

	(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)	(11) 공개번호 10-2018-0108822 (43) 공개일자 2018년10월04일
(51) 국제특허분류(Int. Cl.) <i>C07D 401/12</i> (2006.01) <i>A61K 31/4192</i> (2006.01) <i>A61P 25/18</i> (2006.01) <i>C07D 401/14</i> (2006.01) <i>C07D 403/12</i> (2006.01) <i>C07D 403/14</i> (2006.01) <i>C07D 405/14</i> (2006.01) <i>C07D 409/14</i> (2006.01) <i>C07D 413/12</i> (2006.01) <i>C07D 417/12</i> (2006.01) (52) CPC특허분류 <i>C07D 401/12</i> (2013.01) <i>A61K 31/4192</i> (2013.01) (21) 출원번호 10-2018-7026142 (22) 출원일자(국제) 2017년02월09일 심사청구일자 없음 (85) 번역문제출일자 2018년09월10일 (86) 국제출원번호 PCT/US2017/017093 (87) 국제공개번호 WO 2017/139428 국제공개일자 2017년08월17일 (30) 우선권주장 62/293,680 2016년02월10일 미국(US)		(71) 출원인 얀센 파마슈티카 엔.브이. 벨기에왕국 베-2340-비어세 투른호우트세베크 30 (72) 발명자 첸 갡 미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로우 3210 크로비안 크리스타 씨. 미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로우 3210 (뒷면에 계속) (74) 대리인 특허법인한성

전체 청구항 수 : 총 37 항

(54) 발명의 명칭 NR2B-선택적 NMDA 조절제로서 치환된 1,2,3-트라이아졸

(57) 요약

NR2B 수용체 리간드로서의 치환된 1,2,3-트라이아졸. 이러한 화합물은 NR2B 수용체 조절, 및 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 병상, 장애 및 상태의 치료를 위한 약제학적 조성물 및 방법에 사용될 수 있다.

(52) CPC특허분류

A61P 25/18 (2018.01)
C07D 401/14 (2013.01)
C07D 403/12 (2013.01)
C07D 403/14 (2013.01)
C07D 405/14 (2013.01)
C07D 409/14 (2013.01)
C07D 413/12 (2013.01)
C07D 417/12 (2013.01)

(72) 발명자

코트 헤더 알.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

드보락 커트 에이.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

게린 크리스틴 에프.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

히스콕스 애플튼

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

레타빅 마이클 에이.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

리쉬 제이슨 씨.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

소요테-존슨 아키노라

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

스텐느 브라이스

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

윌 제시카 엘.

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

장 웨이

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로
우 3210

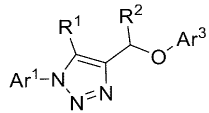
명세서

청구범위

청구항 1

화학식 (I)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (I)]



상기 식에서,

Ar¹은

(a) 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬 및 OC₁₋₆퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C₃₋₆사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

(b) 피리디닐; 할로, CH₃, CF₃ 및 CF₂H로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

(c) CF₃로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

R¹은 H, 할로 또는 CH₃이고;

R²은 H 또는 CH₃이며;

Ar³은

(a) 피리디닐; Cl, F, CH₃, OCH₃, CF₃ 및 C(CH₃)₂OH로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

(b) 피리다지닐; CH₃, OCH₃ 및 CF₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

(c) 피리미딘-4-일; Cl, CH₃, CF₃ 및 OCH₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

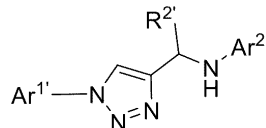
(d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

(e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 2

화학식 (II)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (II)]



상기 식에서,

Ar¹은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

R²은 H 또는 CH₃이고;

Ar²은

(a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

(b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 또는 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 3

제1항에 있어서, R¹은 H, F, I 또는 CH₃인 화합물.

청구항 4

제1항에 있어서, R¹은 H인 화합물.

청구항 5

제1항에 있어서, R²은 H인 화합물.

청구항 6

제1항에 있어서, Ar¹이 Br, Cl, F, CH₃, CF₃, CHF₂, CF₂CH₃, CH(CH₃)₂, OCHF₂ 및 OCF₃로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐인 화합물.

청구항 7

제1항에 있어서, Ar¹이 3-브로모페닐, 3-플루오로페닐, 4-플루오로페닐, 4-클로로페닐, 2-메틸페닐, 3-메틸페닐, 4-메틸페닐, 3-아이소프로필페닐, 3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(트라이플루오로메톡시)페닐, 4-(트라이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)페닐 또는 4-(다이플루오로메톡시)페닐인 화합물.

청구항 8

제1항에 있어서, Ar¹이 Br, Cl, F, CH₃, CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, CF₃, CF₂H, CF₂CH₃, CH₂CH₂CH₂Cl, CH₂CH₂CH₂F, OCH₃,

OCF₂H, OCH₂CH₂F, 사이클로프로필 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐인 화합물.

청구항 9

제1항에 있어서, Ar¹이 2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐, 3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로-페닐 또는 2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐인 화합물.

청구항 10

제1항에 있어서, Ar¹이 6-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-브로모-피리딘-4-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일, 5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일 또는 피리딘-4-일인 화합물.

청구항 11

제1항에 있어서, Ar¹이 6-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-브로모-피리딘-4-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일인 화합물.

청구항 12

제1항에 있어서, Ar¹이 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐, 3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐 또는 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일인 화합물.

청구항 13

제1항에 있어서, Ar³가 피리딘-2-일, 3-플루오로-피리딘-2-일, 6-플루오로-피리딘-2-일, 3-클로로-피리딘-2-일, 5-클로로-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 5-메틸-피리딘-2-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 3-메톡시-피리딘-2-일, 2-메톡시-피리딘-3-일, 2-메틸-피리딘-5-일, 2,3-다이메틸-피리딘-2-일, 5-클로로-3-메톡시-피리딘-2-일 또는 2-클로로-5-메틸-피리딘-4-일인 화합물.

청구항 14

제1항에 있어서, Ar³가 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₃알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₃알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₃퍼할로알킬, OC₁₋₃알킬, OC₁₋₃퍼할로알킬, NH₂; NH(CH₃), N(CH₃)₂, NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일 및 1-메틸피라졸-3-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일인 화합물.

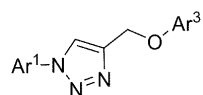
청구항 15

제1항에 있어서, Ar³가 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 CH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일인 화합물.

청구항 16

제1항에 있어서, 화학식 (IA)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (IA)]



상기 식에서,

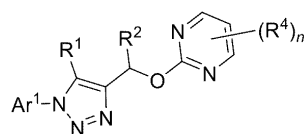
Ar¹은 할로, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

Ar³는 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 3-클로로-피리딘-2-일, 5-클로로-피리딘-2-일, 3-플루오로-피리딘-2-일, 6-플루오로-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-5-일, 5-메틸-피리딘-2-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 2,3-다이메틸-피리딘-6-일, 2-클로로-5-메틸피리딘-4-일, 3-메톡시-피리딘-2-일, 2-메톡시-피리딘-3-일, 2-(피리딘-3-일)프로판-2-올, 5-클로로-3-메톡시-피리딘-2-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 피리다진-3-일, 피라진-2-일, 5-메틸피라진-2-일, 5-플루오로-피라진-2-일 및 (2-티에닐)피라진-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 17

제1항에 있어서, 화학식 (IB)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (IB)]



상기 식에서,

Ar¹은 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

R¹은 H, F, I 및 CH₃로 이루어진 군으로부터 선택되고;

R²는 H 또는 CH₃이며;

n은 0, 1 또는 2이고;

R⁴는 각각 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂, NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴린, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일 및 1-메틸피라졸-3-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

청구항 18

제17항에 있어서,

Ar¹은 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐, 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(2-플루오로메톡시)페닐, 3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(3-플루

오로프로필)페닐, 3-브로모-4-플루오로-페닐, 2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-클로로-3-메톡시-페닐, 4-플루오로-3-아이소프로필-페닐, 3-클로로-4-플루오로-페닐, 3-에틸-4-플루오로-페닐, 3,4-다이플루오로페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐 및 3,5-다이메틸페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

R^1 은 H이고;

R^2 는 H이며;

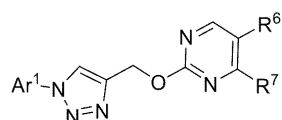
n 은 1 또는 2이고;

R^4 는 각각 Cl, F, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬, CH_2OH , CH_2OCH_3 , $C(CH_3)_2(OH)$, OCH_3 , OC_{1-3} 퍼할로알킬, $C(=O)CH_3$ 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 화합물.

청구항 19

제1항에 있어서, 화학식 (IC)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (IC)]



상기 식에서,

Ar^1 은 2-브로모-피리딘-4-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-브로모-6-메틸-피리딘-2-일, 5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일 및 5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

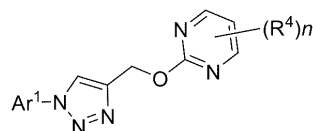
R^6 는 Cl, F, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 및 OCH_3 로 이루어진 군으로부터 선택되고;

R^7 은 H 또는 CH_3 이다.

청구항 20

제1항에 있어서, 화학식 (ID)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (ID)]



상기 식에서,

Ar^1 은 Br, Cl, F, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬 및 OC_{1-3} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐이며;

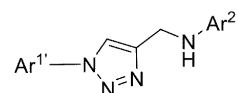
n 은 0, 1 또는 2이고;

R^4 는 각각 Br, Cl, F, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬, OCH_3 , $OCHF_2$, CH_2OH , CH_2OCH_3 , $CH(CH_3)(OH)$, $C(OH)(CH_3)_2$, $C(OCH_3)(CH_3)_2$, $C(OH)(CH_3)(CF_3)$, NH_2 , $NH(CH_3)$, $N(CH_3)_2$, $C(=O)CH_3$, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로 아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일 및 피페리딘-1-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

청구항 21

제2항에 있어서, 화학식 (IIA)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (IIA)]



상기 식에서,

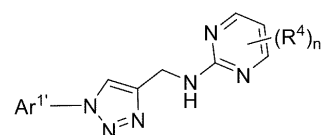
Ar¹은 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐 및 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

Ar²은 옥사졸-2-일, 피리미딘-4-일, 1-메틸-피라졸-3-일, 1-메틸-이미다졸-2-일 및 1-메틸-피라졸-4-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 22

제2항에 있어서, 화학식 (IIB)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염:

[화학식 (IIB)]



상기 식에서,

Ar¹은 3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐 및 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

n은 1 또는 2이고;

R⁴는 각각 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

청구항 23

2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;

3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;

2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;

2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;

4-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

4-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

- 3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리다진;
- 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
- 2-[[1-(4-플루오로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피라진;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-클로로-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
- 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 (R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 (S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;
 (R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;
 (S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;
 (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]-4-메틸-피리미딘;
 (R/S)-5-클로로-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

- 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-(5-브로모-6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
- 3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘;
- 5-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메틸-피리딘;
- 3-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;
- 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;
- 5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
- 5-메틸-2-((1-(4-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로-3-(옥세탄-3-일)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-플루오로-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-(트라이플루오로메틸)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
- 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸티아졸;
- 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(((5-메틸-1H-이미다졸-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트라이아졸;
- 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리딘;

2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피리딘;
 6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피리딘;
 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피라진;
 5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피라진;
 5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;
 6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-3,4-다이메틸피리다진;
 3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(트라이플루오로메틸)피리다진;
 3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메톡시피리다진;
 4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;
 4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메톡시피리미딘;
 2-((1-(5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
 2-((1-(2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
 3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메톡시피리딘;
 4-클로로-3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
 4-((1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
 5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
 2-((1-(5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
 5-메틸-2-((1-(피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 (R/S)-1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;
 [2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄올;
 [2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-카르복스아미드;
 (R/S) 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄아민;
 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;

2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;

2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;

4-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]모르폴린;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;

2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

5-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-메틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-메틸-2-[[1-(5-메틸-3-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

2-[2-[[1-(3-사이클로부틸-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[2-[[1-(4-플루오로-3-아이소프로필-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[2-[[1-(3-사이클로프로필-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[2-[[1-(3-에틸-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메틸피라졸-3-일)피리미딘;

2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;

2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;

4-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린;

2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피라진;

4-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-플루오로-피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

2-[[1-[4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;

2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;

2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-브로모페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-브로모페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메톡시-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메톡시-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 4-(메톡시메틸)-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4,5-다이메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 1-[2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메톡시-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

5-에틸-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-클로로-4-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-아이소프로필-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4,5-다이메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-4-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 [2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
 [2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;

2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 (R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
 1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 (R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 (R/S)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시에틸)피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메톡시-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 1-[2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄온;
 2-[2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 4-(메톡시메틸)-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 4-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-메톡시-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 N-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
 2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 4-(다이플루오로메틸)-2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[(1-인단-5-일트리아아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;

2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;
 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-4-아이소프로폭시피리미딘;
 메틸 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-카복실레이트;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-(2,2-다이플루오로에틸)-5-플루오로-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;
 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-플루오로-피리딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-(트라이플루오로메틸)피리딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-티에닐)피라진;
 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 [2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 (R/S)-2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복스아미드;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-카르복스아미드;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;
 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로-3-메틸아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;
 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(2-푸릴)피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]-5-요오도-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 [3H]-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일-5-t)메톡시)-5-메틸피리미딘;
 3-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;
 5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;
 2-[6-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-피리딜]프로판-2-올;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피라진;
 2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;

5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

(R/S)-1,1,1-트라이플루오로-2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;

5-메톡시-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;

5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;

1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;

(R/S)-1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;

5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;

2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복스아미드;

5-사이클로프로필-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;

4-(2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린;

5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-4-메틸피리미딘;

2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-4-메틸피리미딘-5-아민;

2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-5-아민;

2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;

5-클로로-2-[[1-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

4-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;

2-[2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-(2-플루오로에톡시)-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-에틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
 [2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-아민;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-((1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-4-아민;

- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-페닐-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
- 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 4-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
- 4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- (R)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
- N-(2,2-다이플루오로에틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘-4-아민;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
- N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;
- 1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)-N-메틸메탄아민;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
- 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
- 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
- 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
- 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
- [2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
- 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 (R/S)-2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
 [2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 (R/S)-1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;
 6-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2,3-다이메틸-피리딘;
 3-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
 (R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
 2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘;

[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 [2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-카르보니트릴;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸설포닐-피리미딘;
 1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 (R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N,N-다이메틸피리미딘-5-아민;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;

2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 5-클로로-2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
 2-[2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 [2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
 [2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
 [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
 [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-사이클로프로필-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;

2-((1-(4-(아제티딘-1-일))-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일]메톡시)-5-메틸피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;

5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;

2-[2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;

5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

4-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;

2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;

2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;

5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;

5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-에틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-클로로-4-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-메틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-에틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-에틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;

5-메틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-에틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘

5-메톡시-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

- 5-(트라이플루오로메틸)-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;
- 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;
- 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 2-(아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;
- 2-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 4-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;
- 4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피롤-2-일)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피롤-2-일)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-5-플루오로피리미딘-4-아민;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;
- N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;
- N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
- N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
- N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
- N-에틸-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘;
- 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(2-메틸-1H-이미다졸-1-

일)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;

4-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

4-((다이플루오로메톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;

(E)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 옥심;

5-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;

(Z)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-온 옥심;

(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-일)메탄올;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)-5-플루오로피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸-d2)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸-d2)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸)피리미딘;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-메톡시에틸)피리미딘;

1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-올;

2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메톡시프로판-2-일)피리미딘;

2-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)프로판-2-올;

4-((2,2-다이플루오로에톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘으로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물.

청구항 24

N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리딘-2-아민;
 N-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-이미다졸-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]옥사졸-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-4-아민;
 N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;
 N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;
 5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-플루오로-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
 5-클로로-N-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;
 5-클로로-N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메톡시-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-아이소프로필-피리미딘-2-아민;
 5-사이클로프로필-N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-4,5-다이메틸-피리미딘-2-아민;
 N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
 5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;

N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸아미노]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-에틸피리미딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;
 5-클로로-N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4-메틸피리미딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-이미다졸-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;
 N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민; 및
 N-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민으로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염.

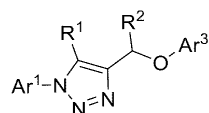
청구항 25

2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;
 [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
 [2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘; 및
 5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘으로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염.

청구항 26

(A) 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물;

[화학식 (I)]



상기 식에서,

Ar¹은

(a) 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬 및 OC₁₋₆퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C₃₋₆사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

(b) 피리디닐; 할로, CH₃, CF₃ 및 CF₂H로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

(c) CF₃로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

R¹은 H, 할로 또는 CH₃이고;

R²는 H 또는 CH₃이며;

Ar³는

(a) 피리디닐; Cl, F, CH₃, OCH₃, CF₃ 및 C(CH₃)₂OH로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

(b) 피리다지닐; CH₃, OCH₃ 및 CF₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

(c) 피리미딘-4-일; Cl, CH₃, CF₃ 및 OCH₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCHF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

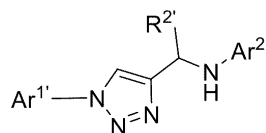
(d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

(e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 27

(A) 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용 가능한 염의 유효량; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물;

[화학식 (II)]



상기 식에서,

Ar^{1'}은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

R^{2'}은 H 또는 CH₃이고;

Ar²는

(a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

(b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 또는 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 28

적어도 하나의 제23항의 화합물의 유효량 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물.

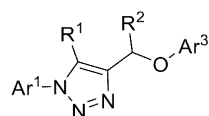
청구항 29

적어도 하나의 제24항의 화합물의 유효량 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물.

청구항 30

NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법:

[화학식 (I)]



상기 식에서,

Ar¹은

(a) 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬 및 OC₁₋₆퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C₃₋₆사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

(b) 피리디닐; 할로, CH₃, CF₃ 및 CF₂H로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

(c) CF₃로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

R¹은 H, 할로 또는 CH₃이고;

R²는 H 또는 CH₃이며;

Ar³는

(a) 피리디닐; Cl, F, CH₃, OCH₃, CF₃ 및 C(CH₃)₂OH로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

(b) 피리다지닐; CH₃, OCH₃ 및 CF₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

(c) 피리미딘-4-일; Cl, CH₃, CF₃ 및 OCH₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCHF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

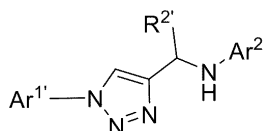
(d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

(e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 31

NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법:

[화학식 (II)]



상기 식에서,

Ar^{1'}은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

R^{2'}은 H 또는 CH₃이고;

Ar²는

(a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

(b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 또는 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

청구항 32

제30항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 의학적 상태는 양극성 장애, 주요 우울장애, 치료 저항성 우울증, 산후 우울증, 계절성 정동장애, 알츠하이머병(Alzheimer's disease), 파킨슨병(Parkinson's disease), 헌팅턴 무도병(Huntington's chorea), 다발성 경화증, 인지장애, 두부 외상, 척수 손상, 뇌졸중, 간질, 운동이상, 근위축성 측색경화증, 세균성 또는 만성 감염과 관련된 신경변성, 통증, 당뇨병성 신경병증, 편두통, 뇌허혈, 정신분열증, 뇌염, 자폐증 및 자폐증 스펙트럼 장애, 기억 및 학습 장애, 강박장애, 주의력결핍 과잉행동장애(ADHD) 및 중독증으로 이루어진 군으로부터 선택되는 방법.

청구항 33

제30항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 의학적 상태는 치료 저항성 우울증 및 주요 우울장애로 이루어진 군으로부터 선택되는 방법.

청구항 34

제32항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 의학적 상태는 중추신경계 장애인 방법.

청구항 35

제32항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 의학적 상태는 신경 또는 정신 장애인 방법.

청구항 36

제32항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 의학적 상태는 (1) 기분장애; (2) 신경증성, 스트레스 관련 또는 신체형 장애; (3) 심리적 발달장애; (4) 생리적 장애 및 신체적 요인과 관련된 행동 증후군 (behavioral syndromes associated with physiological disturbances and physical factors); (5) 추체외로 및 운동장애; (6) 우발적 및 발작적 장애; (7) 통증; (8) 신경변성 형태 또는 (9) 뇌혈관질환인 방법.

청구항 37

제36항에 있어서, 상기 신경증성, 스트레스 관련 또는 신체형 장애는 불안장애이고; 상기 우발적 또는 발작적 장애는 간질이며; 상기 뇌혈관질환은 급성 뇌혈관질환 또는 만성 뇌혈관질환인 방법.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 본 발명은 NR2B 조절 특성을 갖는 화합물, 이러한 화합물을 포함하는 약제학적 조성물, 이러한 화합물을 제조하기 위한 화학적 방법 및 동물, 특히 인간에서 NR2B 수용체 활성화와 관련된 질환의 치료에 있어서의 이들의 용도에 관한 것이다.

배경 기술

[0002] 글루타메이트는 뇌에 널리 퍼져 있는 주요 흥분성 신경전달물질 중 하나이다. 흥분성 메신저로서의 이의 역할을 나타내는 최초의 징후는 글루타메이트의 정맥내 투여가 경련을 일으킨다는 것을 알아낸 1950년대이었다. 그러나, 이의 각종 수용체를 사용한 모든 글루탐산 신경전달물질계의 검출은 다수의 길항제가 개발되거나, PCP 및 케타민의 경우와 같이 길항제로 동정된 1970년대 및 1980년대 이전에는 일어나지 않았다. 마침내, 1990년대에 분자 생물학에 의해, 글루탐산 수용체의 분류를 위한 툴(tool)이 제공되었다.

[0003] N-메틸-D-아스파르테이트 (NMDA) 수용체는 뇌에서 흥분성 시냅스 전달을 매개하는 이온 채널형 글루타메이트 수

용체의 서브타입이다. NMDA 수용체는 뇌 전체에 보편적으로 발현하며, 시냅스 가소성, 시냅스 형성, 흥분 독성, 기억 획득 및 학습에서 중요한 역할을 한다. NMDA 수용체는 정지 막전위에서 Mg^{2+} 에 의해 차단되고, 고도의 Ca^{2+} 투과성을 나타내며, 2개의 다른 신경전달물질인 글루타메이트 및 글리신 (또는 D-세린)에 의한 동시 활성화가 필요로 한다는 점에서 다른 주요 서브타입의 이온 채널형 글루타메이트 수용체 (AMPA 및 카이네이트 수용체)와는 구별된다 (문헌[Traynelis SF et al., *Pharmacol Rev.* 2010; 62(3):405-96]). NMDA 수용체를 통한 Ca^{2+} 의 유입에 의해, 신호전달 캐스케이드를 유발하여, 시냅스 유효성의 장기 증강 (LTP) 문헌[Berberich S et al., *Neuropharmacology* 2007; 52(1):77-86] 및 장기 억압 (LTD) (문헌[Massey, PV et al., *J Neurosci.* 2004 Sep 8;24(36):7821-8])을 비롯한 다양한 형태의 시냅스 가소성에 중요한 유전자 발현을 조절한다.

[0004] 대부분의 포유류 NMDA 수용체는 각각, GRIN1 유전자 및 4개의 GRIN2 유전자 중 하나에 의해 인코딩된 2개의 필수 GluN1 유닛 및 2개의 가변 GluN2 수용체 서브유닛으로 이루어진 이종사량체를 형성한다. 한쪽 또는 양쪽의 GluN2 서브유닛은 잠재적으로 GluN3A 또는 GluN3B 서브유닛으로 치환될 수 있다. GRIN1 유전자 산물은 8개의 스플라이스 변이체를 갖지만, 4개의 별개의 GluN2 서브유닛을 인코딩하는 4개의 상이한 GRIN2 유전자 (GRIN2A-D)가 있다. 글리신 결합 부위는 GluN1 서브유닛 상에 존재하고, 글루타메이트 결합 부위는 GluN2 서브유닛 상에 존재한다.

[0005] GluN2 서브유닛은 NMDA 수용체 어셈블리의 기능적 및 약리학적 특성을 결정하는데 지배적인 역할을 하며, 뇌의 다양한 영역에서 특이적인 분포를 나타낸다. 예를 들어, GluN2B 서브유닛은 주로 성체 포유류 뇌의 전뇌에서 발현되며 (문헌[Paoletti P et al., *Nat Rev Neurosci.* 2013; 14(6):383-400; Watanabe M et al., *J Comp Neurol.* 1993; 338(3):377-90]), 학습, 기억 처리, 기분, 주의력, 감정 및 통증 지각에 관여한다 (문헌[Cull-Candy S et al., *Curr Opin Neurobiol.* 2001; 11(3):327-35]).

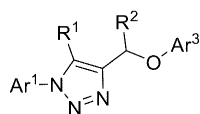
[0006] GluN2B 함유 NMDA 수용체 기능을 조절하는 화합물은 양극성 장애 (문헌[Martucci L et al., *Schizophrenia Res.* 2006; 84(2-3):214-21]), 주요 우울장애 (문헌[Miller OH et al., *eLife.* 2014; 3:e03581; Li N et al., *Biol Psychiatry.* 2011; 69(8):754-61]), 치료 저항성 우울증 (문헌[Preskorn SH et al. *J Clin Psychopharmacol.* 2008; 28(6):631-7]) 및 기분장애 (정신분열증 (문헌[Grimwood S et al., *Neuroreport.* 1999;10(3):461-5; Weickert CS et al. *Molecular Psychiatry* (2013) 18, 1185-1192]), 산전후 우울증, 계절성 정동장애 등 포함), 알츠하이머병 (문헌[Hanson JE et al., *Neurobiol Dis.* 2015; 74:254-62; Li S et al., *J Neurosci.* 2011; 31(18):6627-38]) 및 다른 치매 (문헌[Orgogozo JM et al. *Stroke* 2002, 33: 1834-1839]), 파킨슨병 (문헌[Duty S, *CNS Drugs.* 2012; 26(12):1017-32; Steece-Collier K et al., *Exp Neurol.* 2000; 163(1):239-43; Leaver KR et al. *Clin Exp Pharmacol Physiol.* 2008; 35(11):1388-94]), 헌팅턴 무도병 (문헌[Tang TS et al., *Proc Natl Acad Sci USA.* 2005; 102(7):2602-7; Li L et al., *J Neurophysiol.* 2004; 92(5):2738-46]), 다발성 경화증 (문헌[Grasselli G et al., *Br J Pharmacol.* 2013; 168(2):502-17; Farjam M et al., *Iran J Pharm Res.* 2014; 13(2):695-705]), 인지장애 (문헌[Wang D et al. 2014, *Expert Opin Ther Targets Expert Opin Ther Targets.* 2014;18(10):1121-30]), 두부 외상 (문헌[Bullock MR et al., *Ann N Y Acad Sci.* 1999; 890:51-8]), 척수 손상, 뇌졸중 (문헌[Yang Y et al., *J Neurosurg.* 2003; 98(2):397-403]), 간질 (문헌[Napolini AP et al., *Epilepsy Res.* 2012 Jun;100(1-2):12-9]), 운동장애 (예를 들어, 운동이상) (문헌[Morissette M et al., *Mov Disord.* 2006; 21(1):9-17]), 각종 신경변성 질환 (예를 들어, 근위축성 측색경화증 (문헌[Fuller PI et al., *Neurosci Lett.* 2006; 399(1-2):157-61]) 또는 세균성 또는 만성 감염과 관련된 신경변성), 녹내장 (문헌[Naskar R et al. *Semin Ophthalmol.* 1999 Sep;14(3):152-8]), 통증 (예를 들어, 만성, 암, 수술후 및 신경병성 통증 (문헌[Wu LJ and Zhuo M, *Neurotherapeutics.* 2009; 6(4):693-702]), 당뇨병성 신경병증, 편두통 (문헌[Peeters M et al., *J Pharmacol Exp Ther.* 2007; 321(2):564-72]), 뇌허혈 (Yuan H et al., *Neuron.* 2015; 85(6):1305-18), 뇌염 (문헌[Dalmau J. et al., *Lancet Neurol.* 2008; 7(12):1091-8]), 자폐증 및 자폐증 스펙트럼 장애 (문헌[Won H. et al., *Nature.* 2012; 486(7402):261-5]), 기억 및 학습 장애 (문헌[Tang, Y. P. et al., *Nature.* 1999; 401(6748):63-9]), 강박장애 (문헌[Arnold PD et al., *Psychiatry Res.* 2009;172(2):136-9]), 주의력결핍 과잉행동장애 (ADHD) (문헌[Dorval KM et al., *Genes Brain Behav.* 2007; 6(5):444-52]), PTSD (문헌[Haller J et al. *Behav Pharmacol.* 2011;22(2):113-21; Leaderbrand K et al. *Neurobiol Learn Mem.* 2014; 113:35-40]), 이명 (문헌[Guittton MJ, and Dudai Y, *Neural Plast.* 2007; 80904; Hu SS et al. 2016; 273(2): 325-332]), 수면장애 (예컨대, 기면증 또는 주간수면과다증, 특허 공개 제WO 2009058261 A1호), 현기증 및 안진 (문헌[Straube A. et al., *Curr Opin Neurol.* 2005;18(1):11-4; Starck M et al. *J Neurol.* 1997 Jan;244(1):9-16]), 신경정신학적 전신성 흥반성

루푸스 (neuropsychiatric systemic lupus erythematosus)와 같은 불안 자가면역질환 (문헌[Kowal C et al. *Proc. Natl. Acad. Sci. U.S.A.* 2006; 103, 19854-19859]) 및 중독증 (예를 들어, 알코올 중독, 약물 중독) (문헌[Nagy J, 2004, *Curr Drug Targets CNS Neurol Disord.* 2004; 3(3):169-79.]; 문헌[Shen H et al., *Proc Natl Acad Sci USA.* 2011;108(48):19407-12])을 포함하나 이에 한정되지 않는 많은 신경 질환 및 정신 질환의 치료에 유용할 수 있다.

