

## (12) BREVET D'INVENTION

- (11) N° de publication : **MA 52297 B1**
- (43) Date de publication : **31.10.2024**
- (51) Cl. internationale :  
**A61K 31/44; C07D 213/85;  
A61K 31/4433; A61K 31/4439;  
A61K 31/444; A61K 31/4545;  
A61K 31/496; A61K 31/497;  
A61K 31/501; A61K 31/506;  
A61K 31/517; A61K 31/5377;  
A61K 31/5383; A61K 31/541;  
A61K 31/55; A61K 31/551;  
A61K 31/553; A61K 31/554;  
A61P 35/00; A61P 43/00;  
A61K 31/443**

- 
- (21) N° Dépôt : **52297**
- (22) Date de Dépôt : **28.03.2019**
- (30) Données de Priorité : **29.03.2018 JP 2018063740**
- (86) Données relatives à la demande internationale selon le PCT:  
**PCT/JP2019/013531 28.03.2019**
- (71) Demandeur(s) :  
**Takeda Pharmaceutical Company Limited, 1-1, Doshomachi 4-chome, Chuo-ku, Osaka-shi, Osaka 541-0045, (JP)**
- (72) Inventeur(s) :  
**TOKUHARA, Hidekazu ; ONO, Koji ; FUJIMOTO, Jun ; CARY, Douglas Robert ; BANNO, Hiroshi ; ITO, Masahiro ; TANAKA, Toshio ; ASANO, Moriteru ; HIRAYAMA, Takaharu ; SAKAUCHI, Nobuki ; HIRATA, Yasuhiro ; TOITA, Akinori ; MORISHITA, Nao ; KOKUBO, Hironori ; IMAEDA, Yasuhiro ; MAEZAKI, Hironobu ; MIZOJIRI, Ryo ; CHO, Nobuo ; ARIKAWA, Yasuyoshi**
- (74) Mandataire :  
**SABA & CO., TMP**

---

(54) Titre : **COMPOSÉ HÉTÉROCYCLIQUE**

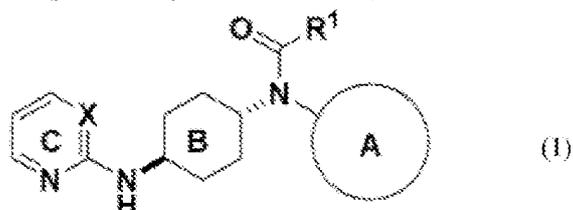
(57) Abrégé : L'invention concerne un composé qui peut avoir un effet inhibiteur de CDK12 et qui est prévu pour être utile en tant que médicament préventif ou thérapeutique pour le

cancer et similaires. Le composé ou son sel est représenté par la formule (I) (dans laquelle chaque symbole dans la formule est tel que défini dans la description).

1

## REVENDEICATIONS

1. Composé représenté par la formule (I) :



dans laquelle

- 5    -- X représente un chaînon symbolisé par CH ou N,  
       -- R<sup>1</sup> représente un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de  
       substituant(s), un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou  
       de substituant(s), un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un  
 10    ou de substituant(s), un groupe hétérocyclique, en option porteur  
       d'un ou de substituant(s), ou un groupe symbolisé par --NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>,  
       -- R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène ou un substituant,  
       -- R<sup>3</sup> représente un substituant,  
       -- le cycle A est un cycle aromatique, en option porteur d'un autre  
       ou d'autres substituant(s),  
 15    -- le cycle B est un cycle cyclohexane, en option porteur d'un autre  
       ou d'autres substituant(s),  
       -- et le cycle C est un hétérocycle aromatique azoté à six chaînons,  
       en option porteur d'un autre ou d'autres substituant(s),  
       ou sel d'un tel composé.

