PCT WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION

International Bureau

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification[6]: A61K 31/40 A1	(11) International publication number: WO 99/51224
	(43) International publication date: 14 October 1999 (14.10.99)
(21) International application number: PCT/EP99/01918	(81) Designated states: AU, BG, BR, BY, CA, CN, CZ, EE, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KR, KZ, LT, LV, MK, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TR, UA, UZ, YU, ZA, Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).
(22) International filing date: 22 March 1999 (22.03.99)	
(30) Data relating to the priority: 198 14 838.0 2 April 1998 (02.04.98) DE	Published With the International Search Report. Before expiry of the period provided for amending the claims. Further publication will be made if such amendments are received.

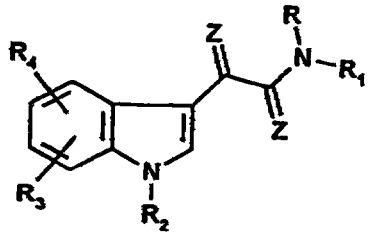
(71) Applicant: ASTA MEDICA AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; An der Pikardie 10, D-01277 Dresden (DE).

(72) Inventors: NICKEL, Bernd; Alleestrasse 35, D-64367 Mühltal (DE). SZELENYI, Istvan; Händelstrasse 32, D-90571 Schwaig (DE). SCHMIDT, Jürgen; Am Roggersberg 20, D-88690 Uhldingen-Mühlhofen (DE). EMIG, Peter; Ludwig-Erhard-Strasse 22, D-63486 Bruchköbel (DE). REICHERT, Dietmar; Elsavastrasse 79, D-63863 Eschau (DE). GÜNTHER, Eckhard; Wingertstrasse 176, D-63477 Maintal (DE). BRUNE, Kay; Weiherackerweg 17, D-91080 Marloffstein (DE).

As printed

(54) Title: INDOLYL-3-GLYOXYLIC ACID DERIVATIVES WITH ANTITUMORAL ACTIVITY

(54) Bezeichnung: INDOLYL-3-GLYOXYLSÄURE-DERIVATE MIT ANTITUMORWIRKUNG



(1)

(57) Abstract

The invention relates to the use of N-substituted indol-3-glyoxyamides of general formula (1) as antitumoral agents, as well as to pharmaceutical compositions with an antitumoral activity characterised in that they contain at least one of the compounds of general formula (1), possibly in the form of their physiologically acceptable acid addition salts or N oxides. The invention also relates to antitumoral agents containing as active ingredient one or more N-substituted indol-3-glyoxyamides of general formula (1) and their physiologically acceptable acid addition salts, and as far as possible their N-oxides, as well as a pharmaceutically acceptable carrier and/or diluent or additive, in the form of tablets, dragées, capsules, solutions for infusion or ampoules, suppositories, dressings, powder preparations for inhalation, suspensions, creams and ointments.

(57) Zusammenfassung

Die Erfindung betrifft die Verwendung von N-substituierten Indol-3-glyoxylamiden der allgemeinen Formel (1) als Antitumormittel sowie pharmazeutische Zusammensetzung mit Antitumorwirkung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer der Verbindungen der allgemeinen Formel (1) ggf. auch in Form der physiologisch verträglichen Säureadditionssalze oder N-Oxide. Ferner umfasst die Erfindung auch Antitumormittel enthaltend als aktiven Wirkstoff ein oder mehrere N-substitierte Indol-3-glyoxylamide gemäss der allgemeinen Formel (1) sowie ggf. deren physiologisch verträglichen Säureadditionssalze und, sofern möglich, N-Oxide und einen pharmazeutisch verwendbaren Träger- und/oder Verdünnungs- bzw. Hilfsstoff in Form von Tabletten, Dragees, Kapseln, Lösungen zur Infusion oder Ampullen, Suppositorien, Pflaster, inhalativ einsetzbaren Pulverzubereitungen, Suspensionen, Cremes und Salben.