

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21)(22) Заявка: 2017128123, 07.08.2017

Приоритет(ы):

(22) Дата подачи заявки: 07.08.2017

(43) Дата публикации заявки: 07.02.2019 Бюл. № 04

Адрес для переписки:

198515, Санкт-Петербург, Петродворцовый р-н, п. Стрельна, ул. Связи, 34, лит. А, ЗАО "БИОКАД"

(71) Заявитель(и):

Закрытое Акционерное Общество "БИОКАД" (RU)

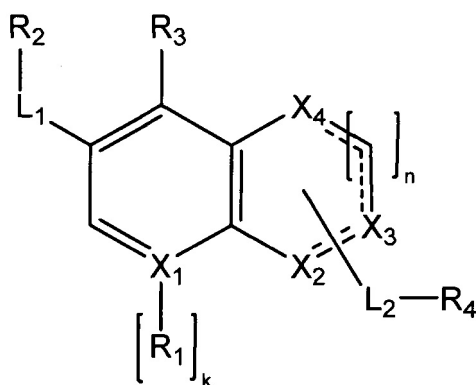
(72) Автор(ы):

Миндич Алексей Леонидович (RU),
Горбунова Светлана Леонидовна (RU),
Попкова Александра Владимировна (RU),
Шеховцов Артем Евгеньевич (BY),
Алафинов Андрей Иванович (RU),
Алешунин Павел Александрович (RU),
Евдокимов Антон Александрович (RU),
Завьялов Кирилл Вадимович (RU),
Кожемякина Наталья Владимировна (RU),
Мишина Мария Сергеевна (RU),
Рехарский Михаил Владимирович (RU),
Честнова Анна Юрьевна (RU),
Яковлев Павел Андреевич (RU)

(54) Новые гетероциклические соединения как ингибиторы CDK8/19

(57) Формула изобретения

1. Соединение формулы I:

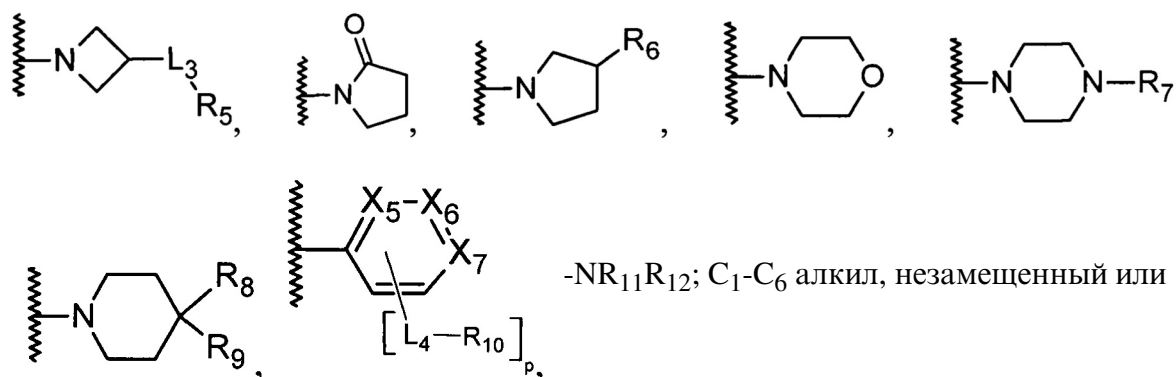
или его фармацевтически приемлемая соль, или его стереоизомер,
где X₁ представляет собой N, C, CH;X₂, X₃, X₄ каждый независимо представляет собой C(H)_m, NH, N, CR₁₃;L₁, L₂ каждый независимо представляет собой химическую связь, -C(R₆)₂-, -O-, -C(O)-, -NH-, -C(=NR₁₉)-

n, k каждый независимо выбран из 0, 1;

m представляет собой 0, 1, 2;

R₁, R₃, R₁₃ каждый независимо представляет собой H, Hal, циано, C₁-C₆ алкил;

R₂, R₄ каждый независимо выбран из группы, состоящей из:



замещенный одним или несколькими заместителями R₁₄;

X₅, X₆, X₇ каждый независимо представляет собой C, CH, N;

L₃, L₄ каждый независимо представляет собой химическую связь, -C(O)-, -O-, -CH₂-, -NH-, -C(O)-NR₇-, -C(=NH)-;

p=0, 1, 2, 3, 4;