[0007] NR2B의 임상적 중요성을 고려하여, NR2B 수용체 기능을 조절하는 화합물의 동정은 신규 치료제의 개발에 대한 매력적인 수단을 나타낸다. 이러한 화합물은 본 명세서에 제공된다.

발명의 내용

[0008] 본 발명은 본 명세서에 참고로 포함된, 본 명세서에 첨부된 독립항 및 종속항에 의해 각각 정의된 일반적인 그리고 바람직한 실시 형태에 관한 것이다. 본 발명의 한 측면은 화학식 (I)의 화합물 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염에 관한 것이다:



(I)

[0009]

[0010] 상기 식에서,

[0011] Ar¹은

[0012] (a) 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬 및 OC₁₋₆퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C₃₋₆사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

[0013] (b) 피리디닐; 할로, CH₃, CF₃ 및 CF₂H로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

[0014] (c) CF₃로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0015] R¹은 H, 할로 또는 CH₃이고;

[0016] R²는 H 또는 CH₃이며;

[0017] Ar³는

[0018] (a) 피리디닐; Cl, F, CH₃, OCH₃, CF₃ 및 C(CH₃)₂OH로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

[0019] (b) 피리다지닐; CH₃, OCH₃ 및 CF₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

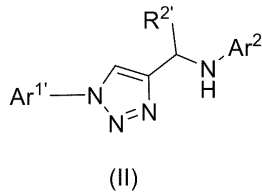
[0020] (c) 피리미딘-4-일; Cl, CH₃, CF₃ 및 OCH₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCHF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아

제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

[0021] (d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

[0022] (e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0023] 본 발명의 한 측면은 화학식 (II)의 화합물 및 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염에 관한 것이다:



[0024]

[0025] 상기 식에서,

[0026] Ar^{1'}은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0027] R^{2'}은 H 또는 CH₃이고;

[0028] Ar²는

[0029] (a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

[0030] (b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 및 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0031] 추가의 실시 형태는 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭(prodrug), 및 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물에 의해 제공된다.

[0032] 특정 실시 형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 하기 상세한 설명에 기재되거나 예시된 화학종으로부터 선택되는 화합물이다.

[0033] 특정 실시 형태에서, 화학식 (II)의 화합물은 하기 상세한 설명에 기재되거나 예시된 화학종으로부터 선택되는 화합물이다.

[0034] 추가의 측면에서, 본 발명은 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염뿐만 아니라, 이의 거울상 이성질체 및 부분입체 이성질체에 관한 것이다.

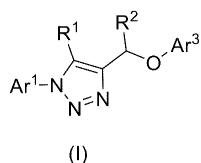
[0035] 추가의 측면에서, 본 발명은 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I)의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량을 포함하는, NR2B 수용체 활성으로 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 치료하기 위한 약제학적 조성물에 관한 것이다.

[0036] 추가의 측면에서, 본 발명은 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (II)의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량을 포함하는, NR2B 수용체 활성으로 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 치료하기 위한 약제학적 조성물에 관한 것이다.

- [0037] 본 발명에 따른 약제학적 조성물은 하나 이상의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 추가로 포함할 수 있다.
- [0038] 다른 측면에서, 본 발명의 화학적 실시 형태는 NR2B 수용체 조절제로서 유용하다. 따라서, 본 발명은 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량에 NR2B 수용체를 노출시키는 단계를 포함하는, 이러한 수용체가 대상에 존재하는 경우를 포함하여, NR2B 수용체 활성을 조절하는 방법에 관한 것이다.
- [0039] 다른 측면에서, 본 발명은 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법에 관한 것이다. 치료 방법의 추가의 실시 형태가 상세한 설명에 기재되어 있다.
- [0040] 추가의 측면에서, 본 발명은 대사 연구 (바람직하게는 ^{14}C 를 사용함), 반응 속도론 연구 (예를 들어, ^2H 또는 ^3H 를 사용함), 약물 또는 기질의 조직 분포 분석을 비롯한 검출 또는 이미징 기술 [예를 들어, 양전자 방출 단층촬영(positron emission tomography, PET) 또는 단광자 방출 컴퓨터 단층촬영(single-photon emission computed tomography, SPECT)], 또는 환자의 방사성 치료에서의 동위원소로 표지된 화합물을 연구하는 방법에 관한 것이다. 예를 들어, ^{18}F 또는 ^{11}C 표지된 화합물은 PET 또는 SPECT 연구에 특히 바람직할 수 있다.
- [0041] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) 또는 화학식 (II)의 약제학적으로 활성인 대사산물을 제조하는 방법을 포함한다.
- [0042] 본 발명의 목적은 종래의 방법 및/또는 종래 기술의 단점 중 적어도 하나를 해소하거나 개선하거나, 이에 대한 유용한 대안을 제공하는 것이다.
- [0043] 본 발명의 추가의 실시 형태, 특징 및 이점은 하기 상세한 설명 및 본 발명의 실시를 통해 명백해질 것이다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

- [0044] 일 측면에서, 화학식 (I)의 화합물 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염이 본 명세서에 제공된다:



- [0045]
- [0046] 상기 식에서,
- [0047] Ar^1 은
- [0048] (a) 할로, C_{1-6} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬 및 OC_{1-6} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C_{1-6} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬, OC_{1-6} 알킬, OC_{1-6} 퍼할로알킬, C_{3-6} 사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;
- [0049] (b) 피리디닐; 할로, CH_3 , CF_3 및 CF_2H 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및
- [0050] (c) CF_3 로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;
- [0051] R^1 은 H, 할로 또는 CH_3 이고;

- [0052] R^2 는 H 또는 CH_3 이며;
- [0053] Ar^3 는
- [0054] (a) 피리디닐; Cl, F, CH_3 , OCH_3 , CF_3 및 $C(CH_3)_2OH$ 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;
- [0055] (b) 피리다지닐; CH_3 , OCH_3 및 CF_3 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;
- [0056] (c) 피리미딘-4-일; Cl, CH_3 , CF_3 및 OCH_3 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C_{1-6} 알킬, OH 또는 OCH_3 로 치환되는 C_{1-6} 알킬, $C(OH)(CH_3)(CF_3)$, CH_2OCHF_2 , CH_2OCF_3 , $CH_2OCH_2CH_3$, $CH(NH_2)CH_3$, $CH_2NH(CH_3)$, C_{1-6} 퍼할로알킬, OC_{1-6} 알킬, OC_{1-6} 퍼할로알킬, $C(=N-OH)(CH_3)$, NH_2 , $NH(CH_3)$, $N(CH_3)_2$; $NH(CH_2CH_3)$, $NH(CH_2CHF_2)$, NH (사이클로프로필), NH (다이플루오로사이클로부틸), NH -옥세타닐, CN , $C(=O)CH_3$, $C(=O)NH(CH_3)$, $C(=O)N(CH_3)_2$, SO_2CH_3 , CO_2CH_3 , $C(CH_3)(=N-OH)$, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;
- [0057] (d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및
- [0058] (e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.
- [0059] 본 발명의 추가의 실시 형태는 R^1 이 H, F, I 또는 CH_3 인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0060] 본 발명의 추가의 실시 형태는 R^1 이 H인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0061] 본 발명의 추가의 실시 형태는 R^2 가 H인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0062] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 Br, Cl, F, CH_3 , CF_3 , CHF_2 , CF_2CH_3 , $CH(CH_3)_2$, $OCHF_2$ 및 OCF_3 로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0063] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 3-브로모페닐, 3-플루오로페닐, 4-플루오로페닐, 4-클로로페닐, 2-메틸페닐, 3-메틸페닐, 4-메틸페닐, 3-아이소프로필페닐, 3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(트라이플루오로메톡시)페닐, 4-(트라이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)페닐 또는 4-(다이플루오로메톡시)페닐인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0064] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 Br, Cl, F, CH_3 , CH_2CH_3 , $CH(CH_3)_2$, CF_3 , CF_2H , CF_2CH_3 , $CH_2CH_2CH_2Cl$, $CH_2CH_2CH_2F$, OCH_3 , OCF_2H , OCH_2CH_2F , 사이클로프로필 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0065] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐, 3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로-페닐 또는 2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0066] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 6-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-브로모-피리딘-4-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일, 5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일 또는 피리딘-4-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0067] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 6-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-브로모-피리딘-4-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일 또는 2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

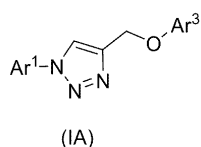
[0068] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^1 이 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-클로로-3-(2-플루오로메톡시)페닐, 3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐 또는 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0069] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^3 가 피리딘-2-일, 3-플루오로-피리딘-2-일, 6-플루오로-피리딘-2-일, 3-클로로-피리딘-2-일, 5-클로로-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 5-메틸-피리딘-2-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 피릴, 3-메톡시-피리딘-2-일, 2-메톡시-피리딘-3-일, 2-메틸-피리딘-5-일, 2,3-다이메틸-피리딘-2-일, 5-클로로-3-메톡시-피리딘-2-일 또는 2-클로로-5-메틸-피리딘-4-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0070] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^3 가 피리미딘-2-일; 할로, C_{1-3} 알킬, OH 또는 OCH_3 로 치환되는 C_{1-3} 알킬, $C(OH)(CH_3)(CF_3)$, $CH(NH_2)CH_3$, $CH_2NH(CH_3)$, C_{1-3} 퍼할로알킬, OC_{1-3} 알킬, OC_{1-3} 퍼할로알킬, NH_2 ; $NH(CH_3)$, $N(CH_3)_2$, $NH(CH_2CH_3)$, $NH(CH_2CHF_2)$, CN , $C(=O)CH_3$, $C(=O)NH(CH_3)$, $C(=O)N(CH_3)_2$, SO_2CH_3 , CO_2CH_3 , 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일 및 1-메틸피라졸-3-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0071] 본 발명의 추가의 실시 형태는 Ar^3 가 할로, C_{1-6} 알킬, OH 또는 CH_3 로 치환되는 C_{1-6} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬, OC_{1-6} 알킬, OC_{1-6} 퍼할로알킬 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0072] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IA)을 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IA)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



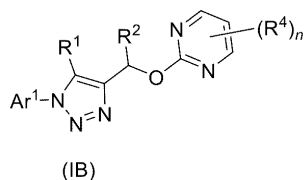
[0073]

[0074] 상기 식에서,

[0075] Ar^1 은 할로, C_{1-3} 퍼할로알킬 및 OC_{1-3} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0076] Ar^3 는 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 3-클로로-피리딘-2-일, 5-클로로-피리딘-2-일, 3-플루오로-피리딘-2-일, 6-플루오로-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-5-일, 5-메틸-피리딘-2-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 2,3-다이메틸-피리딘-6-일, 2-클로로-5-메틸피리딘-4-일, 3-메톡시-피리딘-2-일, 2-메톡시-피리딘-3-일, 2-(피리딘-3-일)프로판-2-올, 5-클로로-3-메톡시-피리딘-2-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 피리다진-3-일, 피라진-2-일, 5-메틸피라진-2-일, 5-플루오로-피라진-2-일 및 (2-티에닐)피라진-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0077] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IB)를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IB)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



[0078]

[0079]

상기 식에서,

[0080]

Ar¹은 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0081]

R¹은 H, F, I 및 CH₃로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0082]

R²는 H 또는 CH₃이며;

[0083]

n은 0, 1 또는 2이고;

[0084]

R⁴는 각각 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂, NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴린, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일 및 1-메틸피라졸-3-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

[0085]

본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IB)를 갖는 화학식 (I)의 화합물이다:

[0086]

상기 식에서, Ar¹은 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐, 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐, 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐, 3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐, 3-브로모-4-플루오로-페닐, 2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-클로로-3-메톡시-페닐, 4-플루오로-3-아이소프로필-페닐, 3-클로로-4-플루오로-페닐, 3-에틸-4-플루오로-페닐, 3,4-다이플루오로페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐 및 3,5-다이메틸페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0087]

R¹은 H이고;

[0088]

R²는 H이며;

[0089]

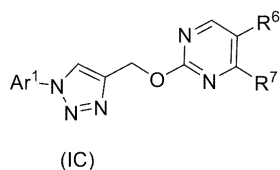
n은 1 또는 2이고;

[0090]

R⁴는 각각 Cl, F, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬, CH₂OH, CH₂OCH₃, C(CH₃)₂(OH), OCH₃, OC₁₋₃퍼할로알킬, C(=O)CH₃ 및 아제티딘-1-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

[0091]

본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IC)를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IC)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



[0092]

[0093]

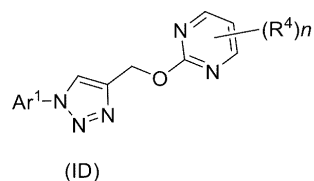
상기 식에서,

[0094] Ar^1 은 2-브로모-피리딘-4-일, 6-메틸-피리딘-2-일, 4-메틸-피리딘-2-일, 2-메틸-피리딘-4-일, 5-메틸-피리딘-3-일, 2-(트라이플루오로메틸)-피리딘-4-일, 5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일, 5-브로모-6-메틸-피리딘-2-일, 5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일 및 5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0095] R^6 는 Cl, F, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_3 및 OCH_3 로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0096] R^7 은 H 또는 CH_3 이다.

[0097] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (ID)를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (ID)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



[0098]

[0099] 상기 식에서,

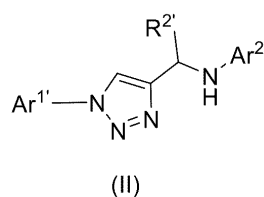
[0100] Ar^1 은 Br, Cl, F, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬 및 OC_{1-3} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0101] n 은 0, 1 또는 2이고;

[0102] R^4 는 각각 Br, Cl, F, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬, OCH_3 , $OCHF_2$, CH_2OH , CH_2OCH_3 , $CH(CH_3)(OH)$, $C(OH)(CH_3)_2$, $C(OCH_3)(CH_3)_2$, $C(OH)(CH_3)(CF_3)$, NH_2 , $NH(CH_3)$, $N(CH_3)_2$, $C(=O)CH_3$, 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로 아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일 및 피페리딘-1-일로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

[0103] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (II)의 화합물, 및 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:

[0104] 상기 식에서,



[0105]

[0106] $Ar^{1'}$ 은 C_{1-3} 퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C_{1-3} 알킬, C_{1-3} 퍼할로알킬 및 OC_{1-3} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

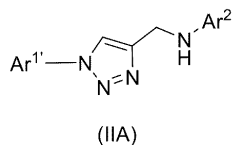
[0107] $R^{2'}$ 은 H 또는 CH_3 이고;

[0108] Ar^2 는

[0109] (a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C_{1-3} 알킬, $C(CH_3)_2OH$, C_{1-3} 퍼할로알킬, OCH_3 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

[0110] (b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 및 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0111] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IIA)를 갖는 화학식 (II)의 화합물, 및 화학식 (IIA)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



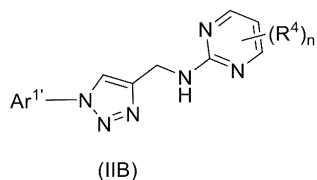
[0112]

[0113] 상기 식에서,

[0114] $Ar^{1'}$ 은 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐 및 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0115] Ar^2 는 옥사졸-2-일, 피리미딘-4-일, 1-메틸-피라졸-3-일, 1-메틸-이미다졸-2-일 및 1-메틸-피라졸-4-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0116] 본 발명의 추가의 실시 형태는 화학식 (IIB)를 갖는 화학식 (II)의 화합물, 및 화학식 (IIB)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염이다:



[0117]

[0118] 상기 식에서,

[0119] $Ar^{1'}$ 은 3-(다이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐, 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐, 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐 및 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0120] n 은 1 또는 2이고;

[0121] R^4 는 각각 할로, C_{1-3} 알킬, $C(CH_3)_2OH$, C_{1-3} 퍼할로알킬, OCH_3 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택된다.

[0122] 본 발명의 추가의 실시 형태는 하기 표 1에 나타난 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염이다:

실시예 번호	화합물명
1	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
4	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리딘;
5	3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리딘;
8	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-6-메틸-피리딘;
9	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
10	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
11	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리딘;
12	4-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
13	4-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
14	3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리다진;
15	2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
16	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;
17	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;
18	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘;
19	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
20	2-[[1-(4-플루오로-3-메톡시-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
21	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;
22	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;
23	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피라진;
25	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
26	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
27	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-에틸-피리미딘;
28	5-클로로-2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
29	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
30	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;
31	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;
32	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일)메톡시]-5-에틸-피리미딘;
33	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;

[0123]

34	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
35	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
37	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
38	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
39	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
40	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
41	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
42	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-클로로-피리미딘;
43	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
44	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
45	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
46	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
47	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
48	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
49	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
50	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
51	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
52	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
53	(R/S)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
54	(R*)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
55	(S*)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
56	(R/S)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
57	(R*)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
58	(S*)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
59	(R/S)-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
60	(R/S)-5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0124]

61	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
62	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
63	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
64	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
65	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
66	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
67	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
68	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
69	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
70	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
71	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
72	5-에틸-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
73	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
74	5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
75	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
76	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
77	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
78	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
79	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
80	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
81	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
82	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
83	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
84	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
85	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
86	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;

[0125]

87	2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
88	2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
89	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
90	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
91	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
92	5-클로로-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
93	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
94	2-[[1-(5-브로모-6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
95	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
96	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
103	3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리미딘;
104	5-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메틸-피리미딘;
105	3-클로로-2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
106	5-클로로-2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리미딘;
107	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리미딘;
108	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리미딘;
111	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
112	5-클로로-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
113	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘;
114	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
115	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
116	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
117	5-클로로-2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
118	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
119	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
120	5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
121	5-메틸-2-((1-(4-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
122	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
123	2-((1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;

[0126]

124	2-((1-(4-클로로-3-(옥세탄-3-일)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
125	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-플루오로-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
126	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-(트라이플루오로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
127	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
128	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸아졸;
129	1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(((5-메틸-1H-이미다졸-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트리아졸;
130	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리딘;
131	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피리딘;
132	6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피리딘;
133	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피라진;
134	5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피라진;
135	5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;
136	6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-3,4-다이메틸피리다진;
137	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(트라이플루오로메틸)피리다진;
138	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메톡시피리다진;
139	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;
140	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
141	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메톡시피리미딘;
142	2-((1-(5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
143	2-((1-(2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
146	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메톡시피리딘;
147	4-클로로-3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;
148	4-((1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘;
149	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
150	5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
151	2-((1-(5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;

[0127]

152	5-메틸-2-[(1-(피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
155	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
156	1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
157	(R/S)-1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
158	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
159	[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
160	[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
161	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
162	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-카르복사미드;
163	(R/S) 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄아민;
164	5-클로로-2-[[1-[4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
165	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
166	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;
167	2-[(1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시]-5-플루오로피리미딘-4-아민;
168	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
169	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;
170	4-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]모르폴린;
171	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
172	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
173	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
174	5-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
175	5-메틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
176	5-메틸-2-[[1-(5-메틸-3-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
177	2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
178	2-[2-[[1-(3-사이클로부틸-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
179	2-[2-[[1-(4-플루오로-3-아이소프로필-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
180	2-[2-[[1-(3-사이클로프로필-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
181	2-[2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;

[0128]

182	2-[2-[[1-(3-에틸-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
183	5-브로모-2-[[1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
184	2-[[1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메틸피라졸-3-일)피리미딘;
185	2-[[1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;
186	2-[[1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;
187	4-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린;
188	2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
189	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피라진;
190	4-클로로-2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
191	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-플루오로-피리미딘;
192	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
193	2-[[1-(4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
194	2-[[1-(4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
195	2-[[1-(3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
196	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;
225	5-클로로-2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
226	2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
227	2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
228	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
229	5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
230	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
231	5-클로로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
232	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
233	5-에틸-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
234	2-[[1-(3-브로모페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
235	2-[[1-(3-브로모페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
236	2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
237	5-플루오로-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
238	5-메톡시-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
239	5-클로로-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
240	5-메틸-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
241	5-에틸-2-[[1-(o-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
242	2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
243	5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0129]

244	4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
245	5-에틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
246	5-클로로-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
247	5-플루오로-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
248	5-메톡시-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
249	2-[2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
250	4-(메톡시메틸)-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
251	4,5-다이메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
252	5-플루오로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
253	5-클로로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
254	5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
255	1-[2-[[1-(m-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
256	2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
257	5-플루오로-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
258	5-메톡시-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
259	5-클로로-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
260	5-메틸-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
261	5-에틸-2-[[1-(p-톨릴)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
262	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
263	5-플루오로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
264	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
265	5-클로로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
266	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
267	5-에틸-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
268	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
269	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
270	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
271	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
272	2-[2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
273	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
274	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
275	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
276	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
277	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
278	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
279	5-클로로-2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
280	2-클로로-4-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
281	2-[[1-(3-다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;

[0130]

282	5-사이클로프로필-2-[[1-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
283	4-사이클로프로필-2-[[1-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
284	2-[[1-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
285	2-[[1-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;
286	5-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
287	5-에틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
288	5-아이소프로필-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
289	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
290	4,5-다이메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
291	5-클로로-4-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
292	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
293	5-브로모-2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
294	5-클로로-2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
295	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
296	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
297	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
298	[2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
299	[2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
300	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
301	2-[2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
302	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
303	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
304	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
305	(R/S)-2-[2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
306	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
307	2-[[1-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;

[0131]

308	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
309	1-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
310	(R/S)-1-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
311	(R/S)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시에틸)피리미딘;
312	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
313	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
314	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
315	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
316	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
317	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
318	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
319	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
320	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
321	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
322	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
323	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
324	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
325	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
326	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
327	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
328	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
329	2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
330	2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
331	2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
332	5-클로로-2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
333	2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
334	2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;

[0132]

335	2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
336	5-플루오로-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
337	5-메톡시-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
338	5-클로로-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
339	5-메틸-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
340	5-에틸-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
341	2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
342	5-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
343	5-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
344	1-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
345	2-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
346	4-(메톡시메틸)-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
347	4-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
348	5-플루오로-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
349	5-메톡시-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
350	5-클로로-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
351	5-에틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
352	N-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
353	2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
354	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
355	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
356	5-클로로-2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
357	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
358	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
359	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
360	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
361	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
362	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;

[0133]

363	5-클로로-2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
364	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
365	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
366	2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;
367	5-클로로-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
368	2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
369	2-[2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
370	4-(다이플루오로메틸)-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
371	5-클로로-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;
372	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
373	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
374	2-[(1R)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
375	5-클로로-2-[(1R)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
376	2-[(1R)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
377	2-[(1R)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
378	2-[(1S)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
379	5-클로로-2-[(1S)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
380	2-[(1S)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
381	2-[(1S)-1-[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
382	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
383	[2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
384	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
385	2-[2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
386	2-((1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시]-4-아이소프로폭시피리미딘;
387	메틸 2-((1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘-4-카복실레이트;
388	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-(2,2-다이플루오로에틸)-5-플루오로-피리미딘-4-아민;
389	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
390	2-((1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시]-5-플루오로피리미딘-4-아민;
391	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘;
392	2-((1-4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;

[0134]

393	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
394	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-플루오로-피리딘;
395	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-(트리아플루오로메틸)피리딘;
396	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진;
397	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-티에닐)피라진;
398	5-브로모-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
399	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
400	[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
401	2-[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
402	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
403	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트리아플루오로메틸)피리미딘;
404	(R/S)-2-[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트리아플루오로-프로판-2-올;
405	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
406	5-클로로-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
407	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
408	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
409	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복스아미드;
410	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-카르복스아미드;
411	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-5-메틸-피리미딘;
412	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
413	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
414	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
415	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
416	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
417	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
418	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;

[0135]

419	5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
420	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로-3-메틸아제티딘-1-일)피리미딘;
421	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일)피리미딘;
422	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;
423	5-사이클로프로필-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
424	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(2-푸릴)피리미딘;
425	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)-5-요오도-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸피리미딘;
426	[3H]-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일-5-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;
427	3-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
428	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
429	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
430	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘;
431	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
432	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
433	2-[6-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-3-피리딜]프로판-2-올;
434	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피라진;
435	2-[2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
436	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘;
437	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;
438	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
439	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
440	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
441	(R/S)-1,1,1-트라이플루오로-2-[2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
442	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
443	5-메톡시-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0136]

444	5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
445	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
446	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
447	1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
448	(R/S)-1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
449	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
450	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
451	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
452	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카복실아미드;
453	5-사이클로프로필-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
454	5-브로모-2-((1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
455	2-((1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
456	4-(2-((1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)보르폴린;
457	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-[3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-4-메틸피리미딘;
458	2-((1-[3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-4-메틸피리미딘-5-아민;
459	2-((1-[3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-5-아민;
460	2-((1-[3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;
461	5-클로로-2-[[1-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
462	4-[[1-[4-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘;
463	5-클로로-2-[[1-[3-플루오로-2-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
464	2-[[1-[3-플루오로-2-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
465	5-플루오로-2-[[1-[3-플루오로-2-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
466	2-[2-[[1-[3-플루오로-2-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
467	2-[[1-[2-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
468	5-클로로-2-[[1-[2-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
469	2-[[1-[2-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
470	5-클로로-2-[[1-[2-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
471	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[2-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0137]

472	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
473	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
474	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
475	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
476	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
477	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
478	5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
479	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
480	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
481	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
482	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
483	5-(2-플루오로메톡시)-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
484	2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
485	5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
486	5-플루오로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
487	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
488	2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
489	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
490	2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
491	5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
492	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
493	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
494	5-브로모-2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
495	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-에틸-피리미딘;
496	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
497	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
498	[2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
499	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
500	2-[2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
501	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
502	2-[[1-(3-다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-아민;

[0138]

503	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
504	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-메틸피리미딘-4-아민;
505	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
506	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-페닐-피리미딘;
507	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
508	5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
509	4-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
510	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
511	4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
512	(R)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]피리미딘;
513	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
514	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
515	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;
516	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
517	N-(2,2-다이플루오로에틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘-4-아민;
518	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
519	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;
520	1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)-N-메틸메탄아민;
521	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
522	1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
523	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
524	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
525	5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
526	2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
527	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
528	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;

[0139]

529	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
530	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
531	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
532	2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
533	[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
534	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
535	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
536	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
537	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
538	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
539	(R/S)-2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
540	[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
541	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;
542	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
543	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
544	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
545	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
546	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘;
547	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;
548	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
549	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
550	1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
551	(R/S)-1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
552	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;
553	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
554	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0140]