20

2. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel

- R<sup>1</sup> représente  
 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s)  
    choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un  
 25    ou de substituant(s), un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option  
    porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe hétérocyclique  
    aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur  
    d'un ou de substituant(s),

- 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 3) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 4) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi des groupes aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteurs d'un ou de substituant(s).
- 5) ou un groupe symbolisé par  $-NR^2R^3$ , où R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi des groupes aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteurs d'un ou de substituant(s), et R<sup>3</sup> représente (i) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s), ou (ii) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s) ;
- le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en C<sub>6-14</sub> ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
- 1) un atome d'halogène,
  - 2) un groupe cyano,
  - 3) un groupe hydroxyle,
  - 4) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),

- 5) un groupe alcényle en C<sub>2-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 6) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 5 7) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 9) un groupe carboxyle,
- 10) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 10 11) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle),
- 12) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) ;
- 15 – le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,
- et le cycle C est un cycle pyridine (si X représente CH) ou un cycle pyrimidine (si X représente N), chacun d'eux porteur, en option, de
- 20 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
  - 1) un atome d'halogène,
  - 2) un groupe cyano,
  - 3) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 25 4) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 5) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 6) un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 30 7) un groupe hétérocycloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 9) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de substituant(s),

- 10) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle),
- 5 11) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s).

3. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel
- 10 – R<sup>1</sup> représente
- 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, et un groupe hétérocyclique aromatique com-
- 15 portant de 5 à 14 chaînons,
- 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
- 3) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>,
- 20 4) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) aryle en C<sub>6-14</sub> en tant que substituant(s),
- 5) ou un groupe symbolisé par –NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, où R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) aryle en C<sub>6-14</sub> en tant que substituant(s), et R<sup>3</sup>
- 25 représente (i) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, (b) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe cyano, un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle et un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonylamino, (c) un
- 30 groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, et (d) un groupe hétérocyclique aromatique comportant

- de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub> et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, ou (ii) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub> ;
- 5 – le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en C<sub>6-14</sub> ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
- 1) un atome d'halogène,  
2) un groupe cyano,  
10 3) un groupe hydroxyle,  
4) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et (c) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),  
15 5) un groupe alcényle en C<sub>2-6</sub>,  
6) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe cyano, (c) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et (d) un groupe carbamyle,  
20 7) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>,  
8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en tant que substituant(s), (b) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe cyano et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et  
25 (c) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s).  
9) un groupe carboxyle,  
30 10) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),  
11) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe cyano, (c) un groupe

- alkyle en C<sub>1-6</sub>, (d) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (e) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (f) un groupe carbamyle, (g) un groupe mono(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino ou di(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino, et (h) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle).
- 5
- 12) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe hydroxyle, un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, un groupe carbamyle, un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, (c) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (d) un groupe amino, (e) un groupe carboxyle, (f) un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (g) un groupe carbamyle, et (h) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons :
- 10
- 15
- le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,
  - 20 – et le cycle C est un cycle pyridine (si X représente CH) ou un cycle pyrimidine (si X représente N), chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
    - 1) un atome d'halogène,
    - 2) un groupe cyano,
    - 25 3) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s),
    - 4) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe cyano, (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (d) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (e) un groupe mono(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino ou di(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino, (f) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonylamino, (g) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (h) un
- 30

groupe carbamyle, (i) un groupe sulfamyle, et (j) un groupe hétérocyclyl-sulfonyle non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons.

- 5) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, et (b) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),
- 6) un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle en tant que substituant(s),
- 7) un groupe hétérocycloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons,
- 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (i) un atome d'halogène, (ii) un groupe hydroxyle, (iii) un groupe cyano, (iv) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s), (v) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle et un groupe sulfamyle, (vi) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (vii) un groupe mono-(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino ou di(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino, (viii) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyl-amino, (ix) un groupe carbamyle, (x) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, (xi) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un substituant oxo et un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, et (xii) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi les groupes hétérocycliques aromatiques comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteurs de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub> et un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-[(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyl]-amino, (b) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur

