11}\text{R}^{12})-$, $-\text{C}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^{17})-$, $-\text{N}(\text{R}^{17})-\text{C}(=\text{O})-$, $-\text{N}(\text{S}(\text{O})_y\text{R}^9)-$, $-\text{N}(\text{S}(\text{O})_y\text{NR}^{11}\text{R}^{12})-$, $-\text{N}(\text{C}(=\text{O})\text{R}^{17})-$, $-\text{C}(\text{R}^{15}\text{R}^{16})-$, $-\text{N}^+(\text{O}^-)(\text{R}^{10})-$, $-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}(\text{OH})-$ і $-\text{CH}(\text{O}(\text{C}=\text{O})\text{R}^9)\text{CH}(\text{CO}(=\text{O})\text{R}^{9A})-$, де R^{9A} той же, що і R^9

R^{15} і R^{16} незалежно один від одного вибрані з групи, що складається з H , $-\text{OH}$, $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^{10}$,

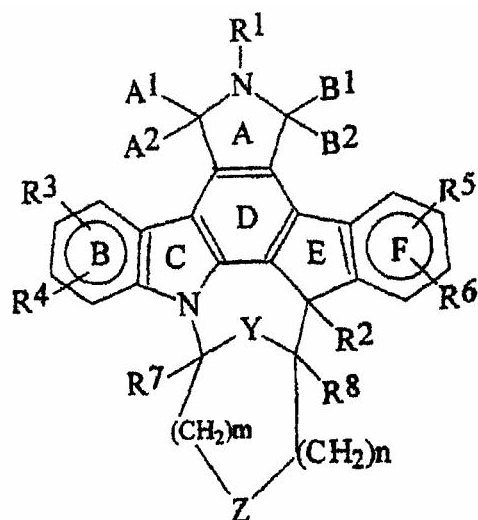
$-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^9$, гідроксіалкілу і $-\text{CO}_2\text{R}^{10}$;

R^{17} вибраний з групи, що складається з H , алкілу, арилу і гетероарилу;

A^1 і A^2 вибрані з груп, що складаються з H і H ; H і OR^2 ; H і $-\text{SR}^2$; H і $-\text{N}(\text{R}^2)_2$; і групи, де A^1 і A^2 разом утворюють фрагмент, вибраний з групи, що складається з $=\text{O}$, $=\text{S}$ і $=\text{NR}^2$;

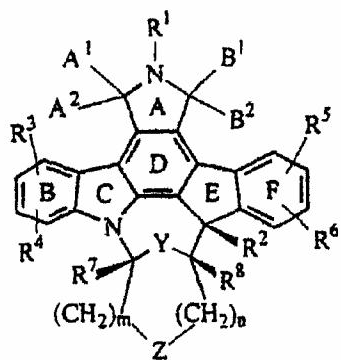
B^1 і B^2 вибрані з груп, що складаються з H і H ; H і $-\text{OR}^2$; H і $-\text{SR}^2$; H , $-\text{N}(\text{R}^2)_2$; і групи, де B^1 і B^2 разом утворюють фрагмент, вибраний з групи, що складається з $=\text{O}$, $=\text{S}$ і $=\text{NR}^2$;
за умови, що принаймні одна з пар A^1 і A^2 або B^1 і B^2 утворюють $=\text{O}$.

2. Сполука за п. 1, що має формулу:

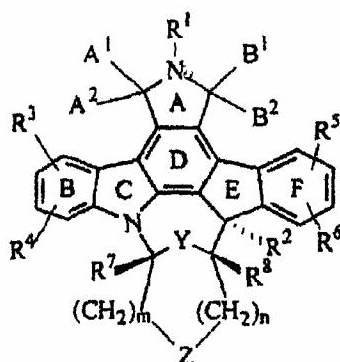


II.