555	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘;
556	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;
557	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;
558	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;
559	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;
560	6-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2,3-다이메틸-피리딘;
561	3-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘;
562	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;
563	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
564	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
565	(R/S)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;
566	2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
567	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-에틸-에틸)피리미딘;
568	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
569	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;
570	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
571	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
572	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;
573	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
574	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
575	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
576	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
577	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;
578	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;
579	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
580	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;

[0141]

581	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;
582	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
583	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-카르보닐트릴;
584	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸설포닐-피리미딘;
585	1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
586	(R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;
587	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
588	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
589	2-((1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일]메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
590	2-((1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일]메톡시)-N,N-다이메틸피리미딘-5-아민;
591	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;
592	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;
593	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
594	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
595	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
596	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
597	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
598	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
599	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
600	5-클로로-2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
601	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
602	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
603	2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
604	2-[2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
605	5-클로로-2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
606	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
607	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
608	2-[2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
609	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
610	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
611	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0142]

612	5-클로로-2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
613	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
614	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;
615	2-2[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
616	[2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
617	[2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
618	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
619	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
620	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
621	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
622	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
623	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
624	[2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;
625	[2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
626	2-2[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
627	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
628	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;
629	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;
630	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;
631	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-사이클로프로필-피리미딘;
632	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;
633	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;
634	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피콜리딘-1-일-피리미딘;
635	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딘)피리미딘;
636	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
637	2-[[1-4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;
638	2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일]메톡시)-5-메틸피리미딘;

[0143]

639	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;
640	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;
641	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
642	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
643	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
644	2-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
645	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
646	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
647	5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
648	4-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
649	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;
650	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
651	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아인;
652	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;
653	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
654	2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
655	2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
656	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
657	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
658	5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
659	5-클로로-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
660	5-에틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
661	5-클로로-4-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
662	5-메틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
663	5-에틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
664	5-에틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
665	2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;
666	5-메틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;
667	5-에틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;

[0144]

668	5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
669	5-메톡시-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
670	5-(트라이플루오로메틸)-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
671	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;
672	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
673	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
674	5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
675	2-(아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
676	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
677	2-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
678	4-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
679	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;
680	4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
681	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피롤-2-일)피리미딘;
682	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
683	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피롤-2-일)피리미딘;
684	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
685	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-5-플루오로피리미딘-4-아민;
686	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;
687	N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;
688	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
689	N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
690	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
691	N-에틸-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;
692	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘;

[0145]

693	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘;
694	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
695	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;
696	4-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
697	4-((다이플루오로메톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
698	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;
699	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;
700	(E)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 옥심;
701	5-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;
702	(Z)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-온 옥심;
703	(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-일)메탄올;
704	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)-5-플루오로피리미딘;
705	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;
706	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;
707	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;
708	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸-d2)피리미딘;
709	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시-d3)메틸-d2)피리미딘;
710	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시-d3)메틸)피리미딘;
711	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸)피리미딘;
712	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-메톡시에틸)피리미딘;
713	1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-올;
714	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메톡시프로판-2-일)피리미딘;
715	2-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)프로판-2-올;
716	4-((2,2-다이플루오로에톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘

[0146]

[0147] 본 발명의 추가의 실시 형태는 하기 표 2에 나타난 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염이다:

실시예 번호	화합물명
2	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
3	N-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
6	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;
7	N-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-1-메틸-이미다졸-2-아민;
24	N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
36	N-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
97	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]옥사졸-2-아민;
98	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
99	N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;
100	N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;
101	N-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;
102	N-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;
109	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
110	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-4-아민;
144	N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;
145	N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;
153	5-클로로-N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
154	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
197	N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-5-플루오로-피리미딘-2-아민;
198	N-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
199	5-클로로-N-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;
200	5-클로로-N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
201	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;
202	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;

[0148]

203	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메톡시-피리미딘-2-아민;
204	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
205	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
206	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
207	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민;
208	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-아이소프로필-피리미딘-2-아민;
209	5-사이클로프로필-N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
210	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-4,5-다이메틸-피리미딘-2-아민;
211	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;
212	5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;
213	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;
214	2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]아미노]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
215	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;
216	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-5-에틸피리미딘-2-아민;
217	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;
218	5-클로로-N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-4-메틸피리미딘-2-아민;
219	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민;
220	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-이미다졸-2-아민;
221	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;
222	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;
223	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민; 및
224	N-((1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에틸)-5-메틸-피리미딘-2-아민

[0149]

[0150]

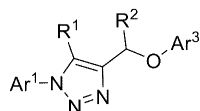
본 발명의 추가의 실시 형태는 하기 표 3에 나타난 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염이다:

화합물명
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;
2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;
[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;
[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;
2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;
2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;
5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘; 및
5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘

[0151]

[0152] 본 발명의 추가의 실시 형태는

[0153] (A) 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용 가능한 염; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다:



(I)

[0154]

[0155] 상기 식에서,

[0156] Ar¹은

[0157] (a) 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬 및 OC₁₋₆퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C₁₋₆알킬, C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C₃₋₆사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

[0158] (b) 피리디닐; 할로, CH₃, CF₃ 및 CF₂H로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

[0159] (c) CF₃로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0160] R¹은 H, 할로 또는 CH₃이고;

[0161] R²는 H 또는 CH₃이며;

[0162] Ar³는

[0163] (a) 피리디닐; Cl, F, CH₃, OCH₃, CF₃ 및 C(CH₃)₂OH로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

[0164] (b) 피리다지닐; CH₃, OCH₃ 및 CF₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

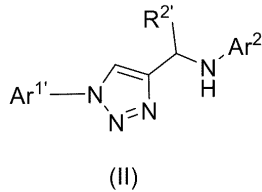
[0165] (c) 피리미딘-4-일; Cl, CH₃, CF₃ 및 OCH₃로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C₁₋₆알킬, OH 또는 OCH₃로 치환되는 C₁₋₆알킬, C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCHF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

[0166] (d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

[0167] (e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0168] 본 발명의 추가의 실시 형태는

[0169] (A) 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다:



[0170]

[0171] 상기 식에서,

[0172] Ar^{1'}은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0173] R^{2'}은 H 또는 CH₃이고;

[0174] Ar²는

[0175] (a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

[0176] (b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 또는 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0177] 본 발명의 추가의 실시 형태는 적어도 하나의 화학식 (IA) (및 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물, 및 화학식 (IA) (및 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물, 화학식 (IA) (및 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (IA) (및 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량; 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다.

[0178] 본 발명의 추가의 실시 형태는 적어도 하나의 화학식 (IIA) (및 화학식 (IIB))의 화합물, 및 화학식 (IA) (및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물, 화학식 (IIA) (및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (IIA) (및 화학식 (IIB))의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량; 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다.

[0179] 본 발명의 추가의 실시 형태는 적어도 하나의 표 1 (및 표 2 및 표 3)의 화합물, 및 표 1 (및 표 2 및 표 3)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물, 표 1 (및 표 2 및 표 3)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 표 1 (및 표 2 및 표 3)의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량; 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다.

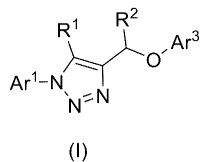
[0180] 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 거울상 이성질체 및 부분입체 이성질체도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

[0181] 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 화학식 (IB))의 화합물의 거울상 이성질체 및 부분입체 이성질체도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 화학식 (IB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 화학식 (IB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 화학식 (IB))의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

[0182] 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 동위원소 변형체, 예를 들어 화학식 (I)의 중수소화 화합물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매 화합물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC) 및 화학식 (ID))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

[0183] 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 (IB))의 화합물의 동위원소 변형체, 예를 들어 화학식 (II)의 중수소화 화합물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 (IB))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매 화합물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 (IB))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (II) (및 화학식 (IIA) 및 (IB))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

[0184] 본 발명의 추가의 실시 형태는 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법이다:



[0185]

[0186] 상기 식에서,

[0187] Ar^1 은

[0188] (a) 할로, C_{1-6} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬 및 OC_{1-6} 퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되는 하나의 치환기로 치환되는 페닐; 할로, C_{1-6} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬, OC_{1-6} 알킬, OC_{1-6} 퍼할로알킬, C_{3-6} 사이클로알킬 및 아제티디닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개 또는 3개의 치환기로 치환되는 페닐;

[0189] (b) 피리디닐; 할로, CH_3 , CF_3 및 CF_2H 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리디닐; 및

[0190] (c) CF_3 로 치환되는 티에닐; 1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일; 또는 2,3-다이하이드로-1H-인텐-5-일로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0191] R^1 은 H, 할로 또는 CH_3 이고;

[0192] R^2 는 H 또는 CH_3 이며;

[0193] Ar^3 는

[0194] (a) 피리디닐; Cl, F, CH_3 , OCH_3 , CF_3 및 $C(CH_3)_2OH$ 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리디닐; 아제티딘-1-일; 3-플루오로아제티딘-1-일; 및 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일;

[0195] (b) 피리다지닐; CH_3 , OCH_3 및 CF_3 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리다지닐;

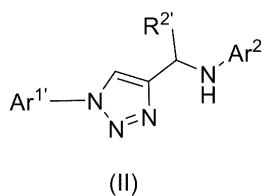
[0196] (c) 피리미딘-4-일; Cl, CH_3 , CF_3 및 OCH_3 로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 할로, C_{1-6} 알킬, OH 또는 OCH_3 로 치환되는 C_{1-6} 알킬,

C(OH)(CH₃)(CF₃), CH₂OCHF₂, CH₂OCF₃, CH₂OCH₂CH₃, CH(NH₂)CH₃, CH₂NH(CH₃), C₁₋₆퍼할로알킬, OC₁₋₆알킬, OC₁₋₆퍼할로알킬, C(=N-OH)(CH₃), NH₂, NH(CH₃), N(CH₃)₂; NH(CH₂CH₃), NH(CH₂CHF₂), NH(사이클로프로필), NH(다이플루오로사이클로부틸), NH-옥세타닐, CN, C(=O)CH₃, C(=O)NH(CH₃), C(=O)N(CH₃)₂, SO₂CH₃, CO₂CH₃, C(CH₃)(=N-OH), 사이클로프로필, 아제티딘-1-일, 3-플루오로아제티딘-1-일, 3,3-다이플루오로아제티딘-1-일, 3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일, 3-메톡시아제티딘-1-일, 3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일, 피롤리딘-1-일, 3-플루오로피롤리딘-1-일, 3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일, 피페리딘-1-일, 모르폴리닐, 1H-피롤-2-일, 2-푸릴, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 2-메틸-1H-이미다졸-1-일, 1-메틸피라졸-3-일 및 페닐로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 치환되는 피리미딘-2-일;

[0197] (d) 5-플루오로-피라진-2-일; 5-메틸피라진-2-일; 6-메틸피라진-2-일; 피라진-4-일; (2-티에닐)피라진-2-일 및 2,3-다이메틸피라진-5-일; 및

[0198] (e) 5-메틸-1H-이미다졸-2-일; 5-메틸티아졸-2-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

[0199] 본 발명의 추가의 실시 형태는 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (II)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법이다:



[0200]

[0201] 상기 식에서,

[0202] Ar^{1'}은 C₁₋₃퍼할로알킬로 치환되는 페닐; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C₁₋₃퍼할로알킬 및 OC₁₋₃퍼할로알킬로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 2개의 치환기로 치환되는 페닐이며;

[0203] R^{2'}은 H 또는 CH₃이고;

[0204] Ar²는

[0205] (a) 피리딘-2-일; 피리다진-3-일; 피리미딘-4-일; 피리미딘-2-일; 또는 할로, C₁₋₃알킬, C(CH₃)₂OH, C₁₋₃퍼할로알킬, OCH₃ 및 사이클로프로필로 이루어진 군으로부터 각각 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘-2-일; 및

[0206] (b) 1-메틸-이미다졸-2-일; 옥사졸-2-일; 1-메틸-피라졸-4-일; 1-메틸-피라졸-3-일; 또는 1-메틸-1H-피라졸-5-일로 이루어진 군으로부터 선택된다.

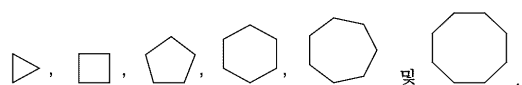
[0207] 본 발명의 추가의 실시 형태는 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 모든 상술한 것들의 약제학적으로 허용가능한 염의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법이다.

[0208] 본 발명의 방법의 바람직한 실시 형태에서, 상기 질환, 장애 또는 의학적 상태는 (1) 기분장애 및 기분정동장애; (2) 불안장애를 포함한 신경증성, 스트레스 관련 및 신체형 장애; (3) 심리적 발달장애; (4) 생리적 장애 및 신체적 요인과 관련된 행동 증후군(behavioral syndromes associated with physiological disturbances and physical factors); (5) 추체외로 및 운동장애; (6) 우발적 및 발작적 장애, 간질; (7) 통증; (8) 신경변성 형태; (9) 급성 및 만성 뇌혈관질환; 및 뇌혈관질환의 후유증을 포함하나 이에 한정되지 않는 신경 및 정신 장애로부터 선택된다.

- [0209] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 기분장애 및 기분정동장애의 예로는 우울증, 경조증, 조증 및 혼합형 양극성 장애 I형; 양극성 장애 II형; 우울장애, 예컨대 일회성 우울삽화 또는 재발성 주요 우울장애, 경도 우울장애, 치료 저항성 우울증, 산후 발병 우울장애, 정신병적 증상을 동반한 우울장애; 지속성 기분장애, 예컨대 순환기질, 기분변조, 정상기분; 및 월경전 불쾌기분장애를 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0210] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 신경증성, 스트레스 관련 및 신체형 장애에 속하는 장애의 예로는 불안장애, 범 불안장애, 광장공포증을 동반하거나 동반하지 않는 공황장애, 특정 공포증, 사회불안장애, 만성 불안장애; 강박 장애; 심한 스트레스에 대한 반응 및 적응 장애, 예컨대 외상 후 스트레스 장애 (PTSD); 기타 신경증성 장애, 예컨대 이인증-비현실감 증후군을 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0211] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 심리적 발달장애의 예로는 아스퍼거 증후군 (Asperger's syndrome) 및 레트 증후군 (Rett's syndrome), 자폐성 장애, 소아 자폐증 및 정신지체 및 상동적 운동을 수반한 과활동성장애를 포함하나 이에 한정되지 않는 전반적 발달장애, 특정 운동기능 발달장애, 특정 학업기술 발달장애를 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0212] 본 발명에 따른 생리적 장애 및 신체적 요인과 관련된 행동 증후군의 예로는 출산 후 (산후) 및 출산 전 우울증을 포함하나 이에 한정되지 않는 출산과 관련된 정신 및 행동장애; 신경성 식욕부진, 신경성 과식증, 이식증 및 폭식 장애를 포함하나 이에 한정되지 않는 섭식장애를 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0213] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 추체외로 및 운동장애의 예로는 파킨슨병; 이차 파킨슨증, 예컨대 뇌염후 파킨슨증; 다른 장애에 포함된 파킨슨증; 루이소체병; 기저핵의 퇴행성 질환; 진전, 본태성 진전 및 약물 유발성 진전, 간대성 근경련, 무도병 및 약물 유발성 무도병, 약물 유발성 틱 및 기질적 원인의 틱, 약물 유발성 급성 근육긴장이상, 약물 유발성 지발성 운동이상, 레보도파 유발성 운동이상을 포함하나 이에 한정되지 않는 기타 추체외로 및 운동장애; 신경이완제 약성 증후군(NMS), 신경이완제 유발성 파킨슨병, 신경이완제 유발성 조발성 또는 급성 운동이상, 신경이완제 유발성 급성 근육긴장이상, 신경이완제 유발성 급성 좌불안석증, 신경이완제 유발성 지발성 운동이상, 신경이완제 유발성 진전을 포함하나 이에 한정되지 않는 신경이완제 유발성 운동장애; 하지 불안 증후군, 근육강직 증후군을 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0214] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 기저핵의 기능부전 및/또는 변성을 동반한 운동장애의 추가의 예로는 국소성 (focal) 근육긴장이상, 다소성(multiple-focal) 또는 분절성(segmental) 근육긴장이상, 염전성(torsion) 근육긴장이상, 반구성, 전신성(generalised) 및 지발성 근육긴장이상(정신약리학적 약물에 의해 유발됨)을 포함하나 이에 한정되지 않는 근육긴장이상을 포함하나 이에 한정되지 않는다. 국소성 근육긴장이상은 경부 근육긴장이상(사경), 안검 경련(눈꺼풀 경련), 사지 근육긴장이상(서경과 같은 사지의 경련), 구강하악(oromandibular) 근육긴장이상 및 경련성 발성장애(성대 경련)를 포함한다.
- [0215] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 우발적 및 발작적 장애의 예로는 국소발병의 발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 특발성 간질 및 간질 증후군, 단순부분발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 증상성 간질 및 간질 증후군, 복합부분발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 증상성 간질 및 간질 증후군, 전신성 특발성 간질 및 간질 증후군(영아기 마이오클로누스 간질, 신생아 경련(가족성), 소아기 압상스 간질(피크노렙시), 각성시 대발작을 동반한 간질, 압상스 간질, 마이오클로누스 간질(충동성 소발작) 및 비특이성 무긴장성, 간대성, 마이오클로누스, 긴장성, 강직 간대성 간질발작을 포함하나 이에 한정되지 않음)을 포함한 간질을 들 수 있으나 이에 한정되지 않는다.
- [0216] 본 발명에 따라 치료될 수 있는 간질의 다른 예로는 마이오클로누스 압상스를 동반한 간질, 마이오클로누스-기립불능 발작, 영아연축, 레녹스-가스토 증후군(Lennox-Gastaut syndrome), 살람발작(Salaam attacks), 증상성 조기 마이오클로누스 뇌병증, 웨스트 증후군(West's syndrome), 소발작 및 대발작; 간질지속증을 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0217] 통증의 예로는 심리적 요인과 관련된 통증 장애, 예컨대 지속성 신체형 장애; 급성, 만성 및 만성 난치성 통증, 두통; 등통증, 치통, 복통, 요통, 관절통을 포함하나 이에 한정되지 않는 생리적 과정 및 신체 장애와 관련된 급성 및 만성 통증; 류머티즘, 근육통, 신경통 및 섬유근육통을 포함하나 이에 한정되지 않는 근골격계 및 결합 조직 질환과 관련된 급성 및 만성 통증; 삼차신경통, 대상포진후 신경통, 통증을 동반한 환상지 증후군, 손목 터널 증후군, 좌골신경의 병변, 당뇨병성 단일신경병증 등의 신경, 신경근 및 신경총 장애와 관련된 급성 및 만성 통증; 유전성 및 특발성 신경병증, 염증성 다발신경병증, 약물, 알코올 또는 독성물질에 의한 다발신경병증, 신생물성 질환에서의 다발신경병증, 당뇨병성 다발신경병증 등의 다발신경병증 및 말초신경계통의 기타 장애와

관련된 급성 및 만성 통증을 포함하나 이에 한정되지 않는다.

- [0218] 신경변성 형태를 포함하는 질환의 예로는 급성 신경변성, 예컨대 두개내 뇌손상, 예컨대 뇌졸중, 미만성 및 국소성 뇌손상, 경막외, 경막하 및 지주막하 출혈, 및 만성 신경변성, 예컨대 알츠하이머병, 헌팅턴병(Huntington's disease), 다발성 경화증 및 ALS를 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0219] 뇌혈관질환의 예로는 지주막하 출혈, 뇌내 출혈 및 기타 비외상성 두개내 출혈, 뇌경색, 뇌졸중, 뇌경색을 유발하지 않는 뇌전동맥 및 대뇌동맥의 폐색 및 협착, 대뇌동맥의 박리, 뇌동맥류(cerebral aneurysm), 대뇌 죽상경화증, 진행성 혈관성 백질뇌증, 고혈압성 뇌증, 두개내 정맥계통의 비화농성 혈전증, 뇌동맥염, 뇌 아밀로이드 혈관병증 및 뇌혈관질환의 후유증을 포함하나 이에 한정되지 않는다.
- [0220] 일부 실시 형태에서, 본 발명의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용가능한 염의 투여는 질환을 예방하는데 효과적인데, 예를 들어 질환, 상태 또는 장애에 걸리기 쉬울 수 있지만 질환의 병리 또는 증상을 아직 경험하지 않거나 나타내지 않는 사람의 질환, 상태 또는 장애를 예방하는데 효과적이다.
- [0221] 본 발명의 추가의 실시 형태, 특징 및 이점은 하기 상세한 설명 및 본 발명의 실시를 통해 명백해질 것이다.
- [0222] 본 발명은 하기 용어 해설 및 최종 실시예를 비롯하여, 하기 설명을 참조함으로써 더욱 충분히 이해될 수 있다. 간략함을 위해, 본 명세서에 인용된 특허를 비롯한 간행물들의 개시 내용은 본 명세서에 참고로 포함된다.
- [0223] 본 명세서에 사용되는 용어 "을 포함하여", "함유하는" 및 "포함하는"은 이들의 개방적이고, 비제한적인 의미로 본 명세서에서 사용된다.
- [0224] 용어 "알킬"은 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 12인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 알킬기의 예로는 메틸(Me, 기호 "/"에 의해 구조적으로 도시될 수도 있음), 에틸(Et), n-프로필, 아이소프로필, 부틸, 아이소부틸, sec-부틸, tert-부틸(tBu), 펜틸, 아이소펜틸, tert-펜틸, 헥실, 아이소헥실, 및 당해 기술분야에 있어서의 통상의 기술 및 본 명세서에 주어진 교시내용을 고려하여, 상술한 예 중 어느 하나와 동등한 것으로 간주되는 것을 들 수 있다. 본 명세서에서 사용되는 용어 " C_{1-3} 알킬"은 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 3인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 본 명세서에서 사용되는 용어 " C_{1-6} 알킬"은 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 6인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다.
- [0225] 용어 "할로"는 클로로, 플루오로, 브로모 또는 요오도를 나타낸다.
- [0226] 용어 "퍼할로알킬" 또는 "할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 6인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 본 명세서에 사용되는 용어 " C_{1-3} 퍼할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 3인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 본 명세서에 사용되는 용어 " C_{1-6} 퍼할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 6인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. "퍼할로알킬", "할로알킬" 기의 예로는 트라이플루오로메틸 (CF_3), 다이플루오로메틸 (CF_2H), 모노플루오로메틸 (CH_2F), 펜타플루오로에틸 (CF_2CF_3), 테트라플루오로에틸 ($CHFCH_3$), 모노플루오로에틸 (CH_2CH_2F), 트라이플루오로에틸 (CH_2CF_3), 테트라플루오로트라이플루오로메틸에틸 ($CF(CF_3)_2$), 클로로프로필 ($CH_2CH_2CH_2Cl$), 및 당해 기술분야에 있어서의 통상의 기술 및 본 명세서에 주어진 교시내용을 고려하여, 상술한 예 중 어느 하나와 동등한 것으로 간주되는 것을 들 수 있다.
- [0227] 용어 "시아노"는 기 CN을 지칭한다.
- [0228] 용어 "사이클로알킬"은 탄소 고리당 3 내지 12개의 고리 원자를 가진 포화 또는 부분 포화된, 모노사이클릭, 융합 폴리사이클릭 또는 스피로 폴리사이클릭 탄소 고리를 말한다. 사이클로알킬기의 예시적인 예는 적절히 결합된 부분 형태의 하기 실체를 포함한다:



[0229]

[0230] 용어 "페닐"은 하기 부분을 나타낸다:



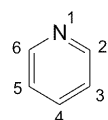
[0231] . 페닐 부분은 1-, 2-, 3-, 4-, 5- 또는 6 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

[0232] 용어 "티에닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0233] .

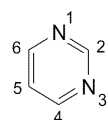
[0234] 용어 "피리디닐" 또는 "피리딜"은 하기 부분을 나타낸다:



[0235]

[0236] 피리디닐 또는 피리딜 부분은 2-, 3-, 4-, 5- 또는 6 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

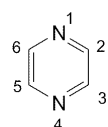
[0237] 용어 "피리미디닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0238]

[0239] 피리미디닐 부분은 2-, 4-, 5- 또는 6 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

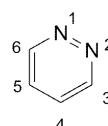
[0240] 용어 "피라지닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0241]

[0242] 피라지닐 부분은 2-, 3-, 5- 또는 6 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

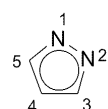
[0243] 용어 "피리다지닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0244]

[0245] 피리다지닐 부분은 3-, 4-, 5- 또는 6 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

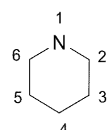
[0246] 용어 "피라졸릴"은 하기 부분을 나타낸다:



[0247]

[0248] 피라졸릴 부분은 1-, 2-, 3-, 4- 또는 5 위치의 탄소 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

[0249] 용어 "피페리디닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0250]

[0251] 피페리디닐 모이어티가 치환체인 경우, 그것은 허용된다면 1-, 2-, 3-, 4-, 5-, 또는 6-위치 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

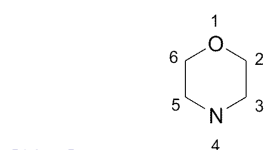
[0252] 용어 "피롤리디닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0254] 피페리디닐 모이어티가 치환체인 경우, 그것은, 허용된다면, 1-, 2-, 3-, 4-, 또는 5-위치 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

[0255] 용어 "아제티디닐"은 1개의 고리 질소를 갖는 4원 헤테로사이클로알킬 부분을 나타낸다. 아제티디닐 모이어티가 치환체인 경우, 그것은, 허용된다면, 임의의 탄소 원자를 통해 또는 질소 원자를 통해 부착될 수 있다.

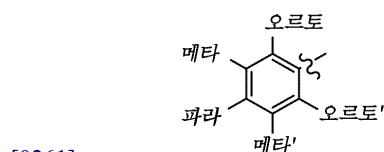
[0256] 용어 "모르폴리닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0258] 모르폴리닐 모이어티가 치환체인 경우, 그것은, 허용된다면, 2-, 3-, 4-, 5-, 또는 6-위치 원자 중 어느 하나를 통해 부착될 수 있다.

[0259] 용어 "치환된"은 특정 기 또는 부분이 하나 이상의 치환기를 갖는 것을 의미한다. 용어 "비치환된"은 특정 기가 치환기를 갖지 않는 것을 의미한다. 용어 "임의로 치환된"은 특정 기가 비치환되거나 하나 이상의 치환기로 치환되는 것을 의미한다. 용어 "치환된"이 구조 시스템을 설명하는데 사용되는 경우, 상기 시스템 상의 임의의 원자가 허용 위치에서 치환이 일어나는 것을 의미한다. 특정 부분 또는 기가 임의의 특정 치환기로 임의로 비치환되거나 치환되는 것으로 명시되지 않은 경우에, 그러한 부분 또는 기는 치환되지 않은 것으로 의도되는 것으로 이해된다.

[0260] 용어 "파라", "메타" 및 "오르토"는 당업계에서 이해되는 의미를 갖는다. 따라서, 예를 들어 완전히 치환된 페닐기는 페닐 고리의 부착점에 인접한 2개의 "오르토(o)" 위치, 2개의 "메타(m)" 위치 및 상기 부착점의 맞은편의 1개의 "파라(p)" 위치에 치환기를 갖는다. 페닐 고리 상의 치환기의 위치를 보다 명확히 하기 위해, 2개의 상이한 오르토 위치는 하기에 예시된 바와 같이, 오르토 및 오르토'로, 2개의 상이한 메타 위치는 메타 및 메타'로 표시될 것이다.



[0262] 더 간결한 설명을 제공하기 위해서, 본 명세서에 주어진 정량적인 표현들 중 일부는 용어 "약"으로 수식되지 않는다. 용어 "약"이 명시적으로 사용되든 아니든, 본 명세서에서 주어진 모든 양은 실제 주어진 값을 지칭하고자 하는 것이며, 또한 그러한 주어진 값에 대한 실험 및/또는 측정 조건으로 인한 증가값 및 근사값을 포함하는, 본 기술 분야의 통상의 기술에 기초하여 합리적으로 추정되는 그러한 주어진 값에 대한 근사값을 지칭하고자 하는 것임이 이해된다. 수율이 백분율로 주어질 때마다, 그러한 수율은 특정 화학양론적 조건 하에서 얻어질 수 있는 실체의 최대량에 대하여 수율이 주어지는 동일 실체의 질량을 말한다. 백분율로 주어진 농도는 별도의 지시가 없는 한, 질량비를 나타낸다.