- de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s), et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s) (ce groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub> inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle),
- 5 (c) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle en tant que substituant(s), (d) un groupe (cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>)-carbonyle, (e) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un substituant oxo, un groupe hydroxyle et un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub> (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spiro-
- 10 cycle), et (f) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
- 15 9) un groupe carbamyle,
- 10) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un atome d'halogène, (c) un groupe hydroxyle, (d) un groupe cyano, (e) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (f) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, (g) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (h) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (i) un groupe carbamyle, (j) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, (k) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-[(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyl]-amino, (l) un groupe diméthyl(oxyde)-λ<sup>6</sup>-sulfanylidène-amino et (m) un groupe méthyl-imino (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle).
- 20
- 25
- 30

- 11) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe hydroxyle, (c) un groupe cyano, (d) un atome d'halogène, (e) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe hydroxyle, un atome d'halogène, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle et un groupe carbamyle, (f) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (g) un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (h) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, et (i) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons.

4. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel

- R<sup>1</sup> représente
- 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
  - 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe aryle en C<sub>6-14</sub> et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
  - 3) ou un groupe symbolisé par –NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, où R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène et R<sup>3</sup> représente un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), et (b) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons ;
- le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en C<sub>6-14</sub> ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, et (c) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,

- en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi les groupes alcoxy en C<sub>1-6</sub> ;
- le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,
  - 5 - et le cycle C est un cycle pyrimidine (X représente N), en option porteur, de 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
    - 1) un groupe cyano,
    - 2) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s),
    - 10 3) un groupe hétérocycloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons,
    - 4) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s), et (b)  
15 un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une  
20 structure de spirocycle),
    - 5) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, et (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s)  
25 hydroxyle en tant que substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle),
    - 6) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14  
30 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe cyano, (b) un atome d'halogène, (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, et (d) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle.

## 5. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel

-- R<sup>1</sup> représente

- 5 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 10 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 20 3) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 4) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- 25 5) ou un groupe symbolisé par --NR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>, où R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi les groupes aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), et R<sup>3</sup> représente (i) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un
- 30

- groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s), un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s), et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s),
- (ii) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s), ou (iii) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s) ;
- le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en C<sub>6-14</sub> ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
- 1) un atome d'halogène,
  - 2) un groupe cyano,
  - 3) un groupe hydroxyle,
  - 4) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 5) un groupe alcényle en C<sub>2-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 6) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 7) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 9) un groupe carboxyle,
  - 10) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de substituant(s),
  - 11) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle),

- 12) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) ;
- le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,
  - 5 - et le cycle C est un cycle pyridine (si X représente CH) ou un cycle pyrimidine (si X représente N), chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
    - 1) un atome d'halogène,
    - 2) un groupe cyano,
    - 10 3) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 4) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 5) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 15 6) un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 7) un groupe hétérocycloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 20 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 9) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de substituant(s),
    - 10) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons
    - 25 inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle),
    - 11) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur d'un ou de substituant(s).
- 30 6. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel
- R<sup>1</sup> représente

- 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>,
- 5 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, (c) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène et un groupe amino, (d) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, (e) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (f) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s), (g) un groupe hétéro-cyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), et (h) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
- 15 3) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub> et un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>,
- 20 4) ou un groupe symbolisé par  $-NR^2R^3$ , où R<sup>2</sup> représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, et R<sup>3</sup> représente (i) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, (c) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène et un groupe amino, (d) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (e) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (f) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s), (g) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, et (h) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, ou (ii) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s) ;
- 25
- 30

- le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en C<sub>6-14</sub> ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
  - 5 1) un atome d'halogène,
  - 2) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène et (b) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>,
  - 10 3) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et (c) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),
  - 15 4) un groupe carbamyle, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s), en option porteur(s) d'un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant,
  - 20 5) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle),
  - 25 6) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, et un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, (c) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, (d) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (e) un groupe amino, (f) un groupe carboxyle, (g) un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, et (h) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons ;
- 30 – le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,
- et le cycle C est un cycle pyrimidine (X représente N), en option porteur, de 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
  - 1) un atome d'halogène,