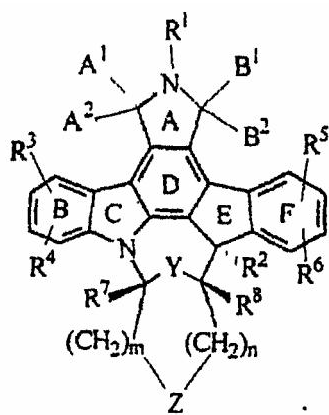
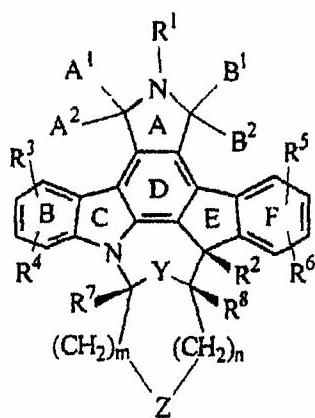
3. Сполука за п. 2, представлена діастереомерами формул:

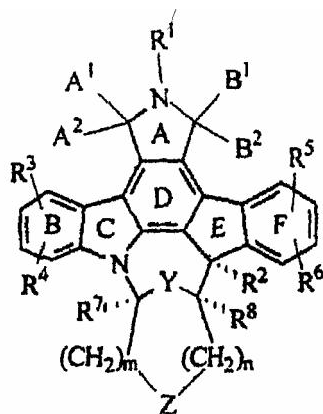


або

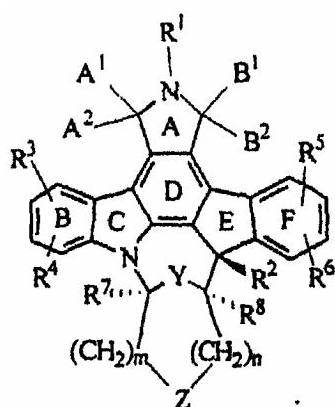


4. Сполука за п. 2, представлена енантіомерами формул:





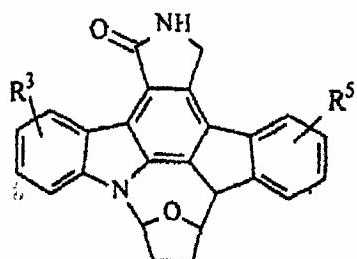
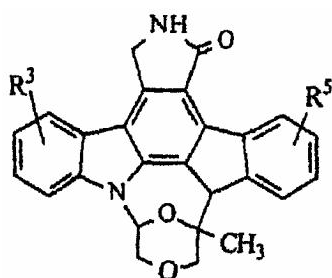
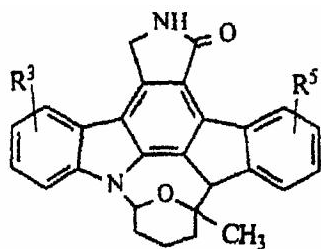
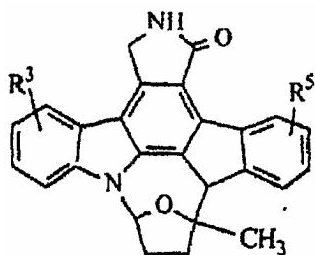
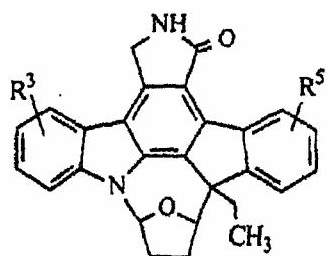
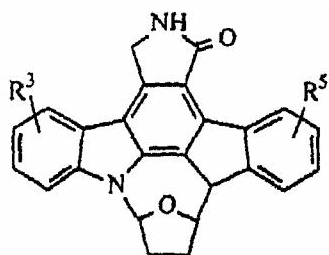
або

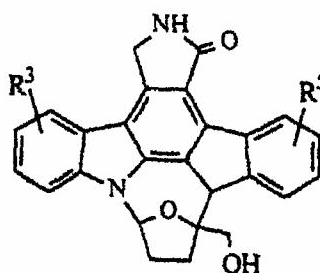
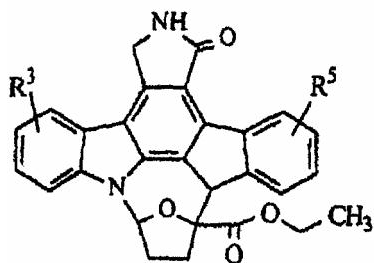
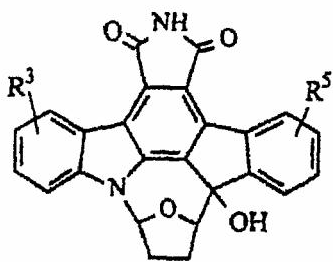