[0263] 용어 "완충 용액" 또는 "완충액"은 이들의 표준적인 의미에 따라 본 명세서에서 상호 교환적으로 사용된다. 완충 용액은 배지의 pH를 조절하는데 사용되며, 이들의 선택, 사용 및 기능은 당업자에게 공지되어 있다. 예를 들어, 특히 완충액을 설명하고 완충액 성분의 농도가 완충액의 pH와 어떻게 관련되어 있는지를 설명하고 있는 문헌[G.D. Considine, ed., Van Nostrand's Encyclopedia of Chemistry, p. 261, 5th ed. (2005)]을 참조한다.

예를 들어, 완충 용액은 용액의 pH를 약 7.5로 유지하도록 MgSO_4 및 NaHCO_3 를 10:1 w/w 비율로 용액에 첨가하여 얻어진다.

[0264] 본 명세서에 주어진 임의의 화학식은 구조식뿐만 아니라, 특정 변형체 또는 형태로 나타난 구조를 갖는 화합물을 나타내는 것으로 의도된다. 특히, 본 명세서에 주어진 임의의 화학식의 화합물은 비대칭 중심을 가질 수 있으므로, 다양한 거울상 이성질체로 존재할 수 있다. 일반식의 화합물의 모든 광학 이성질체 및 이들의 혼합물은 그 식의 범주 내에 있는 것으로 여겨진다. 따라서, 본 명세서에 주어진 임의의 화학식은 라세미체, 하나 이상의 거울상 이성질체, 하나 이상의 부분입체 이성질체, 하나 이상의 회전장애 이성질체 및 이들의 혼합물을 나타내는 것으로 의도된다. 또한, 특정 구조는 기하 이성질체(즉, 시스 및 트랜스 이성질체), 호변 이성질체 또는 회전장애 이성질체로서 존재할 수 있다.

[0265] 또한 동일한 분자식을 가지나 이들의 원자의 결합 특성 또는 결합 순서 또는 이들의 원자의 공간 배열이 상이한 화합물이 "이성질체"로 명명되는 것으로 이해되어야 한다.

[0266] 서로 거울상이 아닌 입체 이성질체는 "부분입체 이성질체"로 명명되며, 서로 겹쳐질 수 없는 거울상인 입체 이성질체는 "거울상 이성질체"로 명명된다. 화합물이 비대칭 중심을 갖는 경우, 예를 들어 4개의 상이한 기에 결합되어 있는 경우, 한 쌍의 거울상 이성질체가 가능하다. 거울상 이성질체는 이들의 비대칭 중심의 절대 배열을 특징으로 할 수 있으며, 칸-프렐로그의 R- 및 S 순위 결정 규칙 (R- and S-sequencing rules of Cahn and Prelog)이나, 분자가 편광면을 회전시키는 방법에 의해 기술되며, 우선성 또는 좌선성 (즉, 각각 (+) 또는 (-) 이성질체로서)으로 나타낸다. 키랄 화합물은 개별 거울상 이성질체 또는 이들의 혼합물로서 존재할 수 있다. 동일한 비율의 거울상 이성질체를 함유하는 혼합물은 "라세미 혼합물"로 명명된다.

[0267] "호변 이성질체"는 상호 교환가능한 형태의 특정 화합물 구조로 되어 있으며, 수소 원자 및 전자의 치환에 따라 변화하는 화합물을 지칭한다. 따라서, 2개의 구조는 π 전자 및 원자 (통상 H)의 이동을 통해 평형 상태로 될 수 있다. 예를 들어, 에놀 및 케톤은 산 또는 염기와의 처리에 의해 신속하게 상호 전환될 수 있기 때문에, 호변 이성질체이다. 호변 이성질 현상의 또 하나의 예는 마찬가지로, 산 또는 염기와의 처리에 의해 형성되는 페닐 니트로메탄의 아시형 및 니트로형이다.

[0268] 호변 이성질체는 대상으로 하는 화합물의 최적 화학 반응성 및 생물 활성의 달성과 관련될 수 있다.

[0269] 본 발명의 화합물은 하나 이상의 비대칭 중심을 가질 수 있으며; 따라서, 이러한 화합물은 개별 (R) 또는 (S) 입체 이성질체 또는 이들의 혼합물로서 생성될 수 있다.

[0270] 달리 지시되지 않는 한, 본 발명의 명세서 및 청구범위에서의 특정 화합물의 설명 또는 명명은 개별 거울상 이성질체 및 이들의 혼합물, 이들의 라세미 혼합물 또는 다른 것들을 포함하고자 한다. 입체 이성질체의 입체화학 결정 및 분리 방법은 당업계에 잘 알려져 있다.

[0271] 특정예는 절대 거울상 이성질체로 도시된 화학 구조를 포함하고 있으나, 미지의 배열을 갖는 순수한 거울상 이성질체 (enantiopure) 물질을 나타내는 것으로 의도된다. 이러한 경우에, (R*) 또는 (S*)는 대응하는 입체 중심의 절대 입체화학이 알려져 있지 않음을 나타내도록 화합물명에 사용된다. 따라서, (R*)로 나타난 화합물은 (R) 또는 (S)의 절대 배열을 갖는 순수한 거울상 이성질체 화합물을 의미한다. 절대 입체화학이 확인된 경우, 구조는 (R) 및 (S)를 사용하여 명명된다.

[0272] 기호  및  는 본 명세서에 도시된 화학 구조에서 동일한 공간 배열을 의미하는 것으로 사용된다. 유사하게, 기호  및  는 본 명세서에 도시된 화학 구조에서 동일한 공간 배열을 의미하는 것으로 사용된다.

[0273] 게다가, 본 명세서에 주어진 임의의 화학식은 또한, 그러한 화합물의 수화물, 용매화물 및 다형체, 및 이들의 혼합물(이러한 형태가 명확히 열거되지 않더라도)을 의미하도록 의도된다. 특정한 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물, 또는 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염은 용매화물로서 얻어질 수 있다. 용매화물은 본 발명의 화합물과 하나 이상의 용매와의, 용액에서의 또는 고체 또는 결정질 형태로서의 상호작용 또는 착화로부터 형성된 것을 포함한다. 일부 실시 형태에서, 용매는 물이며, 용매화물은 수화물이다.

[0274] 또한, 특정한 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식

(IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물, 또는 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 결정질 형태는 공결정(co-crystal)으로서 얻어질 수 있다.

[0275] 다른 실시 형태에서, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염은 결정질 형태로서 얻어질 수 있다. 또 다른 실시 형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 결정질 형태의 혼합물로서, 다형체로서, 또는 비결정질 형태로서 다수의 다형체 중 하나로 얻어질 수 있다. 다른 실시 형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 용액 중에서 하나 이상의 결정질 형태 및/또는 다형체로 전이될 수 있다.

[0276] 본 명세서에서 화합물에 대한 언급은 (a) 이러한 화합물의 실제로 인용된 형태 및 (b) 이러한 화합물이 명명될 때 고려되는 매질 중의 상기 화합물의 임의의 형태 중 어느 하나에 대한 언급을 의미한다. 예를 들어, 본 명세서에서 R-COOH와 같은 화합물에 대한 언급은 예를 들어, R-COOH_(s), R-COOH_(sol) 및 R-COO⁻_(sol) 중 어느 하나에 대한 언급을 포함한다. 본 예에서, R-COOH_(s)는 예를 들어, 정제 또는 일부 다른 고체 약제학적 조성물 또는 제제로 될 수 있기 때문에, 고체 화합물을 말하며; R-COOH_(sol)는 용매 중의 해리되지 않은 형태의 화합물을 말하고; R-COO⁻_(sol)는 해리된 형태가 R-COOH로부터, 이의 염으로부터, 또는 매질에서의 해리 시에 R-COO⁻를 생성하는 것으로 간주되고 있는 임의의 다른 실체로부터 유도되든지 간에, 용매 중의 화합물의 해리된 형태, 예컨대 수성 환경에서의 화합물의 해리된 형태를 말한다. 다른 예에서, "실체를 화학식 R-COOH의 화합물에 노출시키는"과 같은 표현은 그러한 노출이 일어나는 매질 중에 존재하는 화합물 R-COOH의 형태 또는 형태들에 대한 그러한 실체의 노출을 말한다. 또 다른 예에서, "실체와 화학식 R-COOH의 화합물을 반응시키는"과 같은 표현은 (a) 그러한 반응이 일어나는 매질에 존재하는 그러한 실체의 화학적으로 관련된 형태 또는 형태들의 그러한 실체와, (b) 그러한 반응이 일어나는 매질에 존재하는 화합물 R-COOH의 화학적으로 관련된 형태 또는 형태들을 반응시키는 것을 말한다. 이와 관련하여, 그러한 실체가, 예를 들어 수성 환경 내에 있다면, 화합물 R-COOH가 그러한 동일한 매질 내에 있으며, 따라서 실체는 R-COOH_(aq) 및/또는 R-COO⁻_(aq) (여기서, 하첨자 "(aq)"는 화학 및 생화학에서의 그의 통상적인 의미에 따라 "수성(aqueous)"을 의미함)와 같은 화학종들에 노출되어 있는 것으로 이해된다. 카르복실산 작용기가 이들 명명법의 예로 선택되었으며; 그러나, 이러한 선택은 단지 예시일 뿐 제한하고자 의도된 것은 아니다. 하이드록실, 염기성 질소 구성원, 예컨대 아민의 그것, 및 화합물을 함유하는 매질에서 공지된 방법에 따라 상호 작용하거나 변환하는 임의의 다른 기를 포함하나 이에 한정되지 않는 다른 작용기에 관하여 유사한 예가 제공될 수 있는 것으로 이해된다. 이러한 상호 작용 및 변환은 해리, 결합, 호변 이성질 현상, 가수분해를 포함한 가용매 분해, 수화를 포함한 용매화, 양성자화 및 탈양성자화를 포함하나 이에 한정되지 않는다. 이와 관련하여 추가의 어떤 예도 제공되지 않는데, 이는 주어진 매질에서의 상호 작용과 변환이 당업자에게 알려져 있기 때문이다.

[0277] 다른 예에서는, 명백하게 쯔비터이온 형태로 명명되지 않더라도, 쯔비터이온을 형성하는 것으로 알려진 화합물을 지칭함에 의해 본 명세서에서는 쯔비터이온 화합물이 포함된다. 쯔비터이온, 쯔비터이온들, 및 그들의 동의어 쯔비터이온 화합물(들)과 같은 용어는 잘 알려져 있으며 규정된 과학 명칭의 표준 세트의 일부인 표준 IUPAC 승인 명칭이다. 이와 관련하여, 명칭 "쯔비터이온"은 분자 실체의 ChEBI(Cheical Entities of Biological Interest) 사전에 의해 식별명 CHEBI:27369로 지정되어 있다. 일반적으로 잘 알려진 바와 같이, 쯔비터이온 또는 쯔비터이온 화합물은 반대 부호의 형식 단위 전하를 갖는 중성 화합물이다. 이러한 화합물은 용어 "내염"으로 언급되기도 한다. 다른 문헌들은 이들 화합물을 "양쪽성 이온"으로 부르지만, 후자의 용어는 또 다른 문헌에서는 잘못된 명칭(misnomer)으로 간주된다. 구체적인 예로서, 아미노에탄산(아미노산 글리신)은 화학식 H₂NCH₂COOH를 가지며, 이것은 일부 매질에서는(이 경우에는 중성 매질에서) 쯔비터이온 형태 ⁺H₃NCH₂COO⁻로 존재한다. 이들 용어의 기지의 확립된 의미에서의 쯔비터이온, 쯔비터이온 화합물, 내염 및 양쪽성 이온은 어떠한 경우에도 당업자라면 그렇게 이해하는 바와 같이, 본 발명의 범위 내에 있다. 당업자에 의해 인식될 각각의 그리고 모든 실시 형태를 명명할 필요가 없으므로, 본 발명의 화합물과 관련되는 쯔비터이온 화합물의 어떤 구조도 본 명세서에서 명시적으로 주어지지 않는다. 그러나, 이들은 본 발명의 실시 형태의 일부이다. 주어진 화합물의 다양한 형태를 유도하는 주어진 매질에서의 상호 작용 및 변환이 당업자에게 공지되어 있기 때문에, 이와 관련하여 더 이상의 예는 본 명세서에 제공되지 않는다.

[0278] 본 명세서에 주어진 임의의 화학식은 화합물의 동위원소 표지 형태뿐만 아니라 비표지 형태를 나타내기 위한 것이다. 동위원소로 표지된 화합물은 하나 이상의 원자가 선택된 원자 질량 또는 질량수를 갖는 원자로 치환되는

것을 제외하고는, 본 명세서에 주어진 화학식에 의해 나타난 구조를 갖는다. 본 발명의 화합물에 혼입될 수 있는 동위원소의 예로는 수소, 탄소, 질소, 산소, 인, 황, 불소, 염소 및 요오드의 동위원소, 예컨대 각각, ^2H , ^3H , ^{11}C , ^{13}C , ^{14}C , ^{15}N , ^{18}O , ^{17}O , ^{31}P , ^{32}P , ^{35}S , ^{18}F , ^{36}Cl , ^{125}I 를 들 수 있다. 그러한 동위원소로 표지된 화합물은 대사 연구 (바람직하게는 ^{14}C 를 사용함), 반응 속도론 연구 (예를 들어, 중수소 (즉, D 또는 ^2H) 또는 삼중 수소 (즉, T 또는 ^3H)를 사용함), 약물 또는 기질의 조직 분포 분석을 비롯한 검출 또는 이미징 기술 [예를 들어, 양전자 방출 단층촬영(PET) 또는 단광자 방출 컴퓨터 단층촬영(SPECT)]이나, 또는 환자의 방사성 치료에 유용하다. 특히, ^{18}F 또는 ^{11}C 표지된 화합물은 PET 또는 SPECT 연구에 특히 바람직할 수 있다. 또한, 중수소 (즉, ^2H)와 같은 더 무거운 동위원소로의 치환은 예를 들어, 생체내 반감기 증가 또는 필요 용량 감소와 같은, 보다 큰 대사 안정성으로 인한 특정 치료상 이점을 제공할 수 있다. 동위원소로 표지된 본 발명의 화합물 및 이의 프로드럭은 일반적으로 동위원소로 표지되지 않은 시약을 용이하게 입수할 수 있는 동위원소로 표지된 시약으로 대체하여 후술하는 반응 도식 또는 실시예 및 제법에 개시된 절차를 수행함으로써 제조될 수 있다.

[0279] 본 명세서에 주어진 임의의 화학식을 언급할 때, 명시된 변수에 대하여 가능한 화학종의 목록으로부터 특정 부분을 선택하는 것은 어떤 다른 곳에서 나타나는 변수에 대하여 동일한 화학종의 선택을 한정하는 것으로 의도되지 않는다. 바꿔 말하면, 변수가 한 번보다 많이 나타나는 경우, 명시된 목록으로부터의 화학종의 선택은 달리 명시되지 않는 한, 그 화학식의 어떤 다른 곳의 동일한 변수에 대한 화학종의 선택과 무관하다.

[0280] 지정 및 명명법에 관한 상술한 해석상의 고려사항에 따르면, 본 명세서에서 세트에 대한 명시적 언급은 화학적으로 의미가 있는 경우에 달리 명시하지 않는 한, 이러한 세트의 실시 형태에 대한 독립적인 언급, 및 명시적으로 언급된 세트의 서브세트의 가능한 모든 하나하나의 실시 형태에 대한 언급을 의미하는 것으로 이해된다.

[0281] 치환기 용어에 대한 첫 번째 예로서, 치환기 S_1^1 이 S_1 및 S_2 중 하나이고, 치환기 S_2^2 가 S_3 및 S_4 중 하나이면, 이러한 지정은 S_1^1 이 S_1 이고, S_2^2 가 S_3 인 선택; S_1^1 이 S_1 이고, S_2^2 가 S_4 인 선택; S_1^1 이 S_2 이고, S_2^2 가 S_3 인 선택; S_1^1 이 S_2 이고, S_2^2 가 S_4 인 선택; 및 이러한 선택의 각각의 등가물에 따라 주어진 본 발명의 실시 형태를 나타낸다. 따라서, 더 짧은 용어 " S_1^1 은 S_1 및 S_2 중 하나이고, S_2^2 는 S_3 및 S_4 중 하나임"이 간략화를 위해 본 명세서에서 사용되지만, 제한되는 것은 아니다. 일반적인 용어로 언급된 치환기 용어에 관한 상술한 첫 번째 예는 본 명세서에 기재된 다양한 치환기 지정을 설명하기 위한 것이다. 치환기에 대하여 본 명세서에 주어진 상술한 표기법은 적용가능한 경우, R^1 , $\text{R}^{1'}$, R^2 , $\text{R}^{2'}$, R^4 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^f , R^g , R^h , HAL, PG, LG, n , Ar^1 , $\text{Ar}^{1'}$, Ar^2 , Ar^3 와 같은 구성원 및 본 명세서에 사용된 임의의 다른 일반 치환기 기호로 확대 적용한다.

[0282] 게다가, 임의의 구성원 또는 치환기에 대하여 하나 이상의 지정이 주어지는 경우, 본 발명의 실시 형태는 열거된 지정으로부터 형성될 수 있는, 독립적으로 취해진 다양한 그룹 및 그 등가물을 포함한다. 치환기 용어에 대한 두 번째 예로서, 치환기 $\text{S}_\text{예}$ 가 S_1 , S_2 및 S_3 중 하나인 것으로 기술된다면, 이러한 목록은 $\text{S}_\text{예}$ 가 S_1 이고; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_2 이며; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_3 이고; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_1 및 S_2 중 하나이며; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_1 및 S_3 중 하나이고; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_2 및 S_3 중 하나이며; $\text{S}_\text{예}$ 가 S_1 , S_2 및 S_3 중 하나이고; $\text{S}_\text{예}$ 가 이러한 선택의 각각의 임의의 등가물인 본 발명의 실시 형태를 나타낸다. 따라서, 더 짧은 용어 " $\text{S}_\text{예}$ 는 S_1 , S_2 및 S_3 중 하나임"이 간략화를 위해 본 명세서에서 사용되지만, 제한되는 것은 아니다. 일반적인 용어로 언급된 치환기 용어에 관한 상술한 두 번째 예는 본 명세서에 기재된 다양한 치환기 지정을 설명하기 위한 것이다. 치환기에 대하여 본 명세서에 주어진 상술한 표기법은 적용가능한 경우, R^1 , $\text{R}^{1'}$, R^2 , $\text{R}^{2'}$, R^4 , R^{10} , R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} , R^{15} , R^{16} , R^{17} , R^{18} , R^{19} , R^f , R^g , R^h , HAL, PG, LG, n , Ar^1 , $\text{Ar}^{1'}$, Ar^2 , Ar^3 와 같은 구성원 및 본 명세서에 사용된 임의의 다른 일반 치환기 기호로 확대 적용한다.

[0283] $j > i$ 인 " C_{i-j} " 명칭은 본 명세서에서 치환기의 부류에 적용되는 경우, i 및 j 를 포함하여 i 내지 j 의 탄소 구성원의 수의 모든 하나하나가 독립적으로 실현되는 본 발명의 실시 형태를 나타내고자 한다. 예로서, 용어 " C_{1-4} "는 독립적으로, 1개의 탄소 구성원(C_1)을 갖는 실시 형태, 2개의 탄소 구성원(C_2)을 갖는 실시 형태, 3개의 탄

소 구성원(C_3)을 갖는 실시 형태 및 4개의 탄소 구성원(C_4)을 갖는 실시 형태를 나타낸다.

- [0284] 용어 " C_{n-m} 알킬"은 직쇄 또는 분지쇄에 관계없이, 쇠의 탄소 구성원의 총수 N 이 $n \leq N \leq m$ ($m > n$)을 충족시키는 지방족 쇠를 의미한다. 본 명세서에서 언급되는 임의의 이치환기(disubstituent)는 하나보다 많은 부착 가능성이 허용될 때 다양한 부착 가능성을 포함하는 것을 의미한다. 예를 들어, 이치환기 $-A-B-$ (여기서, $A \neq B$ 임)에 대한 언급은 본 명세서에서, 제1 치환 구성원에 부착된 A 및 제2 치환 구성원에 부착된 B 를 갖는 그러한 이치환기를 말하며, 그것은 또한, 제2 치환 구성원에 부착된 A 및 제1 치환 구성원에 부착된 B 를 갖는 그러한 이치환기를 말한다.
- [0285] 본 발명은 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물, 바람직하게는 상술한 것들 및 본 명세서에 예시되는 특정 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 및 그러한 염을 이용한 치료 방법을 또한 포함한다.
- [0286] 용어 "약제학적으로 허용가능한"은 동물, 특히 인간에서 사용하기 위한, 연방 또는 주정부의 규제 기관, 또는 미국 이외의 국가의 대응 기관, 또는 미국 약전 또는 다른 일반적으로 승인된 약전에 언급된 기관에 의해 승인되거나 승인될 수 있는 것을 의미한다.
- [0287] "약제학적으로 허용가능한 염"은 비독성이거나, 생물학적으로 용인되거나, 그 밖에 대상에게 투여하기에 생물학적으로 적합한 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))로 나타내는 화합물의 유리 산 또는 염기의 염을 의미하는 것으로 의도된다. 그것은 모 화합물의 원하는 약리 활성을 지녀야 한다. 일반적으로, 문헌[G.S. Paulekuhn, et al., "Trends in Active Pharmaceutical Ingredient Salt Selection based on Analysis of the Orange Book Database", *J. Med. Chem.*, 2007, 50:6665-72, S.M. Berge, et al., "Pharmaceutical Salts", *J Pharm Sci.*, 1977, 66:1-19, and *Handbook of Pharmaceutical Salts, Properties, Selection, 및 Use*, Stahl 및 Wermuth, Eds., Wiley-VCH 및 VHCA, Zurich, 2002]을 참조한다. 약제학적으로 허용가능한 염의 예로는 약리학적으로 효과적이며 과다한 독성, 자극, 또는 알러지 반응없이 환자의 조직과 접촉하기에 적합한 것들이다. 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물은 충분히 산성인 기, 충분히 염기성인 기, 또는 두 가지 유형의 작용기를 가질 수 있고, 따라서, 다수의 무기 또는 유기 염 기, 및 무기 및 유기 산과 반응하여 약제학적으로 허용가능한 염을 형성할 수 있다.
- [0288] 약제학적으로 허용가능한 염의 예에는 황산염, 파이로황산염, 중황산염, 아황산염, 중아황산염, 인산염, 일수소 인산염, 이수소 인산염, 메타인산염, 파이로인산염, 염화물, 브롬화물, 요오드화물, 아세트산염, 프로피온산염, 데칸산염, 카프릴산염, 아크릴산염, 포름산염, 아이소부티르산염, 카프로산염, 헵탄산염, 프로피올산염, 옥살산염, 말론산염, 석신산염, 수베르산염, 세바스산염, 푸마르산염, 말레산염, 부탄-1,4-다이오에이트, 헥산-1,6-다이오에이트, 벤조산염, 클로로벤조산염, 메틸벤조산염, 다이니트로벤조산염, 하이드록시벤조산염, 메톡시벤조산염, 프탈산염, 설펜산염, 자일렌설펜산염, 페닐아세트산염, 페닐프로피온산염, 페닐부티르산염, 시트르산염, 락트산염, γ -하이드록시부티르산염, 글리콜산염, 타르타르산염, 메탄-설펜산염, 프로판설펜산염, 나프탈렌-1-설펜산염, 나프탈렌-2-설펜산염 및 만델산염이 포함된다.
- [0289] 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물이 염기성 질소를 함유하는 경우에, 원하는 약제학적으로 허용가능한 염은 당해 기술분야에서 이용가능한 임의의 적절한 방법에 의해 제조될 수 있다. 예를 들어, 유리 염기를 무기 산, 예컨대 염산, 브롬화수소산, 황산, 설펜산, 질산, 붕산, 인산 등으로 처리하거나, 유기 산, 예컨대 아세트산, 페닐아세트산, 프로피온산, 스테아르산, 락트산, 아스코르브산, 말레산, 하이드록시말레산, 이세티온산, 석신산, 말레르산, 푸마르산, 말론산, 피루브산, 옥살산, 글리콜산, 살리실산, 올레산, 팔미트산, 라우르산, 피라노시딜산 (pyranosidyl acid), 예컨대 글루쿠론산 또는 갈락투론산, 알파-하이드록시산, 예컨대 만델산, 시트르산, 또는 타르타르산, 아미노산, 예컨대 아스파르트산, 글루타르산 또는 글루탐산, 방향족산, 예컨대 벤조산, 2-아세톡시벤조산, 나프토산, 또는 신남산, 설펜산, 예컨대 라우릴설펜산, p -톨루엔설펜산, 메탄설펜산, 에탄설펜산, 본 명세서에 예로서 주어진 것들과 같은 산의 임의의 상용성 혼합물, 및 당해 기술분야의 통상의 기술 수준을 고려하여, 등가물 또는 허용가능한 대체물로서 간주되는 임의의 다른 산 및 이의 혼합물로 처리함으로써 제조될 수 있다.
- [0290] 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물이 카르복실산 또는 설펜산과 같은 산인 경우에, 원하는 약제학적으로 허용가능한 염은 임의의 적절한 방법, 예를 들어 유리 산을 무기 또는 유기 염기, 예를 들어 아민(일차, 이차 또는 삼차), 알칼리 금속

수산화물, 알칼리 토금속 수산화물, 본 명세서에 예로서 주어진 것들과 같은 염기의 임의의 상용성 혼합물, 및 당해 기술분야의 통상의 기술 수준을 고려하여, 등가물 또는 허용가능한 대체물로서 간주되는 임의의 다른 염기 및 이의 혼합물로 처리함으로써 제조될 수 있다. 적절한 염의 예시적인 예로는 아미노산, 예컨대 *N*-메틸-D-글루카민, 라이신, 콜린, 글리신 및 아르기닌, 암모니아, 탄산염, 중탄산염, 일차, 이차, 및 삼차 아민, 및 환상 아민, 예컨대 트로메타민, 벤질아민, 피롤리딘, 피페리딘, 모르폴린, 및 피페라진으로부터 유도되는 유기 염, 및 나트륨, 칼슘, 칼륨, 마그네슘, 망간, 철, 구리, 아연, 알루미늄, 및 리튬으로부터 유도되는 무기 염을 들 수 있다.

[0291] 본 발명은 또한 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭, 및 이러한 약제학적으로 허용가능한 프로드럭을 사용하는 치료 방법에 관한 것이다. 용어 "프로드럭"은 지정된 화합물의 전구체를 의미하며, 이는 대상에게 투여된 후에 가용매 분해 또는 효소적 절단과 같은 화학적 또는 생리적 과정을 통해, 또는 생리적 조건 하에(예를 들어, 생리적 pH에 도달하면 프록드럭이 화학식 (I)의 화합물로 전환됨), 생체내에서 그 화합물을 생성한다. "약제학적으로 허용가능한 프로드럭"은 비독성이며, 생물학적으로 용인되며, 그 밖에 대상에게 투여하기에 생물학적으로 적합한 프로드럭이다. 적절한 프로드럭 유도체의 선택과 제조를 위한 예시적인 절차는 예를 들어, 문헌["*Design of Prodrugs*", ed. H. Bundgaard, Elsevier, 1985]에 기재되어 있다.

[0292] 예시적인 프로드럭에는 아미드 또는 에스테르 결합을 통하여 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물의 유리 아미노기, 하이드록실기, 또는 카르복실산기에 공유 결합되는, 아미노산 잔기, 또는 2개 이상(예를 들어, 2개, 3개 또는 4개)의 아미노산 잔기의 폴리펩티드쇄를 가진 화합물이 포함된다. 아미노산 잔기의 예에는 통상 3 문자 기호(three letter symbol)로 표기되는 20개의 자연 발생 아미노산뿐만 아니라, 4-하이드록시프로린, 하이드록시라이신, 데모신, 아이소데모신, 3-메틸히스티딘, 노르발린, 베타-알라닌, 감마-아미노부티르산, 시트룰린, 호모시스테인, 호모세린, 오르니틴 및 메티오닌 설푼도 포함된다.