- 2) un groupe cyano,
- 3) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s),
- 4) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe cyano, (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (d) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (e) un groupe mono(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino ou di(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino, (f) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyl-amino, (g) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (h) un groupe carbamyle, (i) un groupe sulfamyle, et (j) un groupe hétérocyclyl-sulfonyle non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons,
- 5) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, et (c) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),
- 6) un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle en tant que substituant(s),
- 7) un groupe hétérocyclyloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substituant(s),
- 8) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (i) un atome d'halogène, (ii) un groupe hydroxyle, (iii) un groupe cyano, (iv) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s), (v) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle et un groupe sulfamyle, (vi) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s)

- d'halogène en tant que substituant(s), (vii) un groupe mono-(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino ou di(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-amino, (viii) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyl-amino, (ix) un groupe carbamyle, (x) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, (xi) un groupe
- 5 hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un substituant oxo et un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, et (xii) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe
- 10 alkyle en C<sub>1-6</sub>, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub> et un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-[(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyl]-amino, (b) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe hydroxyle, un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s)
- 15 hydroxyle en tant que substituant(s), et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s) (ce groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub> inclut aussi un groupe présentant une structure de spirocycle), (c) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle en tant que substituant(s), (d) un groupe (cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>)-carbonyle, (e) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un substituant oxo, un groupe hydroxyle et un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub> (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle), et (f) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
- 20
- 25
- 9) un groupe carbamyle,
- 30 10) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un atome d'halogène, (c) un groupe hydroxyle, (d) un groupe cyano, (e) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi

- un atome d'halogène, un groupe hydroxyle et un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (f) un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, (g) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (h) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle,
- 5 (i) un groupe carbamyle, (j) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, (k) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-[(alkyle en C<sub>1-6</sub>)-carbonyl]-amino, (l) un groupe diméthyl(oxyde)-λ<sup>6</sup>-sulfanylidène-amino et (m) un groupe méthyl-imino (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant
- 10 une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle),
- 11) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe hydroxyle, (c) un
- 15 groupe cyano, (d) un atome d'halogène, (e) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un groupe hydroxyle, un atome d'halogène, un groupe cycloalkyle en C<sub>3-10</sub>, un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle et un groupe carbamyle, (f) un groupe cycloalkyle
- 20 en C<sub>3-10</sub>, (g) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, (h) un groupe (alcoxy en C<sub>1-6</sub>)-carbonyle, (i) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle, et (j) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons.
- 25 7. Composé conforme à la revendication 1, dans lequel
- ... R<sup>1</sup> représente
- 1) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi un atome d'halogène, un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, et un groupe aryloxy en C<sub>6-14</sub>,
- 30 2) un groupe alcoxy en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, (c) un groupe aryle en C<sub>6-14</sub>, (d) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux groupe(s) alkyle en C<sub>1-6</sub> en tant que substi-

- tuant(s), et (e) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons,
- 3) ou un groupe symbolisé par  $-NR^2R^3$ , où  $R^2$  représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle en  $C_{1-6}$ , et  $R^3$  représente un
- 5 groupe alkyle en  $C_{1-6}$ , en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, (c) un groupe cycloalkyle en  $C_{3-10}$ , en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), (d) un groupe aryle en  $C_{6-14}$ , en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant
- 10 que substituant(s), et (e) un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons :
- le cycle A est un cycle aromatique hydrocarboné en  $C_{6-14}$  ou un hétérocycle aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, chacun d'eux porteur, en option, de 1 à 5 autre(s) substituant(s) choisi(s)

15 parmi les groupes hétérocycliques aromatiques comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteurs de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un substituant oxo, (b) un groupe alkyle en  $C_{1-6}$ , et (c) un groupe alcoxy en  $C_{1-6}$ ,