R₅ представляет собой H; Hal; циано; C₁-C₆ алкил; C₁-C₆ алкилокси; C₁-C₆ алкилокси C₁-C₆ алкил; NR₁₅R₁₆; арил, незамещенный или замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из Hal, C₁-C₆ алкила, C₁-C₆ алкилокси, NR₁₅R₁₆; 5-6 членный гетероцикл с 1-2 гетероатомами, выбранными из N и/или O, незамещенный или замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из Hal, C₁-C₆ алкила, C₁-C₆ алкилокси, NR₁₅R₁₆;

R₆ каждый независимо представляет собой H, Hal, гидрокси, C₁-C₆ алкилокси;

R₇ каждый независимо представляет собой H, C₁-C₆ алкил;

R₈, R₉ каждый независимо представляет собой H, C₁-C₆ алкил, -C(O)-NR₂₁R₂₂, -CN, -C(O)-OR₂₀; или

R₈ и R₉ вместе с атомом углерода, к которому они присоединены, образуют 5-6-членное гетероциклическое кольцо с 1-2 гетероатомами, выбранными из азота и/или кислорода, где гетероциклическое кольцо, образованное R₈ и R₉, может быть незамещенным или замещенным 1 или 2 заместителями, выбранными из оксо группы, C₁-C₆ алкила;

R₁₀ каждый независимо выбирают из группы, состоящей из H, Hal, C₁-C₆ алкила, гидрокси, циано, C₁-C₆ алкилокси, C₁-C₆ алкилокси C₁-C₆ алкила, -NR₂₃R₂₄; 5-6 членного гетероцикла с 1-2 гетероатомами, выбранными из N, O и/или S, незамещенного или замещенного одним или несколькими C₁-C₆ алкилами; 5-6 членного гетероарила с 1-2 гетероатомами, выбранными из N, O и/или S, незамещенного или замещенного одним или несколькими C₁-C₆ алкилами; -S(O)₂-C₁-C₆ алкила;

R₁₁, R₁₂ каждый независимо представляет собой H, гидрокси, C₁-C₆ алкил, C₁-C₆ алкокси, C₁-C₆ алкилокси C₁-C₆ алкил;

R₁₄ каждый независимо представляет собой Hal, -C(O)NR₁₇R₁₈;

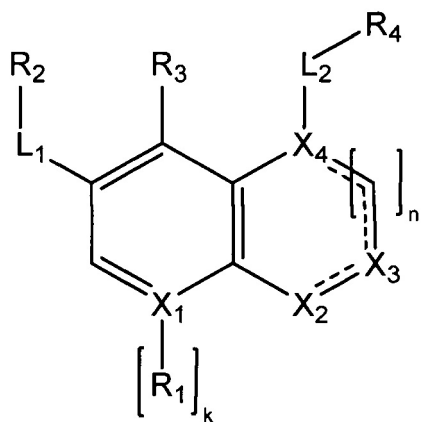
R₁₅, R₁₆, R₂₁, R₂₂, R₂₃, R₂₄ каждый независимо представляет собой H, C₁-C₆ алкил;

R₁₇, R₁₈ каждый независимо представляет собой H, C₁-C₆ алкил; арил, незамещенный

или замещенный одним или несколькими заместителями, выбранными из группы, состоящей из Hal, C₁-C₆ алкила, C₁-C₆ алкилокси; R₁₉, R₂₀ каждый независимо представляет собой H, C₁-C₆ алкил;

----- каждая независимо представляет собой одинарную связь или двойную связь; Hal представляет собой хлор, бром, йод, фтор.

2. Соединение по п. 1, представляющее собой соединение формулы I.1:



I.1,

где X₄ представляет собой C(H)_m, NH, N;

m представляет собой 0, 1;

X₁, X₂, X₃, L₁, L₂, R₁, R₂, R₃, R₄, R₁₃, n, k, ----- имеют вышеуказанное значение.

3. Соединение по пп. 1 и 2, где R₁, R₃ каждый независимо представляет собой H, Hal.

4. Соединение по пп. 1 и 2, где L₁, L₂ каждый независимо представляет собой химическую связь, -C(O)-, -NH-, -C(=NH)-.