5. Сполука за п. 1, де R^1 являє собою Н.
6. Сполука за п. 1, де R^2 являє собою Н, гідроксил або заміщений або незаміщений алкіл.
7. Сполука за п. 1, де R^3, R^4, R^5 і R^6 незалежно один від одного являє собою Н, заміщений або незаміщений алкіл, галоген, заміщений або незаміщений алкокси, заміщений або незаміщений аміно або заміщений або незаміщений арил.
8. Сполука за п. 1, де R^7 і R^8 незалежно один від одного являє собою Н або заміщений або незаміщений алкіл.
9. Сполука за п. 1, де Y являє собою О.
10. Сполука за п. 1, де Z являє собою зв'язок, О, S або заміщений або незаміщений N.
11. Сполука за п. 1, де m і n незалежно один від одного дорівнюють 1 або 2.
12. Сполука за п. 1, де Y являє собою О, Z являє собою зв'язок або О, і m і n незалежно один від одного дорівнюють 1 або 2.
13. Сполука за п. 1, де A^1A^2 і B^1B^2 незалежно один від одного являють собою =O або Н і Н.
14. Сполука за п. 1, де R^1, R^4, R^6 і R^7 кожний являє собою Н, Y являє собою О, n дорівнює 1, A^1A^2 і B^1B^2 незалежно один від одного являють собою =O або Н і Н, R^2 являє собою Н, ОН або нижчий алкіл, R^3 являє собою Н або заміщений алкіл, R^5 і R^8

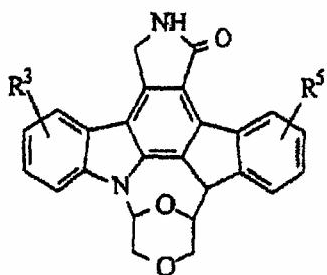
незалежно один від одного являють собою Н або алкокси, Z являє собою зв'язок або О і m дорівнює 1 або 2.

15. Сполука за п. 1, що має формулу:





або



16. Сполука за п. 15, де кожний R^3 і R^5 незалежно один від одного вибрані з груп, що складаються з

а) H, гетероарилу, F, Br, -CN, CF_3 , -NO₂, -OH, -OR⁹, -O(CH₂)_pNR¹¹R¹², -OC(=O)R⁹, -OC(=O)NR²R⁷, -OC(=O)NR¹¹R¹², -O(CH₂)_pOR¹⁰, -CH₂OR¹⁰, -NR¹¹R¹², -NR¹¹S(=O)₂R⁹, -NR¹⁰C(=O)R⁹;

с) NR¹⁰C(=O)NR¹¹R¹², -CO₂R², -C(=O)R², -C(=O)NR¹¹R¹², -CH=NOR², -CH=NR⁹, -(CH₂)_pNR¹¹R¹², -(CH₂)_pNHR¹⁴;

д) -S(O)_yR², -(CH₂)_pS(O)_yR⁹, -CH₂S(O)_yR¹⁴, де Y дорівнює 0, 1 або 2 і

е) алкілу, що має від 1 до 8 атомів вуглецю, алкенілу, що має від 2 до 8 атомів вуглецю, і алкінілу, що має від 2 до 8 атомів вуглецю, де

1) кожна алкільна, алкенільна або алкінільна група є незаміщеною або

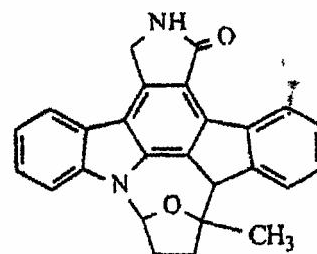
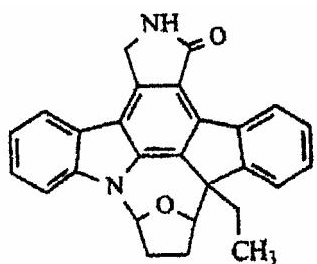
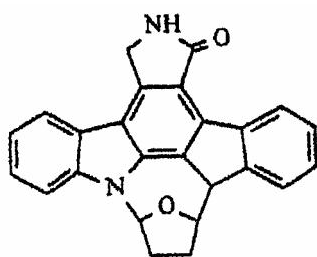
2) кожна алкільна, алкенільна або алкінільна група є заміщеною 1-3 групами, вибраними з арилу, що має від 6 до 10 атомів вуглецю, гетероарилу, арилалкокси,