[0293] 추가의 프로드럭 유형이 예를 들어, 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 구조의 유리 카르복실기를 아미드 또는 알킬 에스테르로서 유도체 화합함으로써 생성될 수 있다. 아미드의 예에는 암모니아, 일차 C₁₋₆알킬 아민 및 이차 다이(C₁₋₆알킬)아민으로부터 유도된 것들이 포함된다. 이차 아민에는 5원 또는 6원 헤테로사이클로알킬 또는 헤테로아릴 고리 부분이 포함된다. 아미드의 예에는 암모니아, C₁₋₃알킬 일차 아민 및 다이(C₁₋₂알킬)아민으로부터 유도된 것들이 포함된다. 본 발명의 에스테르의 예에는 C₁₋₇알킬, C₅₋₇사이클로알킬, 페닐 및 페닐(C₁₋₆알킬) 에스테르가 포함된다. 바람직한 에스테르에는 메틸 에스테르가 포함된다. 프로드럭은 또한 문헌[Fleisher et al., *Adv. Drug Delivery Rev.* 1996, 19, 115-130]에 개요된 것들과 같은 절차에 따라, 헤미석시네이트, 포스페이트 에스테르, 다이메틸아미노아세테이트, 및 포스포릴옥시메틸옥시카르보닐을 비롯한 기들을 사용하여 유리 하이드록시기를 유도체화함으로써 제조될 수 있다. 하이드록시기 및 아미노기의 카르바메이트 유도체가 또한 프로드럭을 생성할 수 있다. 하이드록시기의 카르보네이트 유도체, 설포네이트 에스테르, 및 설페이트 에스테르가 또한 프로드럭을 제공할 수 있다. 아실기가 하나 이상의 에테르, 아민, 또는 카르복실산 작용기로 임의로 치환된 알킬 에스테르일 수 있거나, 아실기가 상술한 아미노산 에스테르인 경우에는, (아실옥시)메틸 및 (아실옥시)에틸 에테르로서의 하이드록시기의 유도체화도 프로드럭을 생성하기에 유용하다. 이러한 유형의 프로드럭은 문헌[Robinson et al., *J Med Chem.* 1996, 39 (1), 10-18]에 기재된 바와 같이 제조될 수 있다. 유리 아민은 또한 아미드, 설포아미드 또는 포스포아미드로서 유도체화될 수 있다. 모든 이들 프로드럭의 부분은 에테르, 아민 및 카르복실산 작용기를 비롯한 기들을 포함할 수 있다.

[0294] 또한, 본 발명은 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물에 관한 것이며, 이는 또한 본 발명의 방법에 사용될 수 있다. "약제학적으로 활성인 대사산물"은 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물 또는 이의 염의 약리학적으로 활성인 체내 대사산물을 의미한다. 화합물의 프로드럭 및 활성 대사산물은 당업계에 알려져 있거나 이용가능한 일상적인 기술을 이용하여 결정될 수 있다. 예를 들어, 문헌[Bertolini, et al., *J Med Chem.* 1997, 40, 2011-2016]; 문헌[Shan, et al., *J Pharm Sci.* 1997, 86 (7), 765-767]; 문헌[Bagshawe, *Drug Dev Res.* 1995, 34, 220-230]; 문헌[Bodor, *Adv Drug Res.* 1984, 13, 224-331]; 문헌[Bundgaard, *Design of Prodrugs* (Elsevier Press, 1985)]; 및 문헌[Larsen, *Design and Application of Prodrugs, Drug Design and Development* (Krogsgaard-

Larsen, et al., eds., Harwood Academic Publishers, 1991)]을 참조한다.

[0295] 본 발명의 화학식 (I) (및 화학식 (IA), 화학식 (IB), 화학식 (IC), 화학식 (ID), 화학식 (II), 화학식 (IIA) 및 화학식 (IIB))의 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 약제학적으로 활성인 대사산물은 본 발명의 방법에서 NR2B 수용체의 조절제로서 유용하다. 이러한 조절제로서의 화합물은 길항제, 작용제 또는 역작용제로서 작용할 수 있다. 용어 "조절제"는 저해제 및 활성화제 둘 다를 포함하며, 여기서 "저해제"는 NR2B 수용체의 발현 또는 활성을 감소시키거나, 저지하거나, 불활성화하거나, 탈감작시키거나, 하향 조절하는 화합물을 말하고, "활성화제"는 NR2B 수용체의 발현 또는 활성을 증가시키거나, 활성화시키거나, 촉진시키거나, 감작시키거나, 상향 조절하는 화합물이다.

[0296] 본 명세서에서 사용되는 용어 "치료하다", "치료" 또는 "치료하는"은 NR2B 수용체 활성의 조절을 통해 치료적 또는 예방적 효과를 일으킬 목적으로 대상에게 본 발명의 활성제 또는 조성물을 투여하는 것을 말하는 것으로 의도된다. 치료는 NR2B 수용체 활성의 조절을 통해 매개되는 질환, 장애 또는 상태, 또는 그러한 질환, 장애 또는 상태의 하나 이상의 증상을 회복시키거나, 개선시키거나, 완화시키거나, 진행을 억제하거나, 중증도를 저하시키거나, 예방하는 것을 포함한다. 용어 "대상"은 이러한 치료를 필요로 하는 포유류 환자, 예컨대 인간을 말한다.

[0297] 따라서, 본 발명은 우울증, 경조증, 조증 및 혼합형 양극성 장애 I형; 양극성 장애 II형; 우울장애, 예컨대 일회성 우울삽화 또는 재발성 주요 우울장애, 경도 우울장애, 치료 저항성 우울증, 산후 발병 우울장애, 파괴적 기분조절 곤란 장애, 정신병적 증상을 동반한 우울장애; 지속성 기분장애, 예컨대 순환기질, 기분변조, 정상기분; 및 월경전 불쾌기분장애; 불안장애, 범불안장애, 광장공포증을 동반하거나 동반하지 않는 공황장애, 특정 공포증, 사회불안장애, 만성 불안장애; 강박장애; 심한 스트레스에 대한 반응 및 적응 장애, 예컨대 외상 후 스트레스 장애 (PTSD); 기타 신경증성 장애, 예컨대 이인증-비현실감 증후군; 아스퍼거 증후군 및 레트 증후군, 자폐성 장애, 소아 자폐증 및 정신지체 및 상동적 운동을 수반한 과활동성장애를 포함하나 이에 한정되지 않는 전반적 발달장애, 특정 운동기능 발달장애, 특정 학업기술 발달장애; 출산 후 (산후) 및 출산 전 우울증; 신경성 식욕부진, 신경성 과식증, 이식증 및 폭식 장애를 포함하나 이에 한정되지 않는 섭식장애; 파킨슨병; 이차 파킨슨증, 예컨대 뇌염후 파킨슨증; 다른 장애에 포함된 파킨슨증; 루이소체병; 기저핵의 퇴행성 질환; 진전, 본태성 진전 및 약물 유발성 진전, 간대성 근경련, 무도병 및 약물 유발성 무도병, 약물 유발성 틱 및 기질적 원인의 틱, 약물 유발성 급성 근육긴장이상, 약물 유발성 지발성 운동이상, 레보도파 유발성 운동이상을 포함하나 이에 한정되지 않는 기타 추체외로 및 운동장애; 신경이완제 약성 증후군(NMS), 신경이완제 유발성 파킨슨병, 신경이완제 유발성 조발성 또는 급성 운동이상, 신경이완제 유발성 급성 근육긴장이상, 신경이완제 유발성 급성 좌불안석증, 신경이완제 유발성 지발성 운동이상, 신경이완제 유발성 진전을 포함하나 이에 한정되지 않는 신경이완제 유발성 운동장애; 하지 불안 증후군, 근육강직 증후군; 국소성 근육긴장이상, 다소성 또는 분절성 근육긴장이상, 염전성 근육긴장이상, 반구성, 전신성 및 지발성 근육긴장이상 (정신약리학적 약물에 의해 유발됨) 포함하나 이에 한정되지 않는 근육긴장이상과 같은 NR2B 수용체 활성에 의해 매개되는 질환, 장애, 또는 상태로 진단되거나 이를 앓고 있는 대상을 치료하기 위하여 본 명세서에 기재된 화합물을 사용하는 방법에 관한 것이다. 국소성 근육긴장이상은 경부 근육긴장이상(사경), 안검 경련(눈꺼풀 경련), 사지 근육긴장이상(서경과 같은 사지의 경련), 구강하악 근육긴장이상 및 경련성 발성장애(성대 경련); 국소발병의 발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 특발성 간질 및 간질 증후군, 단순부분발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 증상성 간질 및 간질 증후군, 복합부분발작을 동반한 국소화관련(초점성) (부분적) 증상성 간질 및 간질 증후군, 전신성 특발성 간질 및 간질 증후군(영아기 마이오클로누스 간질, 신생아 경련(가족성), 소아기 압상스 간질(피크노렙시), 각성시 대발작을 동반한 간질, 압상스 간질, 마이오클로누스 간질(충동성 소발작) 및 비특이성 무긴장성, 간대성, 마이오클로누스, 긴장성, 강직 간대성 간질발작을 포함하나 이에 한정되지 않음)을 포함한 간질; 마이오클로누스 압상스를 동반한 간질, 마이오클로누스-기립불능 발작, 영아연축, 레녹스-가스토 증후군, 살람발작, 증상성 조기 마이오클로누스 뇌병증, 웨스트 증후군, 소발작 및 대발작; 간질지속증; 지속성 신체형 장애; 급성, 만성 및 만성 난치성 통증, 두통; 등통증, 치통, 복통, 요통, 관절통을 포함하나 이에 한정되지 않는 생리적 과정 및 신체 장애와 관련된 급성 및 만성 통증; 류머티즘, 근육통, 신경통 및 섬유근육통을 포함하나 이에 한정되지 않는 근골격계 및 결합조직 질환과 관련된 급성 및 만성 통증; 삼차신경통, 대상포진후 신경통, 통증을 동반한 환상지 증후군, 손목 터널 증후군, 좌골신경의 병변, 당뇨병성 단일신경병증 등의 신경, 신경근 및 신경총 장애와 관련된 급성 및 만성 통증; 유전성 및 특발성 신경병증, 염증성 다발신경병증, 약물, 알코올 또는 독성물질에 의한 다발신경병증, 신생물성 질환에서의 다발신경병증, 당뇨병성 다발신경병증 등의 다발신경병증 및 말초신경계통의 기타 장애와 관련된 급성 및 만성 통증; 및 급성 신경변성, 예컨대 두개내 뇌손상, 예컨대 뇌졸중, 미만성 및 국소성 뇌손상, 경막외, 경막하 및 지주막하 출혈, 및 만성 신경변성, 예컨대

알츠하이머병, 헌팅턴병, 다발성 경화증 및 ALS; 지주막하 출혈, 뇌내 출혈 및 기타 비외상성 두개내 출혈, 뇌 경색, 뇌졸중, 뇌경색을 유발하지 않는 뇌전동맥 및 대뇌동맥의 폐색 및 협착, 대뇌동맥의 박리, 뇌동맥류, 대뇌 죽상경화증, 진행성 혈관성 백질뇌증, 고혈압성 뇌증, 두개내 정맥계통의 비화농성 혈전증, 뇌동맥염, 뇌 아밀로이드 혈관병증 및 뇌혈관질환의 후유증; 녹내장 및 기타 신경병증; 치매, 혈관성 치매, 루이소체 치매, 전두측두엽 치매 및 HIV 치매; 현기증 및 안진; 이명; 신경정신학적 전신성 흥반성 루푸스; 파괴적 기분조절 곤란 장애; 정신분열증 스펙트럼 장애; 및 수면-각성 장애를 포함한다.

[0298] 본 발명의 치료 방법에 있어서, 본 발명의 약제학적 제제의 유효량은 이러한 질환, 장애, 또는 상태를 앓고 있거나 이것으로 진단을 받은 대상에게 투여된다. "유효량"은 통상 지정된 질환, 장애 또는 상태의 치료를 필요로 하는 환자에 있어서의 원하는 치료적 또는 예방적 효과를 가져오기에 충분한 양 또는 용량을 의미한다. 본 발명의 화합물의 유효량 또는 유효 용량은 모델링, 용량 점증 연구 또는 임상 시험과 같은 일상적 방법에 의해, 그리고 일상적 인자들, 예를 들어 투여 또는 약물 전달의 방식 또는 경로, 화합물의 약동학적 특성, 질환, 장애, 또는 상태의 중증도 및 경과, 대상의 이전의 치료 또는 진행 중인 치료, 대상의 건강 상태 및 약물에 대한 반응, 및 치료 의사의 판단을 고려함으로써 확인될 수 있다. 용량의 예는, 단회 또는 분할 투여 단위 (예를 들어, BID, TID, QID)로 약 0.001 내지 약 200 mg(화합물)/kg(대상 체중)/일, 바람직하게는 약 0.05 내지 100 mg/kg/일, 또는 약 1 내지 35 mg/kg/일의 범위이다. 70 kg의 인간인 경우, 적절한 투여량에 대한 예시적인 범위는 약 0.05 내지 약 7 g/일 또는 약 0.2 내지 약 2.5 g/일이다.

[0299] 환자의 질환, 장애, 또한 상태의 개선이 일어났다면, 용량은 예방적 치료 또는 유지 치료를 위해 조절될 수 있다. 예를 들어, 투여 용량 또는 투여 빈도, 또는 이들 둘 다는 증상의 함수로서 원하는 치료 또는 예방 효과가 유지되는 레벨로 감소될 수 있다. 물론, 증상이 적절한 레벨로 경감되었다면, 치료는 중단될 수 있다. 그러나, 환자는 증상의 재발 시에 장기적으로 간헐적 치료를 필요로 할 수 있다.

[0300] 추가적으로, 본 발명의 활성제는 상기 상태들의 치료에서 추가의 활성 성분들과 조합되어 사용될 수 있다. 추가의 활성 성분은 표 1의 화합물의 활성제와 별도로 동시 투여될 수 있거나, 이러한 약제와 함께 본 발명의 약제학적 조성물에 포함될 수 있다. 예시적 실시 형태에서, 추가의 활성 성분은 NR2B 활성에 의해 매개되는 상태, 장애, 또는 질환의 치료에 효과적인 것으로 알려지거나 발견된 것들, 예를 들어, 특정 상태, 장애, 또는 질환과 관련된 다른 표적에 대해 활성인 다른 NR2B 조절제 또는 화합물이다. 병용은 효능을 증가시키거나 (예를 들어, 본 발명의 활성제의 효능 또는 유효성을 높이는 화합물을 배합물에 포함시킴으로써), 하나 이상의 부작용을 감소시키거나, 본 발명의 활성제의 필요 용량을 감소시키는 작용을 할 수 있다.

[0301] 본 발명의 활성제는 본 발명의 약제학적 조성물을 제제화하기 위해, 단독으로 또는 하나 이상의 추가의 활성 성분과 병용하여 사용된다. 본 발명의 약제학적 조성물은 (a) 적어도 하나의 본 발명의 활성제의 유효량; 및 (b) 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함한다.

[0302] "약제학적으로 허용되는 부형제"는 비독성이면서 생물학적 내성을 나타내며, 그 밖에 대상체에게 투여하기에 생물학적으로 적합한 물질, 예컨대 약리학 적 조성물에 첨가되거나, 아니면 약제의 투여를 촉진시키도록 비히클, 담체, 또는 희석제로서 사용되고 이것과 상용성을 갖는 불활성 물질을 지칭한다. 부형제의 예로는 탄산칼슘, 인산칼슘, 각종 당 및 전분 종류, 셀룰로스 유도체, 젤라틴, 식물유 및 폴리에틸렌 글리콜을 들 수 있다.

[0303] 활성제의 하나 이상의 용량 단위를 포함하는 약제학적 조성물의 전달 형태는 당해 기술분야의 숙련가에게 공지되거나 이용할 수 있게 된 적절한 약제학적 부형제 및 배합 기술을 이용하여 제조될 수 있다. 조성물은 적절한 전달 경로, 예를 들어 경구, 비경구, 직장, 국소, 또는 안구 경로에 의해, 또는 흡입에 의해 본 발명의 방법에서 투여될 수 있다.

[0304] 제제는 정제, 캡슐, 샷세 (sachet), 당의정, 분제, 과립, 로젠지 (lozenge), 재구성용 분제, 액체 제제, 또는 좌제의 형태일 수 있다. 바람직하게는, 조성물은 정맥내 주사, 국소 투여, 또는 경구 투여용으로 제형화된다.

[0305] 경구 투여의 경우, 본 발명의 화합물은 정제 또는 캡슐의 형태로, 또는 용액, 에멀전, 또는 현탁액으로서 제공될 수 있다. 경구 조성물을 제조하기 위해, 화합물은 예를 들어, 1일 약 0.05 내지 약 100 mg/kg, 1일 약 0.05 내지 약 35 mg/kg, 또는 1일 약 0.1 내지 약 10 mg/kg의 투여량을 산출하도록 제형화될 수 있다. 예를 들어, 1일 약 5 mg 내지 5 g의 총 1일 투여량은 1일 1회, 2회, 3회 또는 4회 투여하여 달성될 수 있다.

[0306] 경구 정제는 약제학적으로 허용가능한 부형제, 예를 들어 불활성 희석제, 붕해제, 결합제, 윤활제, 감미제, 향미제, 착색제 및 방부제와 혼합된 본 발명의 화합물을 포함할 수 있다. 적절한 불활성 충전제로는 탄산나트륨 및 탄산칼슘, 인산나트륨 및 인산칼슘, 락토스, 전분, 당, 글루코스, 메틸 셀룰로스, 스테아르산마그네슘, 만니

톨, 소르비톨 등을 들 수 있다. 전형적인 액체 경구 부형제로는 에탄올, 글리세롤, 물 등을 들 수 있다. 전분, 폴리비닐-피롤리돈 (PVP), 전분글리콜산나트륨, 미결정성 셀룰로스 및 알긴산은 적절한 봉해제이다. 결합제로는 전분 및 젤라틴을 들 수 있다. 율활제는 존재하는 경우, 스테아르산마그네슘, 스테아르산 또는 텔크 일 수 있다. 필요에 따라, 정제는 위장관에서의 흡수를 지연시키도록 모노스테아르산글리세릴 또는 다이스테아르산글리세릴과 같은 물질로 코팅되거나, 장용 코팅으로 코팅될 수 있다.

[0307] 경구 투여용 캡슐은 경질 및 연질 젤라틴 캡슐을 포함한다. 경질 젤라틴 캡슐을 제조하기 위해, 본 발명의 화합물은 고형, 반고형, 또는 액상 희석제와 혼합될 수 있다. 연질 젤라틴 캡슐은 본 발명의 화합물을 물, 오일, 예를 들어 땅콩유 또는 올리브유, 액체 파라핀, 단쇄 지방산의 모노- 및 다이글리세라이드의 혼합물, 폴리에틸렌 글리콜 400, 또는 프로필렌 글리콜과 혼합함으로써 제조될 수 있다.

[0308] 경구 투여용 액체는 현탁액, 용액, 에멀전 또는 시럽의 형태일 수 있거나, 사용 전에 물이나 다른 적절한 비히클과의 재구성을 위한 건조 제품으로서 제공되거나 동결 건조될 수 있다. 이러한 액체 조성물은 약제학적으로 허용가능한 부형제, 예컨대 현탁화제 (예를 들어, 소르비톨, 메틸 셀룰로스, 알긴산나트륨, 젤라틴, 하이드록시 에틸셀룰로스, 카르복시메틸셀룰로스, 스테아르산알루미늄 겔 등); 비수성 비히클, 예를 들어, 오일 (예를 들어, 아몬드 오일 또는 분별된 코코넛 오일), 프로필렌 글리콜, 에틸 알코올, 또는 물; 방부제 (예를 들어, 메틸 또는 프로필 p-하이드록시벤조에이트 또는 소르브산); 습윤제, 예를 들어 레시틴; 및, 필요에 따라, 향미제 또는 착색제를 임의로 함유할 수 있다.

[0309] 본 발명의 활성제는 또한 비경구 경로로 투여될 수 있다. 예를 들어, 조성물은 좌제로 직장 투여용으로 제형화될 수 있다. 정맥내, 근육내, 복강내, 또는 피하 경로를 비롯한 비경구적 사용의 경우, 본 발명의 화합물은 적절한 pH 및 등장성이 되도록 완충된, 멸균 수용액 또는 현탁액이나, 비경구용으로 허용가능한 오일로 제공될 수 있다. 적절한 수성 비히클은 링거액 및 등장 식염수를 포함한다. 그러한 형태는 앰플 또는 일회용 주사 기구와 같은 단위 용량 형태, 적절한 용량을 꺼낼 수 있는 바이알과 같은 다회 용량 형태, 또는 주사 체계를 제조하는데 사용될 수 있는 고체 형태나 예비 농축물 (pre-concentrate)로 제공될 것이다. 예시적인 주입 용량은 수분 내지 수 일 범위의 기간에 걸쳐 약제학적 담체와 혼합되는 화합물이 약 1 내지 1000 $\mu\text{g/kg/min}$ 인 범위일 수 있다.

[0310] 국소 투여의 경우, 화합물은 비히클에 대하여 약 0.1% 내지 약 10%의 약물의 농도로 약제학적 담체와 혼합될 수 있다. 본 발명의 화합물을 투여하는 다른 방식은 경피 전달에 영향을 주기 위해 패치 제형을 이용할 수 있다.

[0311] 대안적으로, 본 발명의 화합물은 본 발명의 방법에서, 예를 들어 적절한 담체를 또한 포함하는 분무 제형으로 비강 또는 경구 경로를 통하여 흡입에 의해 투여될 수 있다.

[0312] 이제부터, 본 발명의 방법에 유용한 예시적인 화합물은 이의 일반적인 제조를 위한 하기 예시적인 합성 반응 도식 및 후술하는 구체적인 실시예를 참조하여 설명될 것이다. 당해 기술분야의 숙련가는 본 명세서의 각종 화합물을 얻기 위해, 최종적으로 원하는 치환기가 필요에 따라 보호되거나 보호되지 않고서 반응 도식을 통해 가지게 되어, 원하는 생성물을 얻도록 출발물질이 적절히 선택될 수 있음을 인지할 것이다. 대안적으로, 최종적으로 원하는 치환기 대신에, 반응 도식을 통해 가질 수 있으며, 필요에 따라 원하는 치환기로 치환될 수 있는 적절한 기를 사용하는 것이 필요하거나 바람직할 수 있다. 달리 명시되지 않으면, 변수는 화학식 (I)에 대하여 상기에 정의된 바와 같다. 반응은 용매의 융점과 환류 온도 사이에서, 바람직하게는 0°C 내지 용매의 환류 온도에서 행해질 수 있다. 반응물은 통상적인 가열 또는 마이크로파 가열을 사용하여 가열될 수 있다. 반응은 또한 용매의 통상적인 환류 온도를 초과하여 밀폐된 압력 용기에서 행해질 수 있다.

[0313] 본 명세서에서 사용된 약어 및 두문자어는 다음을 포함한다.

[0314] [표 4]

용어	두문자어
아세토니트릴	ACN
수성	aq
기압	atm
<i>tert</i> -부틸카르바모일	Boc 또는 BOCa
브로드	br
규조토	셀라이트(Celite) [®]
다이에틸아미노황 트라이플루오라이드	DAST
다이- <i>tert</i> -부틸 아조다이카르복실레이트	DBAD
1,8-다이아자바이사이클로[5.4.0]운데스-7-엔	DBU
다이클로로메탄	DCM
비스(2-메톡시에틸)아미노황 트라이플루오라이드	테옥소-플루오르(Deoxo-Fluor) [®]
다이아이소프로필에틸아민	DIPEA, DIEA, 후니그 염기(Hunig's base)
4-다이메틸아미노피리딘	DMAP
1,2-다이메톡시에탄	DME
<i>N,N</i> -다이메틸포름아미드	DMF
다이메틸설폭사이드	DMSO
1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카르보다이이미드	EDCI, EDAC 또는 EDC
다이에틸 에테르	에테르, Et ₂ O
아세트산에틸	EtOAc 또는 EA
에탄올	EtOH
전기분무 이온화(electrospray ionization)	ESI
순상 실리카 겔 크로마토그래피	FCC
그램	g
시간	h
하이드록시벤조트라이아졸	HOBt
고압 액체 크로마토그래피	HPLC
헤르츠	Hz
아이소프로필 알코올	<i>i</i> PrOH, IPA
수소화알루미늄리튬	LAH
액체 크로마토그래피 및 질량 분석	LCMS
리튬 비스(트라이메틸실릴)아미드	LHMDS
몰	M
질량 대 전하 비	<i>m/z</i>
메타-클로로퍼옥시벤조산	<i>m</i> CPBA
요오드화메틸	MeI
메탄올	MeOH
밀리그램	mg
분	min
밀리리터	mL
마이크로리터	μL
밀리몰	mmol
질량 분석	MS
노르말	N
나트륨 <i>tert</i> -부톡사이드	NaO <i>t</i> -Bu
핵자기 공명	NMR
CF ₃ SO ₃ ⁻ 또는 트라이플레이트	OTf
팔라듐 (II) 아세테이트	Pd(OAc) ₂

[0315]

용어	두문자어
팔라듐(II)비스(트라이페닐포스핀) 다이클로라이드	$\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$
테트라키스(트라이페닐포스핀)팔라듐(0)	$\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$
[1,1'-비스(다이- <i>tert</i> -부틸포스포노)페로센]다이클로로팔라듐(II)	$\text{PdCl}_2(\text{dtbpf})$ 또는 $\text{Pd}(\text{dtbpf})_2\text{Cl}_2$
[1,1'-비스(다이페닐포스포노)페로센]다이클로로팔라듐(II)	$\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ 또는 $\text{Pd}(\text{dppf})_2\text{Cl}_2$
백만분율	ppm
침전물	ppt
폴리테트라플루오로에틸렌	PTFE
체류 시간	R_t
실온	rt
포화	sat
1-클로로메틸-4-플루오로-1,4-다이아조니아바이사이클로[2.2.2]옥탄비스(테트라플루오로보레이트)	셀렉트플루오르(Selectfluor) [®]
[2-(트라이메틸실릴)에톡시]메틸 아세탈	SEM
초임계 유체 크로마토그래피	SFC
온도	T
<i>Tert</i> -부틸 알코올	<i>t</i> -BuOH, <i>t</i> -BuOH
테트라- <i>n</i> -부틸암모늄 플루오라이드	TBAF
트라이에틸아민	TEA
트라이플루오로아세트산	TFA
테트라하이드로퓨란	THF
박층 크로마토그래피	TLC
용매 부피(mL)/기질(g)	V 또는 부피
(다이에틸아미노)다이플루오로설포늄 테트라플루오로보레이트	엑스트라플루오르(XtalFluor) [®]

[0316]

[0317]

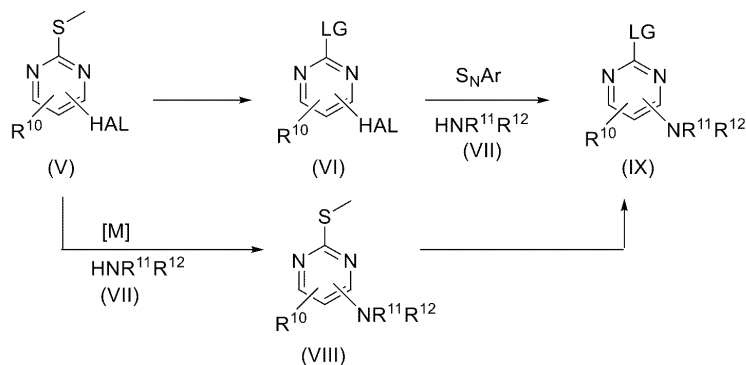
제조예

[0318]

이제부터, 본 발명의 방법에 유용한 예시적인 화합물이 이의 일반적인 제조를 위한 하기 예시적인 합성 반응 도식 및 후술하는 구체적인 실시예를 참조하여 설명될 것이다.