5. Соединение по пп. 1 и 2, представляющее собой:

1-(1-(4-((Метилсульфонил)карбамоил)фенил)-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-N-фенилазетидин-3-карбоксамид (BCD-CDK8-1-1)

4-(6-Азетидин-1-карбонил)-1H-бензо[d]имидазол-1-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-1-2)

(1-(4-(1H-Пиразол-4-ил)фенил)-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)(пиперидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-1-3)

(1-(1-(4-(1H-пиразол-4-ил)фенил)-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-4)

(1-(4-(1H-Пиразол-4-ил)фенил)-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)(азетидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-1-5)

Метил-4-(6-(3-(фенилкарбамоил)азетидин-1-ил)-1H-бензо[d]имидазол-1-ил)бензоат (BCD-CDK8-1-6E)

4-(6-(3-(фенилкарбамоил)азетидин-1-ил)-1H-бензо[d]имидазол-1-ил) бензойная кислота (BCD-CDK8-1-6A)

1-(1-(4-Карбамоилфенил)-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-N-фенилазетидин-3-карбоксамид (BCD-CDK8-1-6)

Метил-4-(6-(3-(фенилкарбамоил)азетидин-1-ил)-4-фтор-1H-бензо[d]имидазол-1-ил) бензоат (BCD-CDK8-1-7E)

4-(6-(3-(Фенилкарбамоил)азетидин-1-ил)-4-фтор-1H-бензо[d]имидазол-1-ил) бензойная кислота (BCD-CDK8-1-7A)

1-(1-(4-Карбамоилфенил)-4-фтор-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)-N-фенилазетидин-3-карбоксамид (BCD-CDK8-1-7)

(1-(1-(4-(1H-Пиразол-4-ил)фенил)-4-фтор-1H-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-8)

(1-(1-(4-(Диметиламино)фенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-9)

Азетидин-1-ил-(1-(4-(диметиламино)фенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил) метанон (BCD-CDK8-1-10)

(3-Метоксиазетидин-1-ил)(1-(4-метоксифенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)метанон (BCD-CDK8-1-11)

(1-(1-(4-Метоксифенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-12)

(1-(1-(4-(Диметиламино) фенил)-4-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-13)

(1-(1-(4-(1Н-Пиразол-4-ил)фенил)-7-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-14)

Метил-4-(6-(азетидин-1-карбонил)-7-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)бензоат (BCD-CDK8-1-15E)

4-(6-(Азетидин-1-карбонил)-7-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)бензойная кислота (BCD-CDK8-1-15A)

4-(6-(Азетидин-1-карбонил)-7-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)бензамид (BCD-CDK8-1-15)

(1-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)(пиперидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-1-16)

(1-(1-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-17)

Азетидин-1-ил(1-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)метанон (BCD-CDK8-1-18)

(1-(1-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-4-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-19)

(1-(1-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-7-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-6-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-1-20)

4-(6-((2-(Хлорометил)-3-оксо-3-(фениламино)пропил)амино)-4-фторо-1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)бензамид (BCD-CDK8-1-21A)

4-(6-((2-(Хлорметил)-3-оксо-3-(фениламино)пропил)амино)-4-фтор-1Н-бензо[d]имидазол-1-ил)бензойная кислота (BCD-CDK8-1-21)

(S)-4-(3-(3-Гидроксипирролидин-1-карбонил)-1,7-нафтиридин-5-ил)-N-(метансульфонил)бензамид (BCD-CDK8-3-1)

(R)-5-(4-(1Н-Пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)(3-гидроксипирролидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-3-2)

(R)-5-(4-(диметиламино)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)(3-гидроксипирролидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-3-3)

(R)-(3-Гидроксипирролидин-1-ил)(5-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-3-4)

(R)-(3-Гидроксипирролидин-1-ил)(5-(4-морфолинофенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-3-5)

(R)-(3-гидроксипирролидин-1-ил)(5-(4-метоксифенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-3-6)

(5-(4-(Диметиламино)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)(4-метилпиперазин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-3-8)

(1-(5-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)азетидин-3-ил)(морфолино)метанон (BCD-CDK8-3-9)

N-(Метилсульфонил)-4-(3-(пиперидин-1-карбонил)-1,7-нафтиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-3-11)

А
2
1
8
1
2
8
1
2
3
А
R
U

R
U
2
0
1
7
1
2
8
1
2
3
А

N,N-Диметил-1-(5-(4-((метилсульфонил)карбамоил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил) азетидин-3-карбоксамид (BCD-CDK8-3-12)

(R)-4-(3-(3-Гидроксипирролидин-1-карбонил)-1,7-нафтиридин-5-ил)-N-(метансульфонил)бензамид (BCD-CDK8-3-13)

Азетидин-1-ил-(5-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-3-14)

(3-Метоксиазетидин-1-ил(5-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-3-15)