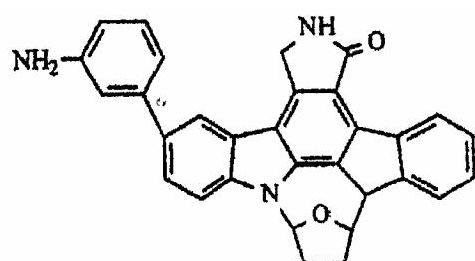
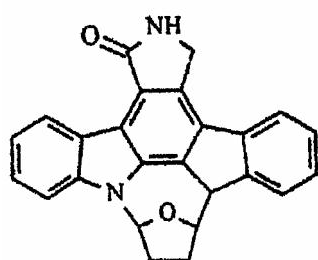
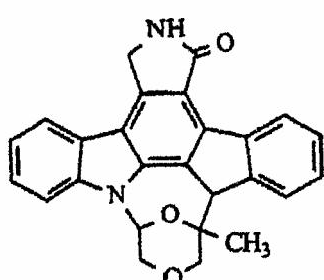
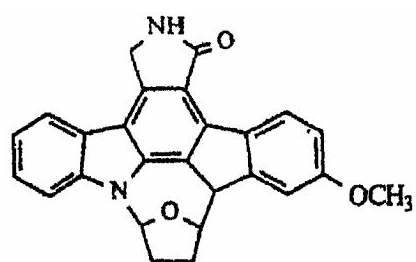
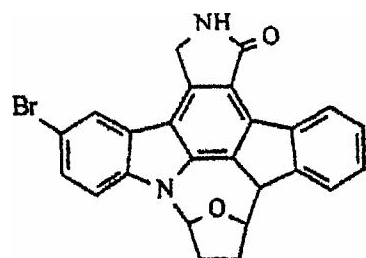
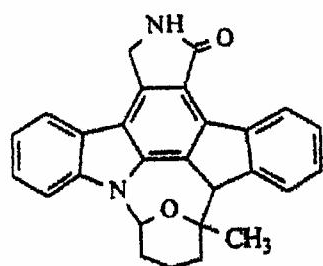
гетероциклоалкокси, гідроксіалкокси, алкілоксиалкокси, гідроксіалкілтіо, алкоксиалкілтіо, F, Cl, Br, I, -CN, -NO₂, -OH, -OR⁹, -X²(CH₂)_pNR¹¹R¹², -X²(CH₂)_pC(=O)NR¹¹R¹², -X²(CH₂)_pOC(=O)NR¹¹R¹², -X²(CH₂)_pCO₂R⁹, -X²(CH₂)_pS(O)_yR⁹, -X²(CH₂)_pNR¹⁰C(=O)NR¹¹R¹², -OC(=O)R⁹, -OCONHR², -O- тетрагідропіранілу, -NR¹¹R¹², -NR¹⁰C(=O)R⁹, -NR¹⁰CO₂R⁹, -NR¹⁰C(=O)NR¹¹R¹², -NHC(=NH)NH₂, NR¹⁰S(O)₂R⁹, -S(O)_yR⁹, -CO₂R², -C(=O)NR¹¹R¹², C(=O)R², -CH₂OR¹⁰, -CH=NR⁹, -S(=O)₂NR²R^{2A}, -OR¹⁴, і моносахариду, що має від 5 до 7 атомів вуглецю, де кожна гідроксильна група моносахариду незалежно одна від одної або є незаміщеною, або замінена на H, алкіл, що має від 1 до 4 атомів вуглецю, алкілкарбонілокси, що має від 2 до 5 атомів вуглецю, або алкокси, що має від 1 до 4 атомів вуглецю.