[0319]

반응 도식 A



[0320]

[0321]

반응 도식 A에 따라, HAL이 Cl이고 R^{10} 이 F인 화학식 (V)의 화합물을 당업자에게 알려진 조건 하에 산화시켜, 화학식 (VI)의 화합물을 얻는다. 예를 들어, HAL이 Cl이고, R^{10} 이 F인 화학식 (V)의 화합물의 반응을 0°C 내지 실온 범위의 온도에서 적합한 용매, 예컨대 DCM 등에서 산화제, 예컨대 *m*CPBA로 산화시켜, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (VI)의 화합물을 얻는다.

[0322]

HAL이 Br이고, R^{10} 이 H인, 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 화학식 (V)의 피리미딘을 금속 매개 크로스 커플링에서 화학식 (VII)의 아민과 반응시켜, 화학식 (VIII)의 화합물을 얻는다. 예를 들어, 90 내지 120°C 범위의 온도에서 2 내지 5시간 동안 적합한 용매, 예컨대 톨루엔에서 HAL이 Br이고, R^{10} 이 H인 화학식 (V)의 피리미딘을 팔라듐 촉매, 예컨대 $\text{Pd}(\text{OAc})_2$, 리간드, 예컨대 Xantphos 등, 염기, 예컨대 NaOtBu 등, 아민, 예컨대 아제티딘, 3-플루오로아제티딘, 3,3-다이플루오로아제티딘 등과 반응시켜, 화학식 (VIII)의 화합물을 얻는다. 상술한 조건을 이용하여, 화학식 (VIII)의 화합물을 산화시켜 화학식 (IX)의 화합물을 얻는다.

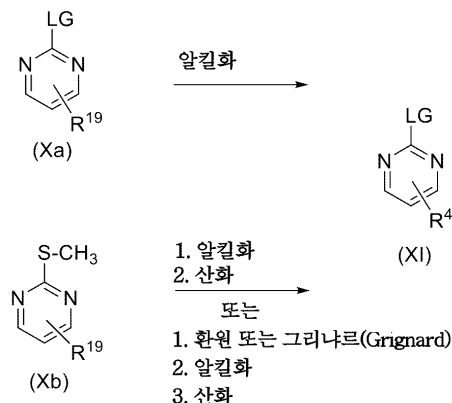
[0323]

LG가 Cl이고, R^{10} 이 H이며, HAL이 Cl인, 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 화학식 (VI)의 피리미딘을 1 내지

6시간 동안 적합한 용매, 예컨대 DMF, THF, DCM 등에서 적합한 염기, 예컨대 TEA가 있거나 없이, 적합한 친핵체, 예컨대 화학식 (VII)의 아민 (여기서, 아민은 하나 이상의 할로젠 구성원으로 임의로 치환되는 알킬아민 또는 헤테로사이클로알킬 아민임)과 반응시켜, 화학식 (IX)(여기서, $NR^{11}R^{12}$ 는 $(N(C_{1-6}알킬)_2)$ 또는 헤테로사이클로알킬아민이고, R^{10} 은 H임)의 화합물을 얻는다. 바람직한 실시 형태에서, 아민은 아제티딘, 3-플루오로아제티딘, 3,3-다이플루오로아제티딘, 피롤리딘, 3,3-다이플루오로피롤리딘 피페리딘 또는 모르폴린이고, 염기는 TEA이다.

[0324]

반응 도식 B



[0325]

[0326]

반응 도식 B에 따라, LG가 Cl이고, R^{19} 이 OH 또는 CH_2OH 인 화학식 (Xa)의 화합물을 용매, 예컨대 DCM 등에서 실릴 클로라이드 시약, 예컨대 tert-부틸(클로로)다이메틸실란 등, 염기, 예컨대 이미다졸과 반응시켜, 화학식 (XI)의 실릴 에테르 화합물을 얻는다. 대안적으로 화학식 (Xa)의 화합물을 0°C 내지 85°C 범위의 온도에서 적합한 용매, 예컨대 DMF, ACN, DCM에서 염기, 예컨대 NaH, K_2CO_3 , Na_2CO_3 , TEA, CS_2CO_3 등을 사용하여 적합한 알킬화제, 예컨대 1-플루오로-2-요오도에탄으로 알킬화하여, R^4 가 $O-C_{1-6}$ 알킬, CH_2O-C_{1-6} 알킬, $O-C_{1-6}$ 퍼할로알킬 또는 CH_2O-C_{1-6} 퍼할로알킬이고, LG가 Cl인 화학식 (XI)의 화합물을 얻는다.

[0327]

LG가 SO_2CH_3 이고, R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬, CH_2O-C_{1-6} 퍼할로알킬 및 CH_2O-CD_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 R^{19} 이 CH_2OH 인 화학식 (Xb)의 화합물로부터 2단계로 제조할 수 있다. 제1 단계에서, 상술한 조건을 이용하여 화학식 (Xb)의 화합물을 적합한 염기, 예컨대 NaH, K_2CO_3 등 및 알킬화제, 예컨대 Et-I, CD_3-I , 2-클로로-2,2-다이플루오로-1-페닐에탄-1-온 등으로 알킬화할 수 있다. 제2 단계에서, 상술한 조건을 이용하는 티오메틸의 산화에 의해 R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬, CH_2O-C_{1-6} 퍼할로알킬 또는 CH_2O-CD_3 이고, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 얻을 수 있다.

[0328]

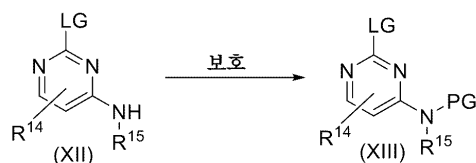
R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬이고, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 또한 R^{19} 이 $C(=O)CH_3$ 또는 CO_2CH_3 인 화학식 (Xb)의 화합물로부터 3단계로 제조할 수 있다. 제1 단계에서, 당업자에게 알려진 조건을 이용하여, 예를 들어 환원제, 예컨대 $LiBH_4$, $LiBD_4$ 등을 사용한 케톤의 환원에 의해, R^{19} 이 CH_2OH 인 화학식 (Xb)의 화합물을 얻을 수 있다. 후속 알킬화 및 산화에 의해, R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬이고, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 얻을 수 있다. 화학식 (Xb)의 화합물이 추가로 할로젠, 예컨대 F로 치환될 수 있다.

[0329]

R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬이고, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 또한 R^{19} 이 $C(=O)CH_3$ 인 화학식 (Xb)의 화합물로부터 3단계로 제조할 수 있다. 당업자에게 알려진 조건을 이용하여 시약, 예컨대 $MeMgBr$ 과 케톤의 반응에 의해, R^{19} 이 $C(CH_3)_2OH$ 인 화학식 (Xb)의 화합물을 얻을 수 있다. 후속 알킬화 및 산화에 의해, R^4 가 CH_2O-C_{1-6} 알킬이고, LG가 SO_2CH_3 인 화학식 (XI)의 화합물을 얻을 수 있다.

[0330] 상술한 조건 하에 R^{19} 이 $C(CH_3)_2OH$ 또는 CH_2OH 인 화학식 (Xb)의 화합물을 또한 실릴 클로라이드 시약, 예컨대 tert-부틸(클로로)다이메틸실란과 반응시킬 수 있다.

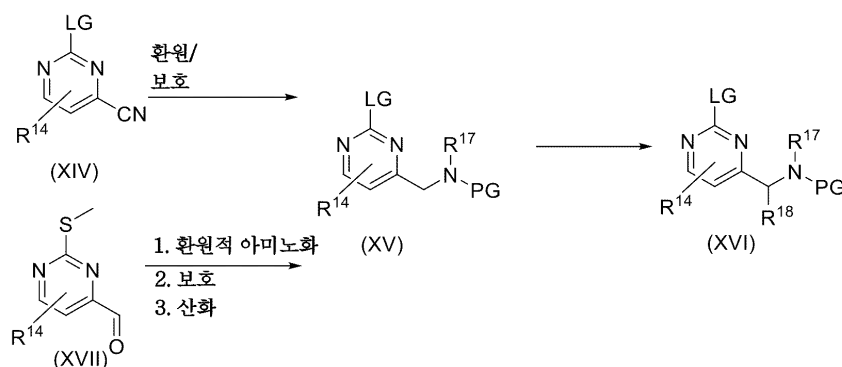
[0331] 반응 도식 C



[0332]

[0333] 반응 도식 C에 따라, 당업자에게 알려진 조건 하에 LG가 Cl이고, R^{14} 이 H, F 또는 CH_3 이며, R^{15} 이 C_{1-6} 알킬 또는 C_{1-6} 퍼할로알킬인 화학식 (XII)의 화합물을 적합한 질소 보호기 (PG), 예컨대 BOC (tert-부틸옥시카르보닐), SEM (2-(트라이메틸실릴)에톡시메틸) 등으로 보호하여, 화학식 (XIII)의 화합물을 얻는다.

[0334] 반응 도식 D



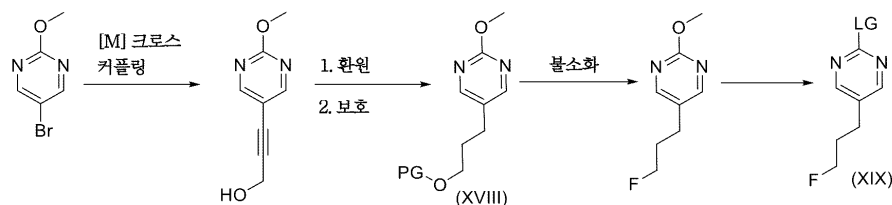
[0335]

[0336] 반응 도식 D에 따라, LG가 Cl이고, R^{14} 이 H인 화학식 (XIV)의 화합물을 환원시키고, 단일 용기 반응(one pot reaction)으로 후속하여 보호하여, PG가 BOC이고, R^{17} 이 H인 화학식 (XV)의 화합물을 얻는다. 예를 들어, 2-클로로피리미딘-4-카보니트릴을 H_2 분위기 하에 적합한 용매, 예컨대 EtOH 등에서 다이-tert-부틸 다이카르보네이트, Pd/C와 반응시켜, tert-부틸 ((2-클로로피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트를 얻는다.

[0337] 또한 화학식 (XV)의 화합물을 화학식 (XVII)의 화합물로부터 3단계로 제조한다. 제1 단계에서, R^{14} 이 H인 화학식 (XVII)의 화합물을 환원적 아미노화 반응에서 12 내지 20시간 동안 용매, 예컨대 THF, DCM 등에서 적합한 아민, 예컨대 메틸 아민, 환원제, 예컨대 $NaBH(OAc)_3$, $NaBH_4$ 등과 반응시킨다. 제2 단계에서, 상술한 조건을 이용하여 알킬 아민을 적합한 질소 보호기, 예컨대 BOC로 보호한다. 제3 단계에서, 상술한 조건을 이용하여 메틸 티오에테르를 산화시켜, LG가 SO_2CH_3 이고, R^{17} 이 CH_3 이며, PG가 BOC인 화학식 (XV)의 화합물을 얻는다.

[0338] 당업자에게 알려진 조건을 이용하여, LG가 Cl이고, PG가 BOC이며, R^{17} 이 H인 화학식 (XV)의 화합물을 알킬화한다. 예를 들어, 용매, 예컨대 THF, DMF 등에서 알킬 할라이드제, 예컨대 MeI 등, 염기, 예컨대 NaH에 의한 알킬화에 의해, R^{18} 이 CH_3 인 화학식 (XVI)의 화합물을 얻는다.

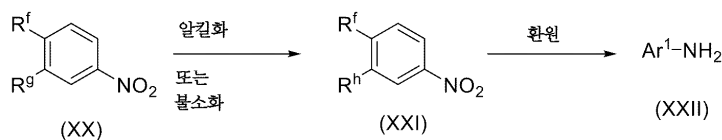
[0339] 반응 도식 E



[0340]

[0341] 반응 도식 E에 따라, 5-브로모-2-메톡시피리미딘을 용매, 예컨대 DMF 등에서 금속 매개 크로스 커플링에서 알킨, 예컨대 프로프-2-인-1-올, 팔라듐 촉매, 예컨대 $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ 등, 염기, 예컨대 트라이메틸아민, CuI과 반응시켜, 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로프-2-인-1-올을 얻는다. 상술한 조건을 이용하여 알킨을 환원시켜, 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로판-1-올을 얻는다. 알코올을 적합한 알킬 알코올 보호기, 예컨대 알킬 토실레이트로 보호한다. 예를 들어, 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로판-1-올을 12 내지 24시간 동안 용매, 예컨대 DCM에서 설포닐 클로라이드, 염기, 예컨대 TEA, 트라이메틸아민 등과 반응시켜, 화학식 (XVIII)의 화합물을 얻는다. TBAF를 이용하여 용매, 예컨대 THF에서의 화학식 (XVIII)의 화합물의 플루오르화에 의해, 5-(3-플루오로프로필)-2-메톡시피리미딘을 얻는다. 5-(3-플루오로프로필)-2-메톡시피리미딘으로부터 화학식 (XIX)의 화합물을 2 단계로 제조한다. 제1 단계에서, 100℃의 온도에서 4 내지 6시간 동안 메틸 에테르를 HCl/다이옥산을 사용하여 탈메틸화한다. 염소화 조건 하에, 예를 들어 70 내지 90℃ 범위의 온도에서 POCl_3 등과 반응시켜 5-(3-플루오로프로필)피리미딘-2(1H)-온을 염소화하여, LG가 Cl인 화학식 (XIX)의 화합물을 얻는다.

[0342] 반응 도식 F



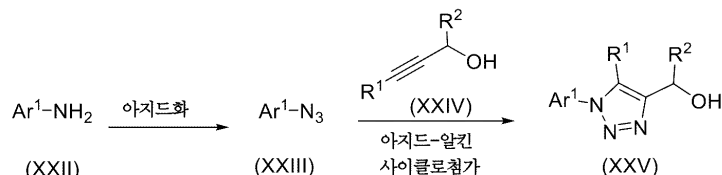
[0343]

[0344] 반응 도식 F에 따라, Ar^1 이 치환된 페닐 고리인 화학식 (XXII)의 화합물은 시판용이거나 화학식 (XX)(여기서, R^f 및 R^g 는 H, OH, 할로, $\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-3}$ 알킬, CHO, C_{1-3} 알킬, OC_{1-3} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬 및 OC_{1-6} 퍼할로알킬로부터 선택됨)의 화합물로부터의 합성에 의해 입수가능하다. R^f 가 상기 정의한 바와 같고, R^g 가 OH인 화학식 (XX)의 화합물을 실온 내지 120℃ 범위의 온도 또는 통상적인 가열에서, 2 내지 5시간 동안 염기, 예컨대 K_2CO_3 , Cs_2CO_3 , NaH 등의 존재 하에 적합한 용매, 예컨대 DMF, 물 또는 이들의 혼합물에서, 시약, 예컨대 클로로다이플루오로아세트아이드, MeI 등으로 알킬화하여, R^f 가 상기 정의한 바와 같고, R^g 가 OC_{1-6} 알킬 또는 OC_{1-6} 퍼할로알킬인 화학식 (XXI)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, R^f 가 Cl이고, R^g 가 OH인 화학식 (XX)의 화합물을 100℃에서 2.5시간 동안 염기, 예컨대 K_2CO_3 의 존재 하에, 적합한 용매, 예컨대 DMF, 물 또는 이들의 혼합물에서 클로로다이플루오로아세트아이드로 알킬화하여, R^f 가 Cl이고, R^h 가 OCF_2H 인 화학식 (XXI)의 화합물을 얻는다. R^f 가 상기 정의한 바와 같고, R^g 가 CHO인 화학식 (XX)의 화합물을 -78℃ 내지 50℃ 범위의 온도에서 2 내지 24시간 동안 적합한 용매, 예컨대 DCM 등에서 플루오르화제, 예컨대, DAST, 엑스트라플루오르®, 데옥소-플루오르® 등으로 플루오르화한다. 바람직한 방법에서, R^f 가 Cl이고, R^g 가 CHO인 화학식 (XX)의 화합물을 실온에서 20시간 동안 적합한 용매, 예컨대 DCM에서 플루오르화제, 예컨대 DAST와 반응시켜, R^f 가 Cl이고, R^h 가 CF_2H 인 화학식 (XXI)의 화합물을 얻는다.

[0345] 당업자에게 알려진 조건을 이용하여 화학식 (XXI)의 니트로 화합물을 환원시켜, Ar^1 이 화학식 (I)에 정의된 바와 같은 치환된 페닐 고리인 화학식 (XXII)의 화합물을 얻는다. R^f 및 R^g 가 H, 할로, $\text{C}(\text{O})\text{C}_{1-4}$ 알킬, C_{1-4} 알킬, OC_{1-4} 알킬, C_{1-6} 퍼할로알킬 또는 OC_{1-6} 퍼할로알킬로부터 선택되는 화학식 (XX)의 니트로 화합물을 실온 (23℃) 내지 약 50℃ 범위의 온도에서 30분 내지 16시간 동안 적합한 용매, 예컨대 MeOH, EtOH, THF, 아세톤 등에서 H_2

분위기 (벌룬(balloon)) 하에 Pd/C; HCl 용액 중의 Fe 분말; NH₄Cl 수용액 중의 Zn 분말과 같은, 그러나 이에 제한되지 않는 환원제로 환원시켜 화학식 (XXII)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, R^f가 Cl이고, R^h가 OCF₂H인 화학식 (XXI)의 니트로 화합물을 실온에서 약 2시간 동안 용매, 예컨대 MeOH에서 Fe 분말, 진한 HCl로 환원시킨다. 바람직한 방법에서, R^f가 Cl이고, R^h가 CF₂H인 화학식 (XXI)의 니트로 화합물을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 16시간 동안 적합한 용매, 예컨대 아세톤/물에서 Zn 분말, NH₄Cl로 환원시킨다.

[0346] 반응 도식 G



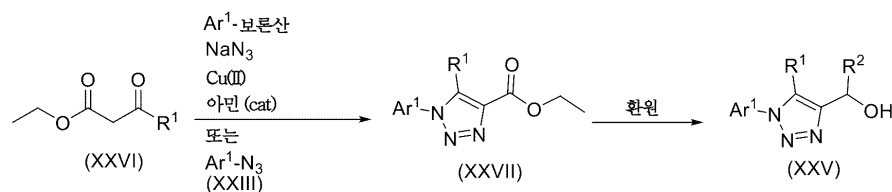
[0347]

[0348] 반응 도식 G에 따라, 당업자에 알려진 아지드화(azidation) 조건을 이용하여 화학식 (XXIII)의 아지드 화합물을 화학식 (XXII)의 화합물로부터 제조한다. 바람직한 방법에서, Ar¹이 적절히 치환된 페닐 또는 피리딜인 화학식 (XXII)의 화합물을 적합한 용매, 예컨대 *i*PrOH, THF 등에서 *i*PrOH 중의 6 N HCl로 처리하고, 산성 조건 (예컨대, H₂SO₄, HCl, TFA 등) 하에 유동 하에 또는 당업자에 알려진 통상적인 방법으로 적합한 용매, 예컨대 수 중의 아질산나트륨 및 적합한 용매, 예컨대 수중의 아지드화나트륨과 각각 반응시켜, 화학식 (XXIII)의 아지드 화합물을 얻는다. 대안적으로, 화학식 (XXIII)의 알릴 아지드를 당업자에게 알려진 조건, 예를 들어 유기 붕소 화합물의 구리(II)-촉매 전환; 실온에서 수중의 아렌다리아조늄 토실레이트 및 아지드화나트륨; 아지드화나트륨 및 할로젠화 알릴을 사용하는 S_NAr 반응을 이용하여 제조할 수 있다. Ar¹이 적절히 치환된 티오펜인 화학식 (XXIII)의 화합물을 상기 기재된 방법에 따라 제조할 수 있다.

[0349] R¹이 H이고, R²가 H 또는 CH₃이며, Ar¹이 적절히 치환된 페닐 또는 피리딜인 화학식 (XXV)의 화합물을 실온 내지 100℃ 범위의 온도에서 30분 내지 24시간 동안 환원제, 예컨대 L-아스코르브산나트륨 등이 있거나 없이, 금속 촉매, 예컨대 황산구리, (CuOTf)₂·C₆H₆, RuCp*Cl(PPh₃)₂ 등의 존재 하에, 용매, 예컨대 H₂O, *t*BuOH, 아이소프로판올, 다이옥산, 톨루엔 또는 이들의 혼합물에서 화학식 (XXIII)의 화합물과 화학식 (XXIV)의 알킨의 금속-촉매 아지드-알킨 1,3-쌍극성 사이클로 첨가 반응(dipolar cycloaddition)을 통해 얻는다. 바람직한 방법에서, R¹이 H이고, R²가 H 또는 CH₃인 화학식 (XXIV)의 알킨을 *t*BuOH /H₂O에서 실온에서 하룻밤 동안 화학식 (XXIII)의 아지드 화합물, 황산구리, L-아스코르브산나트륨과 반응시킨다. 대체 방법에서, 알킨은 *N*-프로파르길 프탈이미드이다.

[0350] Ar₁이 적절히 치환된 페닐 또는 피리딜인 화학식 (XXV)의 화합물을 문헌[B. Chattopadhyay *et al. Org. Lett.* 2010, 12, 2166-2169]에 기재된 바와 같이 제조할 수 있다. 아지드-알킨 사이클로 첨가가 문헌[H. Kolb *et al. Angew. Chem. Int. Ed.* 2001, 40, 2004-2021]에 기재된 방법에 의해 달성됨을 당업자는 인식할 것이다.

[0351] 반응 도식 H



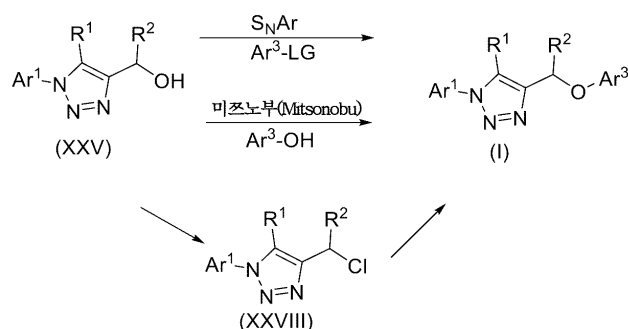
[0352]

[0353] 반응 도식 H에 따라, R¹이 CH₃, CF₂H 또는 CF₃인 화학식 (XXVI)의 화합물을 실온 내지 80℃ 범위의 온도에서 2 내지 24시간 동안 용매, 예컨대 DMSO, THF, DMF 및 물에서 Ar¹이 적절히 치환된 페닐 고리인 Ar¹-보론산, NaN₃,

전이 금속 촉매, 예컨대 $\text{Cu}(\text{OAc})_2$, Cu_2O , CuBr 또는 Cu 분말, 염기, 예컨대 피페리딘, 트라이메틸아민, K_2CO_3 등과 반응시켜, 화학식 (XXVII)의 화합물을 얻는다. 대안적으로, 화학식 (XXVI)의 화합물의 상술한 전환에서 화학식 (XXVII)의 화합물로의 NaI 의 첨가에 의해, R^1 이 I인 화학식 (XXV)의 화합물을 얻는다.

[0354] R^1 이 CH_3 , CF_2H 또는 CF_3 인 화학식 (XXVI)의 화합물을 용매, 예컨대 DMSO에서 Ar^1 이 적절히 치환된 페닐 고리인 화학식 (XXIII)의 $\text{Ar}^1\text{-N}_3$, 아민 촉매, 예컨대 다이에틸아민, 피페리딘, 프롤린, 트라이에틸아민 등과 반응시켜, 화학식 (XXVII)의 화합물을 얻는다. 화학식 (XXVII)의 화합물을 용매, 예컨대 THF 등에서 환원제, 예컨대 LiAlH_4 , LiBH_4 등으로 환원시켜, R^1 이 H 또는 CH_3 이고, R^2 가 H인 화학식 (XXV)의 화합물을 얻는다.

[0355] 반응 도식 I



[0356]

[0357] 반응 도식 I를 참조하면, Ar^3 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 이 H이며, R^2 가 H 또는 CH_3 인 화학식 (I)의 화합물을 $\text{S}_{\text{N}}\text{Ar}$, $\text{S}_{\text{N}}2$ 또는 미쯔노부(Mitsunobu) 반응에 의해 화학식 (XXV)의 화합물로부터 얻는다. 예를 들어, 통상적인 가열 또는 마이크로파 가열을 이용하여 실온 (약 23°C) 내지 약 140°C 범위의 온도에서 염기, 예컨대 NaH , K_2CO_3 , Cs_2CO_3 등의 존재 하에 용매, 예컨대 DMF, THF, ACN 등에서, Ar^3 가 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 헤테로방향족 5원 또는 6원 고리이고, LG가 적합한 이탈기, 예컨대 F, Cl, Br, I, SO_2Me 또는 OTf인 LG-Ar^3 와의 $\text{S}_{\text{N}}\text{Ar}$ 반응에 의해 화학식 (XXV)의 화합물로부터 화학식 (I)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 염기는 NaH 이고, 용매는 DMF이며, 반응은 실온에서 수행된다.

[0358] Ar^3 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 이 H이며, R^2 가 H 또는 CH_3 인 화학식 (I)의 화합물을, $\text{Ar}^3\text{-OH}$ 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진으로부터 선택되는 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 헤테로방향족 5원 또는 6원 고리인 $\text{Ar}^3\text{-OH}$ 의 화합물과의 미쯔노부 반응에 의해 화학식 (XXV)의 화합물로부터 또한 얻는다. 예를 들어, R^1 이 H이고, R^2 가 H 또는 CH_3 인 화학식 (XXV)의 화합물을 실온 (약 23°C) 내지 약 50°C 범위의 온도에서 적합한 용매, 예컨대 THF, DMF 등에서 Ar^3 가 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 헤테로방향족 5원 또는 6원 고리인 $\text{Ar}^3\text{-OH}$, PPh_3 등, 염기, 예컨대 DEAD, DCAD, DIAD, DBAD 등과 반응시켜, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 화학식 (XXV)의 화합물을 실온에서 THF에서 $\text{Ar}^3\text{-OH}$, PPh_3 , DBAD와 반응시켜, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0359] Ar^3 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 이 H이며, R^2 가 H 또는 CH_3 인 화학식 (I)의 화합물을 또한 $\text{S}_{\text{N}}2$ 반응에 의해 화학식 (XXV)의 화합물로부터 2단계로 얻는다. 제1 단계에서, 화학식 (XXVIII)의 클로로 화합물을 당업자에 알려진 염소화 조건, 예컨대 염화티오닐을 이용하여, 실온 내지 약 50°C 범위의 온도에서 30분 내지 6시간 동안 적합한 용매, 예컨대 DCM, CHCl_3 등에서 화학식 (XXV)의 화합물로부터 제조한다. 제2 단계에서, 화학식 (XXVIII)의 클로로 화합물을 $\text{S}_{\text{N}}2$ 반응에서 친핵체, 예컨대 $\text{Ar}^3\text{-OH}$ 와 반응

시켜 화학식 (I)의 화합물을 제조한다. 예를 들어, 화학식 (XXVIII)의 클로로 화합물을 실온 (약 23℃) 내지 약 50℃ 범위의 온도에서 염기, 예컨대 NaH, K₂CO₃ 등의 존재 하에 용매, 예컨대 DMF에서 Ar³-OH가 적합한 시판 용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 하이드록시-치환된 헤테로아릴 화합물인 화학식 Ar³-OH의 친핵체와 반응시켜, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 염기는 K₂CO₃이고, 용매는 DMF이며, 반응은 실온에서 수행된다.