(5-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)(пирролидин-1ил) метанон (BCD-CDK8-3-16)

(1-(5-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-ил)пирролидин-2-он (BCD-CDK8-3-17)

N-(2-Метоксиэтил)-5-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)-1,7-нафтиридин-3-карбоксамид (BCD-CDK8-3-18)

(5-(4-(Диметиламино)-3-гидроксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил)метанон (BCD-CDK8-4-1)

5-(Диметиламино)-2-(3-пиколиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-2)

(5-(3-Гидрокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил) метанон (BCD-CDK8-4-3)

5-Метокси-2-(3-пиколиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-4)

5-(4-(Диметиламино)-3-гидроксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-4-5)

5-(Диметиламино)-2-(3-никотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-6)

(5-(3-Гидрокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил) метанон (BCD-CDK8-4-7)

5-Метокси-2-(3-никотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-8)

(5-(4-(Диметиламино)-3-гидроксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-4-9)

5-(Диметиламино)-2-(3-изоникотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-10)

(5-(3-Гидрокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил) метанон (BCD-CDK8-4-11)

2-(3-Изоникотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)-5-метоксибензамид (BCD-CDK8-4-12)

5-Метокси-2-(3-(3-метоксибензоил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензамид (BCD-CDK8-4-13)

(5-(4-(Диметиламино)-3-метоксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил)метанон (BCD-CDK8-4-21)

5-(Диметиламино)-2-(3-пиколиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-22)

(5-(3-Метокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил) метанон (BCD-CDK8-4-23)

5-Метокси-2-(3-пиколиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-24)

(5-(4-(Диметиламино)-3-метоксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-4-25)

А
2
1
8
1
2
8
1
2
3
А
R
U

RU
2017128123
А

5-(Диметиламино)-2-(3-никотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-26)

(5-(3-метокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-4-27)

5-Метокси-2-(3-никотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-28)

(5-(4-(Диметиламино)-3-метоксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил)метанон (BCD-CDK8-4-29)

5-(Диметиламино)-2-(3-изоникотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-30)

(5-(3-Метокси-4-морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-4-31)

2-(3-Изоникотиноил-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)-5-метоксибензонитрил (BCD-CDK8-4-32)

(5-(4-метоксифенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-4-33)

(5-(4-(Диметиламино)фенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(3-метоксифенил)метанон (BCD-CDK8-4-34)

5-Метокси-2-(3-(3-метоксибензоил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-5-ил)бензонитрил (BCD-CDK8-4-35)

(5-(4-Морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-2-ил)метанон (BCD-CDK8-4-36)

(5-(4-Морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-4-37)

(5-(4-Морфолинофенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-4-38)

(5-(4-(Диметиламино)фенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-3-ил)метанон (BCD-CDK8-4-39)

(5-(4-(Диметиламино)фенил)-1Н-пирроло[2,3-b]пиридин-3-ил)(пиридин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-4-40)

N-(Метилсульфонил)-4-(4-(пиперидин-1-карбонил)хинолин-6-ил)бензамид (BCD-CDK8-5-1)

4-(4-(Пиперидин-1-карбонил)-2-хлорхинолин-6-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-5-1Cl)

(R)-1-((6-(4-(диметиламино)фенил)хинолин-4-ил)(имино)метил)пирролидин-3-ол (BCD-CDK8-5-2i)

(R)-(6-(4-(Диметиламино)фенил)хинолин-4-ил)(3-гидроксипирролидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-5-2)

Морфолино(6-(4-морфолинофенил)хинолин-4-ил)метанимин (BCD-CDK8-5-3i)

Морфолино(6-(4-морфолинофенил)хинолин-4-ил)метанон (BCD-CDK8-5-3)

(6-(4-(1Н-Пиразол-4-ил)фенил)хинолин-4-ил)(пиперидин-1-ил)метанимин (BCD-CDK8-5-4i)

(6-(4-(1Н-Пиразол-4-ил)фенил)хинолин-4-ил)(пиперидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-5-4)

4-(4-(Азетидин-1-карбонил)хинолин-6-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-5-5)

4-(4-(Азетидин-1-карбонил)-2-хлорхинолин-6-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-5-5Cl)

1-(6-(4-Метоксифенил)хинолин-4-ил)пирролидин-2-он (BCD-CDK8-5-6)

(S)-1-((6-(4-(диметиламино)фенил)хинолин-4-ил)(имино)метил)пирролидин-3-ол

(BCD-CDK8-5-7i)