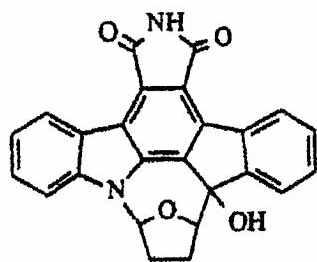
17. Сполука за п. 16, де R⁵ незалежно вибраний з групи, що складається з H, -OR⁹, -O(CH₂)_pNR¹¹R¹², -OC(=O)R⁹, -OC(=O)NR²R⁷, -OC(=O)NR¹¹R¹², -O(CH₂)_pOR¹⁰, -CH₂OR¹⁰, -NR¹¹R¹²,

-NR¹⁰S(=O)₂R⁹, -NR¹⁰C(=O)R⁹, -C(=O)NR¹¹R¹², -(CH₂)_pNR¹¹R¹², -S(O)_yR², -(CH₂)_pS(O)_yR⁹ і -CH₂S(O)_yR¹⁴, де Y дорівнює 0, 1 або 2.

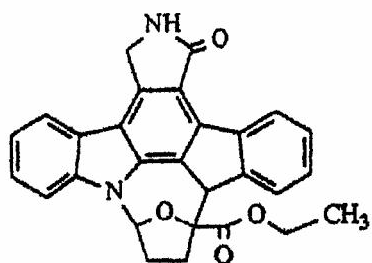
18. Сполука за п. 17, що має формулу



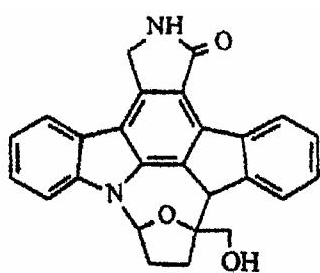




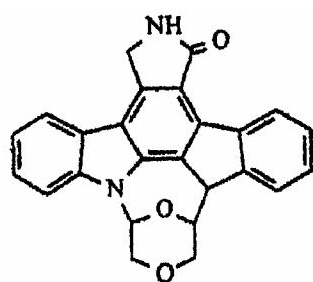
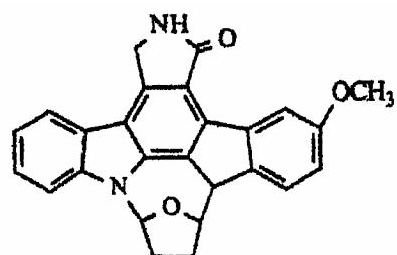
,



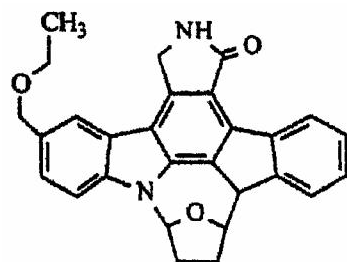
,



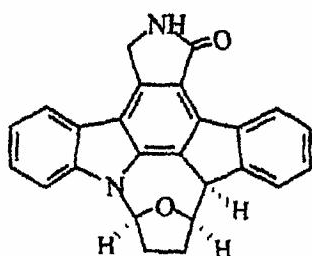
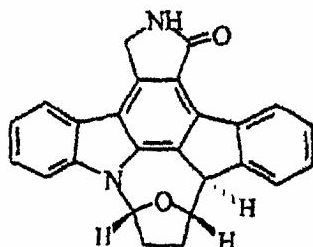
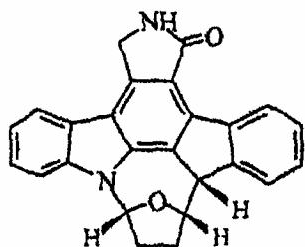
,



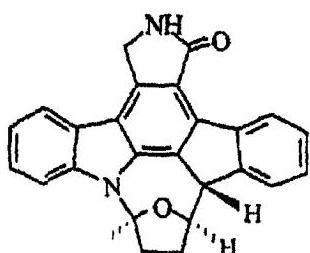
або



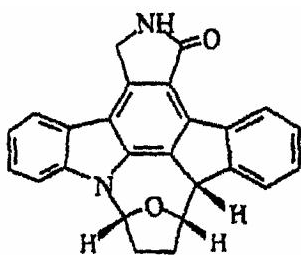
19. Сполука за п. 18, представлена енантіомерами формули:



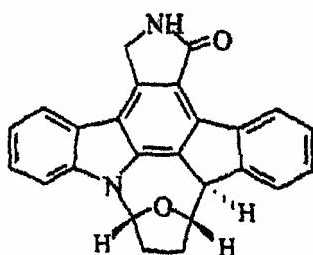
або



20. Сполука за п. 18, представлена діастереомерами формули:



або



21. Фармацевтична композиція, що містить сполуку за п. 1 і фармацевтично прийнятний носій.
22. Фармацевтична композиція за п. 21, що містить сполуку за п. 18 і фармацевтично прийнятний носій.
23. Фармацевтична композиція за п. 21, для лікування або попередження захворювань простати, що містить сполуку за п. 1 і фармацевтично прийнятний носій.
24. Фармацевтична композиція за п. 23, де захворюванням простати є рак простати або доброякісна гіперплазія простати.
25. Фармацевтична композиція за п. 21, для лікування або профілактики ангіогенних захворювань, що містить сполуку за п. 1 і фармацевтично прийнятний носій.
26. Фармацевтична композиція за п. 25, де ангіогенним захворюванням є ракові тверді пухлини, ендометріоз, діабетична ретинопатія, псоріаз, гемангіобластома, захворювання очей або дегенерація жовтої плями (макулярна дегенерація).
27. Фармацевтична композиція за п. 21, для лікування або профілактики неоплазії, ревматоїдного артрити, фіброзу легенів, мієлофіброзу, патологічного загоєння ран, атеросклерозу або рестенозу, що містить сполуку за п. 1 і фармацевтично прийнятний носій.
28. Фармацевтична композиція за п. 21, для лікування або профілактики хвороби Альцгеймера, аміотрофічного латерального склерозу, хвороби Паркінсона, інсульту, ішемії, хвороби Хантінгтона, деменції при ВІЛ, епілепсії, множинного (розсіяного) склерозу, периферичної невропатії або уражень мозку або спинного мозку, що містить сполуку за п. 1 і фармацевтично прийнятний носій.
29. Спосіб інгібування кіназної активності trk, що включає доставку сполуки за п. 1 в кількості, достатній для отримання результату у вигляді ефективного інгібування.
30. Спосіб за п. 29, де кіназа trk являє собою trk A.
31. Спосіб за п. 29, де сполуку за п. 1 вводять для лікування запалення.
32. Спосіб за п. 29, для лікування або профілактики захворювань простати, що включає призначення потребуючому даного лікування або запобігання хворому терапевтично ефективної кількості сполуки за п. 1.
33. Спосіб за п. 32, де захворюванням простати є рак простати або доброякісна гіперплазія простати.
34. Спосіб лікування або профілактики ангіогенних захворювань, що включає призначення потребуючому даного лікування або запобігання хворому терапевтично ефективної кількості сполуки за п. 1.
35. Спосіб за п. 34, де ангіогенним захворюванням є ракові тверді пухлини, ендометріоз, діабетична ретинопатія, псоріаз, гемангіобластома, захворювання очей

або дегенерація жовтої плями.

36. Спосіб лікування або профілактики захворювань, при якому активність PDGFR сприяє патологічному стану, що включає доставку сполуки за п. 1 в кількості, достатній для того, щоб забезпечити контакт рецептора фактора зростання тромбоцитів (PDGFR) з інгібуючою ефективною кількістю сполуки.

37. Спосіб за п. 36, лікування або профілактики неоплазії, ревматоїдного артрити, фіброзу легенів, мієлофіброзу, патологічного загоєння ран, атеросклерозу або рестенозу, що включає призначення хворому, потребуєчому подібного лікування або профілактики, терапевтично ефективної кількості сполуки за п. 1.

38. Спосіб лікування або профілактики захворювань, що характеризуються аберантною активністю клітин, реагуючих на трофічний чинник, що включає доставку сполуки за п. 1 в кількості, достатній для забезпечення контакту рецептора трофічного чинника клітин з ефективною індуючою активність кількістю сполуки.

39. Спосіб лікування або профілактики хвороби Альцгеймера, аміотрофічного латерального склерозу, хвороби Паркінсона, інсульту, ішемії, хвороби Хантінгтона, деменції при ВІЛ, епілепсії, множинного (розсіяного) склерозу, периферичної невропатії або уражень головного мозку або спинного мозку, що включає призначення хворому, потребуєчому подібного лікування або профілактики, терапевтично ефективної кількості сполуки за п. 1.