[0360] Ar³가 Br로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 금속 매개 크로스 커플링 반응에서 반응시켜, Ar³가 xx인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다. 예를 들어, Ar³가 Br 또는 Cl로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 마이크로파 가열 또는 통상적인 가열을 이용하여 60 내지 180℃ 범위의 온도에서 약 30분 내지 16시간 동안 팔라듐 촉매, 예컨대 XPhos Palladacycle Gen. 3, PdCl₂(dtbpf), Pd(PPh₃)₄, PdCl₂(dppf), Pd(PPh₃)₂Cl₂ 등, 염기, 예컨대 K₃PO₄, 수성 Na₂CO₃, Na₂CO₃, Cs₂CO₃ 등의 존재 하에 적합한 용매, 예컨대 1,2-다이메톡시에탄, 1,4-다이옥산, THF, DMF, 물 또는 이들의 혼합물에서 적절히 치환된 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 아릴 또는 헤테로아릴 보론산, 보로네이트 에스테르, 트라이메틸보록신 등과 반응시켜, 1-메틸피라졸-3-일, 1H-피라졸-4-일 등인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0361] 유사한 방식으로, Ar¹이 적합한 할로젠, 예컨대 Br로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 약 50℃의 온도에서 12 내지 24시간 동안 적합한 용매, 예컨대 THF에서 금속 매개 크로스 커플링 반응에서 알킬아렌 할라이드, 사이클로알킬아렌 할라이드, 예컨대 사이클로부틸아렌 브로마이드, 2-프로필아렌 브로마이드 등, 팔라듐 촉매, 예컨대 Pd(t-Bu₃P)₂ 등과 반응시켜, Ar¹이 C₁₋₆알킬 또는 C₃₋₆사이클로알킬로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0362] 유사한 방식으로, Ar¹이 적합한 할로젠, 예컨대 Br로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 약 100℃의 온도에서 12 내지 24시간 동안 금속 매개 크로스 커플링 반응에서 팔라듐 촉매, 예컨대 RuPhos-Pd-G3 등의 존재 하에 적합한 용매, 예컨대 1,4-다이옥산에서 적합한 염기, 예컨대 K₂CO₃, 제3인산칼륨 등과 함께 적절히 치환된 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 보론산, 삼플루오르화붕산칼륨, 트라이메틸보록신 등과 반응시켜, Ar¹이 C₁₋₆알킬 또는 C₃₋₆사이클로알킬로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

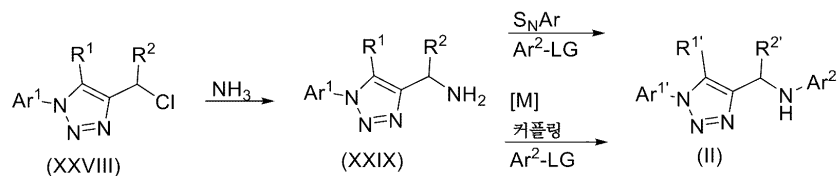
[0363] Ar¹이 적합한 할로젠 이탈기, 예컨대 F로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 50 내지 100℃ 범위의 온도에서 12 내지 24시간 동안 적합한 용매, 예컨대 ACN 등에서 4원 내지 6원 헤테로사이클로알킬, 예컨대 아제티딘, 피롤리딘, 피페리딘 또는 모르폴린, 염기, 예컨대 DIPEA 등과 반응시켜, Ar¹이 4원 내지 6원 헤테로사이클로알킬로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0364] Ar¹이 에스테르로 치환되는 화학식 (I)의 화합물을 마이크로파 반응기에서 약 140℃의 온도에서 2시간 동안 적합한 용매, 예컨대 ACN 등에서 염기, 예컨대 Cs₂CO₃ 등을 사용하여 카르복실산으로 비누화한 다음, 카르복실산을 당업자에게 알려진 조건 하에 아마이드로 전환하여, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0365] Ar³가 Cl로 치환된 피라진인 화학식 (I)의 화합물을 90 내지 110℃ 범위의 온도에서 2 내지 4시간 동안 용매, 예컨대 DMSO 등에서 CsF를 사용하여 Ar³가 F로 치환되는 화학식 (I)의 화합물로 전환한다.

[0366] Ar³가 Cl로 치환된 피리미딘인 화학식 (I)의 화합물을 약 100℃의 온도에서 마이크로파 조사 하에 8시간 동안 용매, 예컨대 THF에서 MeOH 중의 암모니아 용액을 사용하여 Ar³가 NH₂로 치환되는 화학식 (I)의 화합물로 전환한다.

[0367] 반응 도식 J



[0368]

[0369] 반응 도식 J를 참조하면, Ar^2 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피라졸, 옥사졸, 이미다졸, 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 및 R^2 가 H인 화학식 (II)의 화합물을 S_NAr , S_N2 또는 금속 매개 크로스-커플링 반응에 의해 화학식 (XXVIII)의 화합물로부터 얻는다.

[0370]

Ar^2 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 및 R^2 가 H인 화학식 (II)의 화합물을 화학식 (XXVIII)의 화합물로부터 2단계로 얻는다. 제1 단계에서, 화학식 (XXVIII)의 화합물에서 염소를 메탄올 중 암모니아 용액과 같은 아민으로 친핵성 치환하면, 화학식 (XXIX)의 대응하는 일차 아민 화합물을 얻는다. 대안적으로, 화학식 (XXVIII)의 화합물에서 염소를 프탈이미드로 친핵성 치환한 후, 하이드라진 수화물을 사용하여 탈보호하여, 화학식 (XXIX)의 대응하는 일차 아민 화합물을 얻는다. 제2 단계에서, 화학식 (XXIX)의 화합물을, 통상적인 가열 또는 마이크로파 가열을 이용하여 실온 (약 23°C) 내지 약 200°C 범위의 온도에서 염기, 예컨대 NaH, Et_3N , K_2CO_3 등의 존재 하에 용매, 예컨대 EtOH 등에서 Ar^2 가 시판용이거나 합성에 의해 입수가능한 헤테로방향족 5원 또는 6원 고리이고, LG가 적합한 이탈기, 예컨대 F, Cl, Br, I 또는 OTf인 Ar^2-LG 와 S_NAr 반응으로 반응시킨다. 바람직한 방법에서, 염기는 Et_3N 이고, 용매는 EtOH이며, 반응은 120°C에서 2시간 동안 마이크로파 반응기에서, 이어서 150°C에서 10분 동안 가열되었다.

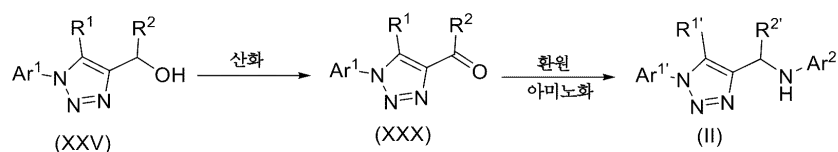
[0371]

Ar^2 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 이미다졸, 피라졸, 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 및 R^2 가 H인 화학식 (II)의 화합물을 실온 (약 23°C) 내지 약 110°C 범위의 온도에서 팔라듐 촉매, 예컨대 $Pd_2(dba)_3$, $Pd(OAc)_2$ 등, 포스핀 리간드, 예컨대 XPhos, $tBuBrettPhos$ 등, 염기, 예컨대 $KOtBu$, LHMS 등의 존재 하에 적합한 용매, 예컨대 톨루엔, DME, $tBuOH$ 및 DMF에서 Ar^2 가 시판용이거나 합성에 의해 입수가능한 헤테로방향족 5원 또는 6원 고리이고, LG가 적합한 이탈기, 예컨대 F, Cl, Br, I 또는 OTf인 Ar^2-LG 와의 금속 매개 크로스-커플링 반응에 의해 화학식 (XXIX)의 화합물로부터 또한 얻는다. 바람직한 방법에서, 팔라듐 촉매는 $Pd_2(dba)_3$ 이고, 리간드는 $tBuXPhos$ 이며, 염기는 $KOtBu$ 이고, 용매는 $tBuOH$ 이다.

[0372]

Ar^2 가 1개 또는 2개의 치환기로 치환되는 피라졸, 피리미딘, 피리딘 또는 피리다진이고, R^1 및 R^2 가 H인 화학식 (II)의 화합물을 화학식 Ar^2-NH_2 의 화합물과의 S_N2 반응에서 화학식 (XXVIII)의 화합물로부터 얻는다. 예를 들어, 화학식 (XXVIII)의 클로로 화합물을 실온 (약 23°C) 내지 약 100°C 범위의 온도에서 약 3시간 내지 16시간 동안 염기, 예컨대 NaH, K_2CO_3 , TEA 등의 존재 하에 용매, 예컨대 DMF, EtOH, ACN 등에서, Ar^2-NH_2 가 적합한 시판용이거나 합성에 의해 입수가능한 아미노-치환된 헤테로아릴 화합물인 화학식 Ar^2-NH_2 의 화합물과 반응시켜, 화학식 (II)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 염기는 K_2CO_3 이고, 용매는 DMF이며, 반응은 80°C로 가열된다.

[0373] 반응 도식 K



[0374]

- [0375] 반응 도식 K를 참조하면, Ar^2 가 피리딘, 옥사졸, 피라졸이며, R^1 및 R^2 가 H인 화학식 (II)의 화합물을 화학식 (XXV)의 화합물로부터 2단계로 얻는다. 제1 단계에서, 화학식 (XXV)의 화합물을 약 $-78^{\circ}C$ 내지 실온 (약 $23^{\circ}C$) 범위의 온도에서 용매, 예컨대 EtOAc, DMSO, DCM 등에서 당업자에게 알려진 산화 조건, 예를 들어 DMP (데스-마틴 페리오디난(Dess-Martin periodinane)), SO_3 -피리딘, 스웜(Swern) 조건 [$(COCl)_2$, DMSO, Et_3N], PCC 등을 이용하여, 화학식 (XXX)의 알데하이드로 산화시킨다. 바람직한 방법에서, 화학식 (XXV)의 화합물을 $20^{\circ}C$ 에서 4시간 동안 DCM에서 데스-마틴 페리오디난을 사용하여 화학식 (XXX)의 화합물로 산화시킨다. 제2 단계에서, 화학식 (XXX)의 카르보닐 화합물을 실온 (약 $23^{\circ}C$) 내지 약 $50^{\circ}C$ 범위의 온도에서 8 내지 24시간 동안 용매, 예컨대 MeOH, DCM 등에서, Ar^2-NH_2 가 적합한 시판용이거나 합성에 의해 입수가능한 아미노-치환된 헤테로아릴 화합물인 화학식 Ar^2-NH_2 의 화합물, 적합한 환원제, 예컨대 $NaBH_4$, $NaBH(OAc)_3$, $NaBH_3CN$ 등과 환원적 아미노화 반응에서 반응시켜, 화학식 (II)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 환원제는 $NaBH(OAc)_3$ 이고, 용매는 DCM이다.
- [0376] 화학식 (I) (및 화학식 (II))의 화합물은 당업자에게 알려진 방법을 사용하여 이의 대응하는 염으로 전환될 수 있다. 예를 들어, 화학식 (I) (및 화학식 (II))의 아민을 용매, 예컨대 Et_2O , CH_2Cl_2 , THF, CH_3OH , 클로로포름 또는 아이소프로판올 중에서 트라이플루오로아세트산, HCl 또는 시트르산으로 처리하여, 대응하는 염 형태를 얻는다. 대안적으로, 트라이플루오로아세트산 또는 포름산 염은 역상 HPLC 정제 조건의 결과로서 얻어진다. 화학식 (I) (및 화학식 (II))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 결정 형태는 극성 용매 (극성 용매의 혼합물 및 극성 용매의 수성 혼합물을 포함) 또는 비극성 용매 (비극성 용매의 혼합물을 포함)로 재결정하여, 결정 형태로 얻어질 수 있다.
- [0377] 본 발명에 따른 화합물이 적어도 하나의 키랄 중심을 갖는 경우, 이는 그에 따라 거울상 이성질체로서 존재할 수 있다. 화합물이 2개 이상의 키랄 중심을 갖는 경우에, 이는 추가로 부분입체 이성질체로서 존재할 수 있다. 모든 이러한 이성질체 및 이들의 혼합물이 본 발명의 범위 내에 포함되는 것으로 이해되어야 한다.
- [0378] 상술한 반응 도식에 따라 제조된 화합물은 형태 특이적 합성 또는 분해에 의해 단일 거울상 이성질체와 같은 단일 형태로서 얻어질 수 있다. 상기 반응 도식에 따라 제조된 화합물은 교대로 다양한 형태의 혼합물, 예컨대 라세미(1:1) 또는 비라세미(1:1이 아님) 혼합물로서 얻어질 수 있다. 거울상 이성질체의 라세미 및 비라세미 혼합물이 얻어지는 경우, 단일 거울상 이성질체는 당업자에게 공지된 통상적인 분리 방법, 예를 들어 키랄 크로마토그래피, 재결정, 부분입체 이성질체 염 형성, 부분입체 이성질체 부가물로의 유도체화, 생체내 변환(biotransformation) 또는 효소 변환을 이용하여 분리될 수 있다. 위치 이성질체 또는 부분입체 이성질체 혼합물이 얻어지는 경우, 적용 가능한 경우, 단일 이성질체는 통상적인 방법, 예를 들어 크로마토그래피 또는 결정화를 이용하여 분리될 수 있다.
- [0379] 하기 구체적인 실시예는 본 발명 및 다양한 바람직한 실시 형태를 더욱 더 설명하기 위해 제공된다.
- [0380] 실시예
- [0381] 하기 실시예에 기재된 화합물 및 대응하는 분석 데이터를 얻는데 있어서, 달리 지시하지 않는 한, 하기 실험 및 분석 프로토콜을 따랐다.
- [0382] 달리 언급하지 않는 한, 반응 혼합물을 질소 분위기하에 실온 (rt)에서 자석 교반하였다. 용액을 "건조시키는" 경우에는, 이를 일반적으로 건조제, 예컨대 Na_2SO_4 또는 $MgSO_4$ 로 건조시켰다. 혼합물, 용액 및 추출물을 "농축시키는" 경우에는, 이를 전형적으로 감압 하에 회전 증발기에서 농축시켰다. 마이크로파 조사 조건 하에서의 반응을 바이오티지 이니시에이터 (Biotage Initiator) 또는 CEM (마이크로웨이브 리액터 (Microwave Reactor)) 디스커버 인스트루먼트 (Discover instrument)에서 행하였다.
- [0383] 연속류 (continuous flow) 조건 하에 행해진 반응의 경우, "LTF-VS 혼합기를 통해 흐른다"는 것은 달리 지시하지 않는 한, 1/16" PTFE 튜빙을 통해 LTF-VS 혼합기 (Little Things Factory GmbH (<http://www.ltf-gmbh.com>))로 일렬로 늘어선 케믹스 퓨전 100 터치 시린지 펌프(Chemyx Fusion 100 Touch Syringe Pump)의 사용을 말한다.
- [0384] 순상 실리카 겔 크로마토그래피 (FCC)를 미리 충전된 카트리지를 사용하여 실리카 겔 (SiO_2) 상에서 행하였다.
- [0385] 분취용 역상 고성능 액체 크로마토그래피 (RP HPLC)를 다음 중 하나에서 행하였다:

[0386] 방법 A. 엑스테라(Xterra) 분취용(Prep) RP18 컬럼 (5 μ m, 30 $\times$ 100 또는 50 $\times$ 150 mm) 또는 엑스브리지 (XBridge) C18 OBD 컬럼 (5 μ m, 30 $\times$ 100 또는 50 $\times$ 150 mm), 20 mM NH₄OH 중의 5% ACN에서 2분간 유지, 그 다음에 15분간에 걸친 5 내지 99% ACN의 그라디언트(gradient), 그 후에 99% ACN에서 5분간 유지의 이동상, 및 40 또는 80 mL/min의 유량을 사용한 애질런트(Agilent) HPLC;

[0387] 또는

[0388] 방법 B. 이너트실 (Inertsil) ODS-3 컬럼 (3 μ m, 30 $\times$ 100 mm, T = 45°C), H₂O 중의 5% ACN (모두 0.05% TFA 함유)에서 1분간 유지, 그 다음에 6분간에 걸친 5 내지 99% ACN의 그라디언트, 그 후에 99% ACN에서 3분간 유지의 이동상, 및 80 mL/min의 유량을 사용한 시마즈 (Shimadzu) LC-8A 시리즈 HPLC;

[0389] 또는

[0390] 방법 C. 엑스브리지 C18 OBD 컬럼 (5 μ m, 50 $\times$ 100 mm), H₂O 중의 5% ACN (모두 0.05% TFA 함유)에서 1분간 유지, 그 다음에 14분간에 걸친 5 내지 99% ACN의 그라디언트, 그 후에 99% ACN에서 10분간 유지의 이동상, 및 80 mL/min의 유량을 사용한 시마즈 LC-8A 시리즈 HPLC;

[0391] 또는

[0392] 방법 D. 엑스브리지 C18 컬럼 (5 μ m, 100 $\times$ 50 mm), 80 mL/min의 유량에서의 10분간에 걸친 20 mM NH₄OH 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 2분간 유지의 이동상을 사용한 길슨(Gilson) HPLC;

[0393] 또는

[0394] 방법 E. 선포이어(Sunfire) C18 OBD 컬럼 15 (5 μ m, 50 $\times$ 100 mm), H₂O 중의 5% ACN (모두 0.05% TFA 함유)에서 1분간 유지, 그 다음에 14분간에 걸친 5 내지 99% ACN의 그라디언트, 그 후에 99% ACN에서 10분간 유지의 이동상, 및 80 mL/min의 유량을 사용한 시마즈 LC-8A 시리즈 HPLC.

[0395] 분취용 초임계 유체 고성능 액체 크로마토그래피 (SFC)를 자스코 (Jasco) 분취용 SFC 시스템, APS 1010 시스템 (베르거 인스트루먼트 (Berger instruments) 사제) 또는 SFC-PICLAB-PREP 200 (프랑스 아비뇽 소재의 픽 솔루션 (PIC SOLUTION)) 중 하나에서 행하였다. 분리를 40 내지 60 mL/min 범위의 유량으로 100 내지 150 바에서 행하였다. 컬럼을 35 내지 40°C로 가열하였다.

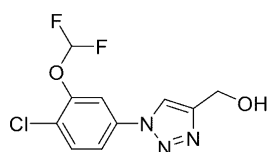
[0396] 질량 스펙트럼 (MS)은 달리 지시되지 않으면, 포지티브 모드에서 전기분무 이온화 (ESI)를 사용하여 애질런트 시리즈 1100 MSD 상에서 획득하였다. 계산된(calcd.) 질량은 정확한 질량에 해당한다.

[0397] 핵 자기 공명(NMR) 스펙트럼은 브루커(Bruker) 모델 DRX 분광계 상에서 획득하였다. 다중도에 대한 정의는 다음과 같다: s = 단일선, d = 이중선, t = 삼중선, q = 사중선, m = 다중선, br = 브로드. 교환성 프로톤을 포함하는 화합물의 경우, 상기 프로톤은 NMR 스펙트럼을 실행하는데 사용되는 용매의 선택 및 용액 중의 화합물의 농도에 따라 NMR 스펙트럼 상에서 가시적일 수도 비가시적일 수도 있음을 이해할 것이다.

[0398] 화학명은 켐드로우 울트라(ChemDraw Ultra) 12.0, 켐드로우 울트라 14.0 (미국 매사추세츠주 캠브리지 소재의 캠브리지소프트 코퍼레이션(CambridgeSoft Corp.)) 또는 ACD/네임(Name) 버전 10.01 (어드밴스트 케미스트리 (Advanced Chemistry))을 이용하여 생성하였다.

[0399] R* 또는 S*로 나타낸 화합물은 절대 배열이 결정되지 않은 순수한 거울상 이성질체 화합물이다.

[0400] 중간체 1. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올



[0401]

[0402] 단계 A. 1-클로로-2-(다이플루오로메톡시)-4-니트로벤젠, DMF (192 mL) 및 H₂O (25 mL) 중의 2-클로로-5-니트로페놀 (10 g, 58 mmol), K₂CO₃ (9.4 g, 68 mmol) 및 나트륨 클로로다이플루오로아세테이트 (18 g, 115 mmol)의 혼합물을 5분 동안 질소로 탈기한 다음, 반응 혼합물을 2.5시간 동안 100°C로 가열하였다. 혼합물을 실온으로

냉각시켜, 12 N HCl (17 mL) 및 H₂O (25 mL)를 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 이어서, 생성된 혼합물을 0°C로 냉각시키고, 1 N NaOH 수용액 (213 mL)을 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 H₂O로 희석하여, Et₂O (2X)로 추출하였다. 유기 층을 H₂O (1X)로 추가로 세정하여, 건조시키고 (Na₂SO₄), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 50% DCM)에 의해, 표제 화합물 (12 g, 55 mmol, 95% 수율)을 얻었다. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.15 - 8.12 (m, 1H), 8.08 (dd, *J* = 8.8, 2.5 Hz, 1H), 7.65 (d, *J* = 8.8 Hz, 1H), 6.65 (t, *J* = 71.9 Hz, 1H).

[0403]

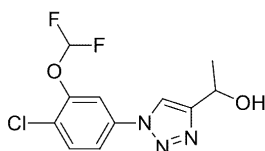
단계 B. 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)아닐린. 메탄올 (72 mL) 중의 1-클로로-2-(다이플루오로메톡시)-4-니트로벤젠 (5 g, 22 mmol)의 용액에 Fe 분말 (5 g, 89 mmol)을 첨가한 후에, 진한 HCl (H₂O 중 37%, 19 mL)를 적가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 반응을 빙수로 쿨링하고, 고체 NaHCO₃로 염기성화하였다. 셀라이트®를 조반응 혼합물에 첨가하고, 10분 교반하였다. 불균일 혼합물을 셀라이트® 패드를 통해 여과하고, 여과액을 감압 하에 농축시켜, MeOH를 제거하였다. 생성되는 수층을 DCM (3X)으로 추출하였다. 합한 유기물을 감압 하에 농축하여, 연한 주황색 오일로서의 표제 화합물 (3.3 g)을 얻어, 추가의 정제 없이 사용하였다. MS (ESI) C₇H₆ClF₂NO에 대한 질량 계산치, 193.0; *m/z* 실측치 194.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 7.16 (d, *J* = 8.6 Hz, 1H), 6.68 - 6.28 (m, 3H), 3.77 (s, 2H).

[0404]

단계 C. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 6N HCl (iPrOH 중의 6N HCl, 8 mL) 및 iPrOH (19 mL) 중의 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)아닐린 (2.5 g, 13 mmol) 및 H₂O (12 mL) 중의 아질산나트륨 (1 g, 15 mmol) 두 용액을 각각 1 mL/min 및 0.4 mL/min으로 LTF-MS 혼합기(0.2 mL)를 통해 유동시켰다. 결과물을 H₂O (12 mL) 중의 아지드화나트륨 (1 g, 15 mmol)과 T-피스(piece)에서 0.4 mL/min으로 혼합하고, LTF-VS 혼합기 (1 mL)를 통해 유동시켰다. 혼합물을 iPrOH (32 mL) 중의 K₂CO₃ (8.9 g, 65 mmol)로 수집하였다. 반응 혼합물을 완료 후 10분 동안 교반한 다음, 프로파르길 알코올 (0.9 mL, 15 mmol), CuSO₄ · 5H₂O (322 mg, 1.29 mmol) 및 L-아스코르브산나트륨 (256 mg, 1.29 mmol)을 조반응물에 첨가하였다. 불균일 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 EtOAc, H₂O 및 NH₄Cl의 포화 수용액으로 희석하였다. 2상 혼합물을 5분 동안 교반한 다음, 층을 분리하고, 수층을 추가로 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (Na₂SO₄), 여과하고, 감압 하에 농축시켜, 어두운 주황색 고체를 얻었다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 40 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (2.9 g, 10 mmol, 80% 수율)을 얻었다. MS (ESI) C₁₀H₆ClF₂N₃O₂에 대한 질량 계산치, 275.0; *m/z* 실측치 276.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.04 - 7.94 (m, 1H), 7.74 - 7.67 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.64 (t, *J* = 72.5 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H).

[0405]

중간체 2. R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올.



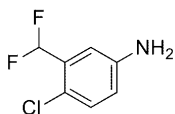
[0406]

[0407]

단계 A. 4-아지도-1-클로로-2-(다이플루오로메톡시)벤젠. 6N HCl (iPrOH 중의 6N HCl, 2.6 mL) 및 iPrOH (6.4 mL) 중의 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)아닐린 (중간체 1, 단계 B의 생성물, 0.8 g, 4.1 mmol) 및 H₂O (12 mL) 중의 아질산나트륨 (342 mg, 4.96 mmol) 두 용액을 각각 1 mL/min 및 0.4 mL/min으로 LTF-MS 혼합기 (0.2 mL)를 통해 유동시켰다. 결과물을 H₂O (4 mL) 중의 아지드화나트륨 (322 mg, 4.96 mmol)과 T-피스에서 0.4 mL/min으로 혼합하고, LTF-VS 혼합기 (1 mL)를 통해 유동시켰다. 혼합물을 H₂O (10 mL) 중의 K₂CO₃ (2.9 g, 21 mmol)로 수집하였다. 반응 혼합물을 완료 후 10분 동안 교반하였다. 조반응 혼합물을 Et₂O (3X)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (Na₂SO₄), 여과하고, 어두운 주황색 오일로 농축시켰다. 표제 화합물을 추가의 정제없이 다음 단계에서 그대로 사용하였다.

[0408] 단계 B. R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올. $t\text{BuOH}/\text{H}_2\text{O}$ (14 mL) 및 3-부탄-2-올 (0.37 mL, 4.96 mmol)의 1:1 혼합물 중의 조 4-아지도-1-클로로-2-(다이플루오로메톡시)벤젠 (단계 A의)의 용액에 $\text{CuSO}_4 \cdot 5\text{H}_2\text{O}$ (103 mg, 0.413 mmol) 및 L-아스코르브산나트륨 (82 mg, 0.413 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 주말 동안 실온에서 교반하였다. 반응물을 EtOAc, H_2O 및 NH_4Cl 의 포화 수용액으로 희석하였다. 2상 혼합물을 5분 동안 교반한 다음, 층을 분리하고, 수층을 추가로 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 어두운 주황색 고체로 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 30 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (785 mg, 2.71 mmol, 66% 수율)을 얻었다. MS (ESI) $\text{C}_{11}\text{H}_{10}\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 289.0; m/z 실측치 290.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 7.97 - 7.88 (m, 1H), 7.73 - 7.66 (m, 1H), 7.63 - 7.58 (m, 1H), 7.58 - 7.54 (m, 1H), 6.64 (t, $J = 72.6$ Hz, 1H), 5.17 (q, $J = 6.5$ Hz, 1H), 2.65 (s, 1H), 1.66 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H).

[0409] 중간체 3. 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)아닐린.

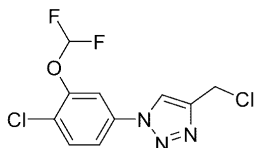


[0410]

[0411] 단계 A. 1-클로로-2-(다이플루오로메틸)-4-니트로벤젠. DCM (50 mL) 중에 교반하는 2-클로로-5-니트로벤즈알데하이드 (3.08 g, 16.61 mmol)에 실온에서 DAST (2.83 mL, 21.59 mmol)를 서서히 첨가하고, 생성된 용액을 실온에서 20시간 동안 교반하였다. 완료된 반응물을 얼음 (100 g) 위에 붓고, 얼음이 모두 녹을 때까지 교반하였다. 층을 분리하고, 수층을 DCM (3 × 20 mL)으로 추출하였다. 합한 유기물을 염수 (20 mL)로 1회 세정하고, 건조시킨(Na_2SO_4) 다음, 감압 하에 농축시켰다. 생성된 주황색 잔류물 (3.4 g, 98%)을 정제없이 다음으로 진행시켰다. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.55 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 8.33 - 8.27 (m, 1H), 7.67 - 7.62 (m, 1H), 6.98 (t, $J = 54.3$ Hz, 1H).

[0412] 단계 B. 4-클로로-3-(다이플루오로메틸)아닐린. 5:1 아세톤:물 (90 mL) 중의 1-클로로-2-(다이플루오로메틸)-4-니트로벤젠 (3.31 g, 15.95 mmol) 및 염화암모늄 (4.27 g, 79.73 mmol)의 교반한 혼합물에 0°C에서 아연 분말 (10.43 g, 159.46 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 실온으로 가온시키고, 16시간 동안 교반하였다. 완료시, 반응물을 셀라이트®를 통해 여과하고, 감압 하에 농축한 다음, EtOAc (50 mL) 및 H_2O (50 mL)에 용해시켰다. 층을 분리하고 유기 층을 1 M NaOH (3 × 15 mL)로 세정한 다음, 셀라이트®를 통해 다시 여과하였다. 생성된 용액을 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켜, 정치시 고화되는 주황색 오일 (2.29 g, 78%)을 얻었다. 물질을 추가의 정제없이 그대로 다음으로 진행시켰다. MS (ESI): $\text{C}_7\text{H}_6\text{ClF}_2\text{N}$ 에 대한 질량 계산치, 177.0; m/z 실측치, 177.9 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 7.19 - 7.13 (m, 1H), 6.94 (d, $J = 2.9$ Hz, 1H), 6.87 (t, $J = 55.1$ Hz, 1H), 6.73 - 6.67 (m, 1H).