(S)-(6-(4-(Диметиламино)фенил)хинолин-4-ил)(3-гидроксипирролидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-5-7)

(6-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-4-ил)(пиперидин-1-ил)метанимин (BCD-CDK8-5-8i)

(6-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-4-ил)(пиперидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-5-8)

1-(4-(4-Морфолинофенил)хинолин-6-ил)пиперидин-4-карбоксамид (BCD CDK8-6-1)

(S)-4-(6-(3-Гидроксипирролидин-1-карбонил)хинолин-4-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-6-2)

4-Метил-1-(4-(4-((4-метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)хинолин-6-ил)пиперидин-4-карбоксамид (BCD-CDK8-6-3)

(4-(4-(1Н-Пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-ил)(3-метоксиазетидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-6-4)

4-(6-(Азетидин-1-карбонил)хинолин-4-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-6-5)

N-(Метилсульфонил)-4-(6-(морфолин-4-карбонил)хинолин-4-ил)бензамид (BCD-CDK8-6-6)

1-(4-(4-((4-Метилпиперазин-1-ил)метил)фенил)хинолин-6-ил)пиперидин-4-карбоксамид (BCD-CDK8-6-7)

4-Метил-1-(4-(4-морфолинофенил)хинолин-6-ил)пиперидин-4-карбоксамид (BCD-CDK8-6-8)

(R)-4-(6-(3-Гидроксипирролидин-1-карбонил)хинолин-4-ил)-N-(метилсульфонил)бензамид (BCD-CDK8-6-9)

(3-Метоксиазетидин-1-ил)(4-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-ил)метанон (BCD-CDK8-6-10)

Азетидин-1-ил(4-(4-(1-метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-ил)метанон (BCD-CDK8-6-11)

(4-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-ил)(пирролидин-1-ил)метанон (BCD-CDK8-6-12)

1-(4-(4-(1-Метил-1Н-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-ил)пирролидин-2-он (BCD-CDK8-6-13)

N-(2-Метоксиэтил)-4-(4-(1-метил-1N-пиразол-4-ил)фенил)хинолин-6-карбоксамид (BCD-CDK8-6-14)

6. Способ ингибирования биологической активности циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19 у субъекта, заключающийся в контактировании циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19 с соединением по любому из пп. 1 и 2.

7. Фармацевтическая композиция, содержащая терапевтически эффективное количество соединения по любому из пп. 1 и 2, или его фармацевтически приемлемую соль, и один или несколько фармацевтически приемлемых эксципиентов, и предназначенная для профилактики или лечения заболевания, или нарушения, опосредованного активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19.

8. Фармацевтическая композиция по п. 7, предназначенная для профилактики или лечения заболевания, или нарушения, опосредованного активацией циклинзависимой протеинкиназы CDK8/19, где заболевание, или нарушение, опосредованное активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19, представляет собой онкологическое или гематоонкологическое заболевание.

9. Фармацевтическая композиция по п. 8, где онкологическое или гематоонкологическое заболевание выбирают из группы, включающей колоректальный рак, меланому, рак молочной железы, рак предстательной железы, лейкоз.

10. Способ лечения заболевания или нарушения, опосредованного активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19, включающий введение в терапевтически эффективном количестве соединения по любому из пп. 1 и 2 или фармацевтической композиции по п. 7 субъекту, нуждающемуся в таком лечении.

11. Способ лечения заболевания или нарушения по п. 10, где заболевание или нарушение, опосредованное активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19, представляет собой онкологическое или гематоонкологическое заболевание.

12. Способ лечения заболевания или нарушения по п. 11, где онкологическое или гематоонкологическое заболевание выбирают из группы, включающей колоректальный рак, меланому, рак молочной железы, рак предстательной железы, лейкоз.

13. Применение соединения по любому из пп. 1 и 2 или фармацевтической композиции по п. 7 для лечения заболевания или нарушения, опосредованного активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19, у субъекта, нуждающегося в таком лечении.

14. Применение по п. 13, где заболевание или нарушение, опосредованное активацией циклинзависимых протеинкиназ CDK8/19, представляет собой онкологическое или гематоонкологическое заболевание.

15. Применение по п. 14, где онкологическое или гематоонкологическое заболевание выбирают из группы, включающей колоректальный рак, меланому, рак молочной железы, рак предстательной железы, лейкоз.

RU 2017128123 A

RU 2017128123 A