  - le cycle B est un cycle cyclohexane qui ne porte pas d'autre substituant,

20

  - et le cycle C est un cycle pyrimidine (X représente N), en option porteur de 1 à 3 autre(s) substituant(s) choisi(s) parmi
    - 1) un groupe cyano,
    - 2) un groupe alkyle en  $C_{1-6}$ , en option porteur de 1 à 3 atome(s)

25 d'halogène en tant que substituant(s),

    - 3) un groupe hétérocycloxy non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons,
    - 4) un groupe amino, en option porteur d'un ou de deux substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe alkyle en  $C_{1-6}$ , en option porteur

30 de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s), et (b) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) alkyle en  $C_{1-6}$  en tant que substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant

une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle).

- 5) un groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un atome d'halogène, (b) un groupe hydroxyle, et (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 groupe(s) hydroxyle en tant que substituant(s) (ce groupe hétérocyclique non-aromatique comportant de 3 à 14 chaînons inclut aussi un groupe présentant une structure bicyclique, une structure de cycle à pont, ou une structure de spirocycle),
- 6) et un groupe hétérocyclique aromatique comportant de 5 à 14 chaînons, en option porteur de 1 à 3 substituant(s) choisi(s) parmi (a) un groupe cyano, (b) un atome d'halogène, (c) un groupe alkyle en C<sub>1-6</sub>, en option porteur de 1 à 3 atome(s) d'halogène en tant que substituant(s), et (d) un groupe (alkyle en C<sub>1-6</sub>)-sulfonyle.

8. Médicament comprenant un composé conforme à la revendication 1 ou un sel d'un tel composé.

9. Médicament, conforme à la revendication 8, pour utilisation en tant qu'inhibiteur de CDK12.

10. Médicament, conforme à la revendication 8, pour utilisation en tant que médicament prophylactique ou thérapeutique contre un cancer.

11. Composé conforme à la revendication 1, qui est de la 1-(trans-4-((4-(4-chloro-1H-pyrazol-3-yl)-5-(trifluorométhyl)-pyrimi-

din-2-yl)-amino)-cyclohexyl)-3-(2,2-difluoro-éthyl)-1-(5-(2-méthoxy-pyrimidin-5-yl)-pyridin-2-yl)-urée, ou un sel de ce composé.

5 12. Composé conforme à la revendication 1, qui est de la 1-(trans-4-((4-(1-(difluorométhyl)-1H-pyrazol-3-yl)-5-(trifluorométhyl)-pyrimidin-2-yl)-amino)-cyclohexyl)-3-éthyl-1-(5-(1-méthyl-1H-pyrazol-4-yl)-pyrazin-2-yl)-urée, ou un sel de ce composé.

10 13. Composé conforme à la revendication 1, qui est du N-(trans-4-((4-(5-(méthanesulfonyl)-pyridin-3-yl)-5-(trifluorométhyl)-pyrimidin-2-yl)-amino)-cyclohexyl)-N-(5-(2-méthoxy-pyrimidin-5-yl)-pyrazin-2-yl)-butanamide, ou un sel de ce composé.

15 14. Composé conforme à la revendication 1, qui est de la 1-(trans-4-((4-(1-(difluorométhyl)-1H-pyrazol-3-yl)-5-(trifluorométhyl)-pyrimidin-2-yl)-amino)-cyclohexyl)-3-(2-hydroxy-2-méthyl-propyl)-1-(5-(2-méthoxy-pyrimidin-5-yl)-pyrazin-2-yl)-urée, ou un sel de ce composé.

20 15. Composé conforme à la revendication 1, qui est du (trans-4-((4-(5-(méthanesulfonyl)-pyridin-3-yl)-5-(trifluorométhyl)-pyrimidin-2-yl)-amino)-cyclohexyl)-(5-(2-méthoxy-pyrimidin-5-yl)-pyrazin-2-yl)-carbamate de 2-hydroxy-2-méthyl-propyle, ou un sel de ce composé.