[0413] 중간체 4. 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸.

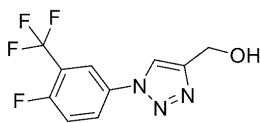


[0414]

[0415] DCM (2 mL) 중의 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1, 243 mg, 0.882 mmol)의 용액에 염화티오닐 (2 mL)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 완료시 반응 혼합물을 빙수 및 K_2CO_3 용액에 부었다. 2상 혼합물을 얼음이 모두 녹을 때까지 교반하고, 층을 분리하였다. 수층을 DCM (3X)으로 추가로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (Na_2SO_4), 여과하고, 감압 하에 농축시켜, 황색 고체 (231 mg)로서의 표제 화합물을 얻어, 추가의 정제없이 사용하였다. MS (ESI) $\text{C}_{10}\text{H}_7\text{Cl}_2\text{F}_2\text{N}_3\text{O}$

에 대한 질량 계산치, 293.0; m/z 실측치 294.1 $[M+H]^+$.

[0416] 중간체 5. (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.

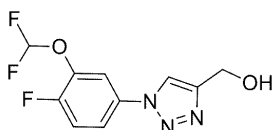


[0417]

[0418] 단계 A. 4-아지도-1-플루오로-2-(트라이플루오로메틸)벤젠. 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)아닐린 (1 mL, 7.77 mmol)을 0℃에서 시린지를 통해 TFA (6 mL)/H₂SO₄ (1.2 mL)의 냉각 용액에 첨가하였다. 백색 침전물 형태 및 플라스크를 빙욕으로부터 제거하고, 균질해질 때 까지 교반하였다 (약 15분). 생성된 용액을 빙욕에 다시 넣고, 수증 (5 mL)의 NaNO₂ (664 mg, 9.6 mmol) 용액을 적가하였다. 0℃에서 30분 동안 교반한 후, 이어서 수증 (5 mL)의 NaN₃ (880 mg, 13.5 mmol) 용액을 서서히 첨가하였다. 주의: 가스 발생이 관찰되었다. 첨가를 완료한 후에 반응 혼합물을 실온으로 가온시키고, 추가로 30분 동안 교반하였다. 에테르 (75 mL)를 첨가하고, 층을 분리하였다. 유기 층을 수성 NaHCO₃ (포화)에 놓아, 산성 수층을 에테르로 추출하고 (1x), 유기 층을 합해, 수성 NaHCO₃ (포화), 염수로 세정하고, 건조시켜 (MgSO₄), 여과하고, 감압 하에 농축시켜, 표제 화합물을 얻어, 다음 단계에서 그대로 사용하였다.

[0419] 단계 B. (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. t-BuOH/물 (20 mL; 1:1) 중의 4-아지도-1-플루오로-2-(트라이플루오로메틸)벤젠의 용액에 프로프-2-인-1-올 (0.6 mL, 10.3 mmol); 황산구리 (195 mg, 0.78 mmol) 및 아스코르브산나트륨 (152 mg, 0.77 mmol)을 첨가하였다. 얻어진 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 물 (200 mL)에 부어, EtOAc (3 × 50 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 감압 하에 농축시켰다. 잔류물을 SiO₂ (소량의(trace) MeOH를 포함하는 DCM) 상에 직접 로딩하였다. 정제 (FCC, SiO₂, DCM/EtOAc (10% MeOH) 0 내지 70%)에 의해, 황백색 고체 (87%)로서의 표제 화합물을 얻었다. ¹H NMR (500 Mhz, CDCl₃) δ 8.02 - 7.98 (m, 2H), 7.98 - 7.93 (m, 1H), 7.43 - 7.36 (m, 1H), 4.97 - 4.87 (m, 2H), 2.24 (t, J = 6.0 Hz, 1H).

[0420] 중간체 6. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0421]

[0422] 방법 A.

[0423] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C₁₀H₈F₃N₃O₂에 대한 질량 계산치, 259.1; m/z 실측치, 260.1 $[M+H]^+$. ¹H NMR (400 Mhz, CDCl₃) δ 2.44 (s, 1H), 4.91 (s, 2H), 6.65 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 7.35 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.53 - 7.64 (m, 1H), 7.70 (dd, J = 6.6, 2.7 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H).

[0424] 방법 B.

[0425] 단계 A. 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로아닐린. 아세톤 (31 mL) 및 물 (3.1 mL) 중의 2-(다이플루오로메톡시)-1-플루오로-4-니트로벤젠 (1.4 g, 6.8 mmol) 및 Zn 분말 (4.0 g, 60.8 mmol)의 현탁액에 0℃에서 염화암모늄 (3.3 g, 60.8 mmol)을 첨가하였다. 완료시, 반응 혼합물을 셀라이트® 패드를 통해 여과하고, MeOH로 행구었다. 여과액을 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 10% EtOAc)에 의해 (1.2 g, 6.6 mmol, 97%)을 얻었다. MS (ESI): C₇H₆F₃NO에 대한 질량 계산치, 177.0; m/z 실측치, 178.1 $[M+H]^+$. ¹H NMR (400 Mhz, DMSO-d₆) δ 7.10 (t, J = 73.7 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 10.8, 8.8 Hz, 1H), 6.49 - 6.45 (m, 1H), 6.39 (ddd, J = 8.8, 3.8, 2.7 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H).

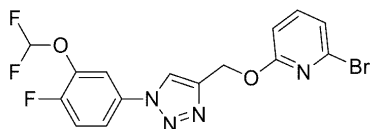
[0426] 단계 B. 4-아지도-2-(다이플루오로메톡시)-1-플루오로벤젠. 아질산나트륨 (H_2O 중의 1.3 M, 6.4 mL, 8.3 mmol)을 0°C 에서 TFA (5.1 mL, 66.1 mmol) 및 H_2SO_4 (1.1 mL, 19.8 mmol) 중의 3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로아닐린 (1.2 g, 6.6 mmol)의 용액에 적가하였다. 0°C 에서 30분 동안 혼합물을 교반한 다음, 아지드화나트륨 (H_2O 중의 1.3 M, 8.9 mL, 11.6 mmol)을 0°C 에서 적가하였다. 혼합물을 0°C 에서 30분 동안 교반하였다. 이어서, 혼합물을 Et_2O 로 희석하였다. 유기 층을 수집하여, NaHCO_3 의 포화 수용액으로 세정하고 (염기성 pH가 될 때까지), 건조시켜 (MgSO_4), 여과하고, 진공 하에 농축시켜, 표제 생성물을 얻었다. 표제 생성물을 그대로 다음 단계로 가져갔다.

[0427] 단계 C. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 실온에서 CuSO_4 (91 mg, 0.6 mmol) 및 (+)-아스코르브산나트륨 (114 mg, 0.6 mmol)을 증류수 (7.3 mL) 및 아이소프로판올 (5.7 mL) 중의 4-아지도-2-(다이플루오로메톡시)-1-플루오로벤젠 (1.2 g, 5.8 mmol) 및 프로파르길 알코올 (0.4 mL, 7.5 mmol)의 교반 용액에 첨가하였다. 완료시, 물 (40 mL)을 반응 혼합물에 첨가하였다. 반응 혼합물을 EtOAc (3×60 mL)를 사용하여 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (MgSO_4), 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 90% EtOAc)에 의해 (1.3 g, 87%)을 얻었다.

[0428] 방법 C.

[0429] 실온에서 아지드화나트륨 (129 mg, 2.0 mmol)을 DMSO (4.5 mL) 중의 2-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란 (380 mg, 1.3 mmol) 및 CuOAc_2 (48 mg, 0.3 mmol)의 혼합물에 첨가하였다. 3시간 후, 프로파르길 알코올 (0.12 mL, 2.0)을 반응 혼합물에 첨가하였다. 16시간 후, 물 (20 mL)을 첨가하고, EtOAc (3×30 mL)를 사용하여 혼합물을 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (MgSO_4), 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 40% EtOAc)에 의해 (14 mg, 0.05, mmol, 4%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_8\text{F}_3\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 259.1; m/z 실측치, 259.9 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

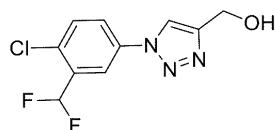
[0430] 중간체 7. 2-브로모-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘.



[0431]

[0432] 0°C 에서 DMF (1.2 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6, 50 mg, 0.19 mmol) 및 2-브로모-6-플루오로피리딘 (40.7 mg, 0.23 mmol)의 용액에 NaH (광유 중의 60% 분산액, 9.2 mg, 0.23 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 0°C 에서 2시간 동안 교반한 다음, 물을 첨가하여 킨칭하였다. 생성된 침전물을 여과하여, 표제 화합물 (75 mg, 93%)을 얻어, 추가의 정제없이 그대로 사용하였다. MS (ESI): $\text{C}_{15}\text{H}_{10}\text{BrF}_3\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 413.99; m/z 실측치, 414.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

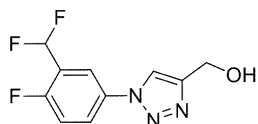
[0433] 중간체 8. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0434]

[0435] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_8\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 259.0; m/z 실측치, 260.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.37 (s, 1H), 8.35 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 8.25 – 8.19 (m, 1H), 7.97 – 7.93 (m, 1H), 7.34 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 2.72 (s, 1H).

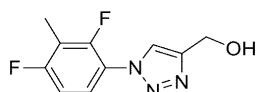
[0436] 중간체 9. (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0437]

[0438] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 243.1; m/z 실측치, 244.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.26 (br t, $J = 5.78$ Hz, 1H) 4.91 (d, $J = 5.32$ Hz, 2H) 6.76 - 7.15 (m, 1H) 7.33 (t, $J = 9.02$ Hz, 1H) 7.85 - 7.97 (m, 2H) 8.00 (s, 1H).

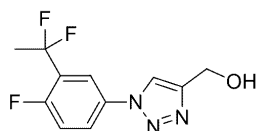
[0439] 중간체 10. (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0440]

[0441] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_9F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 225.1; m/z 실측치, 226.2 $[M+H]^+$.

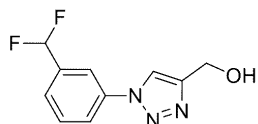
[0442] 중간체 11. (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0443]

[0444] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{10}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 257.1; m/z 실측치 258.0. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.98 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.95 - 7.87 (m, 1H), 7.87 - 7.78 (m, 1H), 7.31 (dd, $J = 9.9, 8.9$ Hz, 1H), 4.91 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.05 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

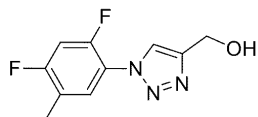
[0445] 중간체 12. (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0446]

[0447] 3-(다이플루오로메틸)아닐린을 사용하여, 표제 화합물을 중간체 1, 단계 C와 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_9F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 225.1; m/z 실측치, 226.1 $[M+H]^+$.

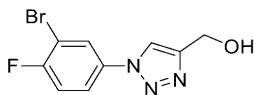
[0448] 중간체 13. (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0449]

[0450] 2,4-다이플루오로-5-메틸아닐린을 사용하여, 표제 화합물을 중간체 1, 단계 C와 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_9F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 225.1; m/z 실측치, 226.1 $[M+H]^+$.

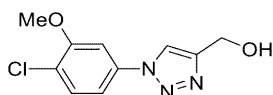
[0451] 중간체 14. (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올



[0452]

[0453] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_7BrFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 270.98; m/z 실측치, 274.0 $[M+H+2]^+$.

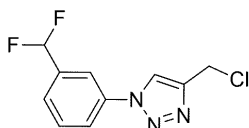
[0454] 중간체 15. (1-(4-클로로-3-메톡시페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올



[0455]

[0456] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}ClN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 239.1; m/z 실측치, 240.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.97 (s, 1H), 7.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.46 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.15 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.00 (s, 3H).

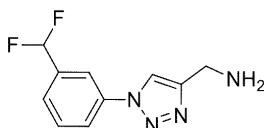
[0457] 중간체 16. 4-(클로로메틸)-1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸.



[0458]

[0459] 표제 화합물을 중간체 4와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_9F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 225.1; m/z 실측치 226.1.

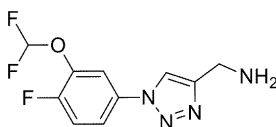
[0460] 중간체 17. (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.



[0461]

[0462] 4-(클로로메틸)-1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 16, 309.0 mg, 1.27 mmol)을 압력 플라스크에 넣은 후, NH_3 (MeOH 중의 7M (13.73 mL, 7M, 96.13 mmol))에 용해시켰다. 플라스크를 밀봉하여, 반응물을 45°C에서 20시간 동안 교반하였다. 용매를 감압 하에 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM 중의 0 내지 8% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (124.7 mg, 44%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}F_2N_4$ 에 대한 질량 계산치, 224.1; m/z 실측치, 225.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ 8.63 (s, 1H), 8.14 – 8.11 (m, 1H), 8.09 – 8.05 (m, 1H), 7.82 – 7.77 (m, 1H), 7.77 – 7.73 (m, 1H), 6.97 (t, J = 55.9 Hz, 1H), 4.26 (s, 2H).

[0463] 중간체 18. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.

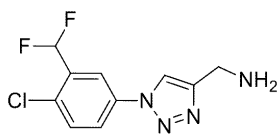


[0464]

[0465] 표제 화합물을 중간체 17과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_9F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 258.1; m/z 실측치, 259.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ ppm 4.20 (s, 2H) 7.45 (t, J = 72.7 Hz, 1H) 7.68 – 7.77 (m, 1H) 7.85 (dt, J = 8.8, 3.4 Hz, 1H) 7.98 (dd, J = 6.9, 2.7 Hz, 1H) 8.64 (br s, 3H) 8.95 (s,

1H).

[0466] 중간체 19. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.



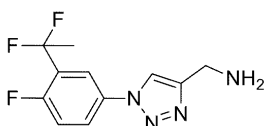
[0467]

[0468] 단계 A. 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸. DCM (16 mL) 중의 교반하는 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8, 1.65 g, 6.3 mmol)에 SOCl₂ (4 mL, 55 mmol)를 서서히 첨가하였다. 혼합물을 하룻밤 동안 실온에서 교반한 다음, 빙수 및 K₂CO₃의 혼합물에 부었다. 얼음을 모두 녹인 후, 층을 분리하고, 수층을 DCM (3x)으로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세정하고, 건조시킨 다음 (Na₂SO₄), 감압 하에 농축시켜, 주황색 고체 (1.66 g, 94%)를 얻어, 정제 없이 사용하였다.

[0469] 단계 B. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)아이소인돌린-1,3-다이온. DMF (2.7 mL) 중의 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (152 mg, 0.55 mmol)에 프탈이미드 (96 mg, 0.65 mmol), 이어서 K₂CO₃ (226 mg, 1.6 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 80℃에서 1시간 동안 교반한 후, 실온으로 냉각시키고, EtOAc 및 H₂O로 희석하였다. 층을 분리하고, 수층을 DCM (X3)으로 추출한 다음, 합한 유기 층을 감압 하에 농축시켜 주황색 고체를 얻어, 정제 없이 사용하였다.

[0470] 단계 C. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민. EtOH (5 mL) 중에 교반하는 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)아이소인돌린-1,3-다이온 (212 mg, 0.55 mmol)에 하이드라진 수화물 (0.03 mL, 0.65 mmol)을 첨가하고, 혼합물을 1시간 동안 환류 하에 (80℃) 교반하였다. 반응물을 실온으로 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, MeOH/DCM 중의 10% 2 M NH₃ 0 내지 100%)에 의해, 담황색 고체 (116 mg, 82%)로서의 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): C₁₀H₉ClF₂N₄에 대한 질량 계산치, 258.0; m/z 실측치, 259.0 [M+H]⁺.

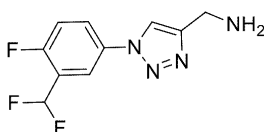
[0471] 중간체 20. (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.



[0472]

[0473] 단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11)을 사용하여, 표제 화합물을 중간체 19, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): C₁₁H₁₁F₃N₄에 대한 질량 계산치, 256.1; m/z 실측치, 257.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.48 - 8.43 (m, 1H), 8.06 (dd, J = 6.3, 2.8 Hz, 1H), 8.04 - 7.99 (m, 1H), 7.52 - 7.45 (m, 1H), 4.02 (s, 2H), 2.07 (td, J = 18.8, 1.1 Hz, 3H).

[0474] 중간체 21: (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.

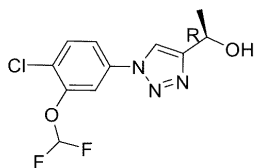


[0475]

[0476] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9)을 사용하여, 표제 화합물을 중간체 19, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): C₁₀H₉F₃N₄에 대한

질량 계산치, 242.1; m/z 실측치 243.0 [M+1].

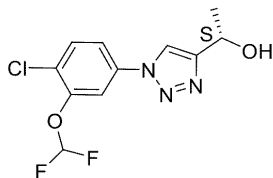
[0477] 중간체 22. (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올.



[0478]

[0479] 단계 A에서 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 (R)-(+)-3-부틴-2-올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{10}ClF_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 289.7; m/z 실측치, 290.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.76 (s, 1H), 7.98 (d, *J* = 2.3 Hz, 1H), 7.90 - 7.81 (m, 2H), 7.45 (t, *J* = 72.8 Hz, 1H), 5.44 (d, *J* = 4.8 Hz, 1H), 4.92 (qd, *J* = 6.5, 4.7 Hz, 1H), 1.48 (d, *J* = 6.5 Hz, 3H).

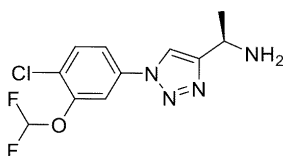
[0480] 중간체 23. (S)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올.



[0481]

[0482] 단계 A에서 4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 (S)-(+)-3-부틴-2-올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{10}ClF_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 289.7; m/z 실측치, 290.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.75 (s, 1H), 7.98 (d, *J* = 2.3 Hz, 1H), 7.91 - 7.79 (m, 2H), 7.45 (t, *J* = 72.8 Hz, 1H), 5.44 (d, *J* = 4.8 Hz, 1H), 4.92 (qd, *J* = 6.5, 4.6 Hz, 1H), 1.47 (d, *J* = 6.5 Hz, 3H).

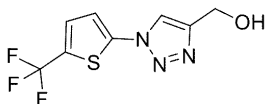
[0483] 중간체 24. (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-아민.



[0484]

[0485] 단계 A에서 (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 2)을 사용하여, 표제 화합물을 중간체 19와 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{11}ClF_2N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 288.1; m/z 실측치, 289.0 [M+H]⁺.

[0486] 중간체 25: (1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0487]

[0488] 단계 A. *tert*-부틸 (5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)카르바메이트. *tert*-부틸 알코올 (64 mL) 중의 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-카르복실산 (2.5 g, 12.75 mmol)의 용액에 트라이에틸아민 (1.78 mL, 12.75 mmol), 이어서 다이페닐포스포릴아지드 (2.75 mL, 12.75 mmol)를 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 90℃로 가열하고, 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 실온으로 냉각시켜, 용매를 감압 하에 제거하였다. 생성된 잔류물을 아세트산에틸 (50 mL)에 다시 용해시켜, 포화 NaHCO₃ 수용액, 시트르산 (10% 수용액) 및 염수로 세정하였다. 합한

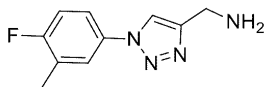
유기 층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 갈색 오일로 농축시키고, FCC (5 내지 20% 아세트산에틸/헥산을 사용함)를 통해 정제하여, 백색 고체 (804 mg, 3.01 mmol, 23%)로서의 원하는 생성물을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_{12}\text{F}_3\text{NO}_2\text{S}$ 에 대한 질량 계산치, 267.2; m/z 실측치, 268.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 7.16 – 7.14 (m, 1H), 6.40 – 6.37 (m, 1H), 1.55 – 1.50 (m, 9H).

[0489] 단계 B. 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-아민 HCl 염. 다이옥산 (8 mL) 중의 *tert*-부틸 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)카르바메이트 (804 mg, 3.01 mmol)의 용액에 다이옥산 (3.76 mL, 15.04 mmol) 중의 4M HCl을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 하룻밤 동안 실온에서 교반하였다. 반응 혼합물을 (감압 하에) 후속하여 백색 고체로 농축시키고, 에테르로 세정하여, 원하는 생성물 (584 mg, 2.868 mmol, 95.3%)을 얻었다. 정량적 수율을 가정하고, 중간체를 추가의 정제없이 사용하였다. MS (ESI): $\text{C}_5\text{H}_4\text{F}_3\text{NS}$ 에 대한 질량 계산치, 203.6; m/z 실측치, 204.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 7.13 – 7.09 (m, 1H), 5.90 – 5.84 (d, $J = 4.0$ Hz, 1H).

[0490] 단계 C. 2-아지도-5-(트라이플루오로메틸)티오펜. 0°C 에서 TFA (0.56 mL, 7.4 mmol), H_2SO_4 (0.118 mL, 2.21 mmol) 및 물 (4 mL) 중의 5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-아민 HCl 염 (150 mg, 0.74 mmol)의 용액에 1.3 M 아질산나트륨 (0.71 mL, 0.92 mmol) 수용액을 서서히 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 0°C 에서 30분 동안 교반한 후, 수 (4 mL) 중의 1.3 M 아지도화나트륨 (0.992 mL, 1.29 mmol) 수용액을 적가하였다. 반응 혼합물을 추가로 30분 동안 교반한 다음, 에테르 (10 mL)로 희석하였다. 유기 층을 분리하여, 포화 NaHCO_3 용액으로 세정하고 (pH8 까지), 건조시켜 (Na_2SO_4), 여과하고, 감압 하에 농축시켜, 원하는 생성물 (142 mg, 0.74 mmol)을 얻었다. 정량적 수율을 가정하고, 조물질을 추가의 정제없이 다음으로 진행시켰다.

[0491] 단계 D. (1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 실온에서 아이소프로필 알코올 (1 mL) 및 물 (1 mL) 중의 2-아지도-5-(트라이플루오로메틸)티오펜 (150 mg, 0.78 mmol) 및 프로파르길 알코올 (0.06 mL, 1.01 mmol)의 용액에 황산 구리(II) (14 mg, 0.08 mmol) 및 아스코르브산나트륨 (15 mg, 0.08 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 3시간 동안 교반한 다음, 물 (10 mL)로 희석하고, 아세트산에틸 (3×20 mL)로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 90% 아세트산에틸)에 의해, 표제 화합물 (94 mg, 0.38 mmol, 48%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_8\text{H}_6\text{F}_3\text{N}_3\text{OS}$ 에 대한 질량 계산치, 249.2; m/z 실측치, 250.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.06 – 7.86 (s, 1H), 7.46 – 7.32 (m, 1H), 7.23 – 7.10 (d, $J = 4.1$ Hz, 1H), 4.98 – 4.76 (s, 2H), 2.79 – 2.63 (s, 1H).

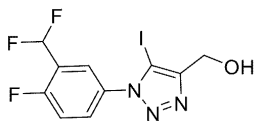
[0492] 중간체 26. (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민.



[0493]

[0494] 단계 A에서 (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올을 사용하여, 중간체 19, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_{11}\text{FN}_4$ 에 대한 질량 계산치, 206.1; m/z 실측치, 207.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

[0495] 중간체 27: (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-5-요오도-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



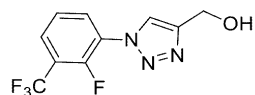
[0496]

[0497] 단계 A. 4-아지도-2-(다이플루오로메틸)-1-플루오로벤젠. 단계 A에서 2-(다이플루오로메틸)-1-플루오로-4-니트로벤젠을 사용하여, 중간체 6, 방법 B, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[0498] 단계 B. (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-5-요오도-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 4-아지도-2-

(다이플루오로메틸)-1-플루오로벤젠 (336 mg, 1.8 mmol), 과염소산구리(II) 6수화물 (1.3 g, 3.6 mmol) 및 NaI (1.1 g, 7.2 mmol)을 ACN (8 mL)에서 예비 혼합하였다. 5분 후, 프로파르길 알코올 (0.14 mL, 2.3 mmol) 및 DBU (0.27 mL, 1.8 mmol)를 첨가하였다. 완료시, 반응 혼합물을 DCM (40 mL)에 희석하고, NH₄OH (수중 28% NH₃, 50 mL)를 첨가하였다. 조물질을 DCM에서 트리튜레이션(trituration)하였다. 고체를 여과에 의해 수집하여, DCM으로 행구고, 감압 하에 건조시켜, 표제 화합물 (249 mg, 38%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₀H₇F₃IN₃O에 대한 질량 계산치, 369.0; m/z 실측치, 369.8 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 7.93 – 7.85 (m, 2H), 7.74 – 7.66 (m, 1H), 7.32 (t, *J* = 53.9 Hz, 1H), 5.31 (t, *J* = 5.4 Hz, 1H), 4.54 (d, *J* = 5.4 Hz, 2H).

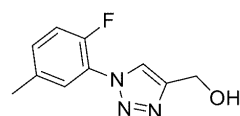
[0499] 중간체 28. (1-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0500]

[0501] 단계 A에서 2-플루오로-1-니트로-3-(트라이플루오로메틸)벤젠을 사용하여, 중간체 6, 방법 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₀H₇F₄N₃O에 대한 질량 계산치, 261.1; m/z 실측치, 261.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.56 – 8.54 (m, 1H), 8.21 – 8.15 (m, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.66 (tt, *J* = 8.0, 1.0 Hz, 1H), 5.38 (t, *J* = 5.7 Hz, 1H), 4.64 (dd, *J* = 5.6, 0.8 Hz, 2H).

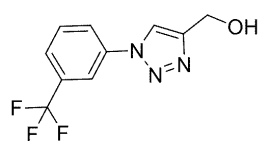
[0502] 중간체 29. (1-(2-플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0503]

[0504] 단계 B에서 2-플루오로-5-메틸아닐린을 사용하여, 중간체 6, 방법 B, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₀H₁₀FN₃O에 대한 질량 계산치, 207.1; m/z 실측치, 208.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.40 (dt, *J* = 2.2, 0.7 Hz, 1H), 7.66 – 7.61 (m, 1H), 7.48 – 7.36 (m, 2H), 5.32 (t, *J* = 5.6 Hz, 1H), 4.62 (d, *J* = 5.2 Hz, 2H), 2.40 – 2.37 (m, 3H).

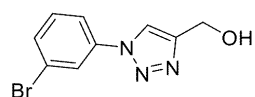
[0505] 중간체 30. (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0506]

[0507] 단계 B에서 3-(트라이플루오로메틸)아닐린을 사용하여, 중간체 6, 방법 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₀H₈F₃N₃O에 대한 질량 계산치, 243.1; m/z 실측치, 244.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.88 (s, 1H), 8.31 – 8.25 (m, 2H), 7.88 – 7.82 (m, 2H), 5.38 (t, *J* = 5.6 Hz, 1H), 4.63 (d, *J* = 5.5 Hz, 2H).

[0508] 중간체 31. (1-(3-브로모페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.

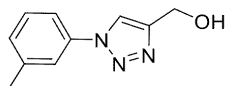


[0509]

[0510] 단계 B에서 3-브로모아닐린을 사용하여, 중간체 6, 방법 B 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ¹H NMR (300 MHz, CDCl₃) δ 7.97 (s, 1H), 7.94 (t, *J* = 1.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, *J* = 8.1, 0.9

Hz, 1H), 7.58 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.41 (t, $J = 8.1$ Hz, 1H), 4.90 (s, 2H). OH는 관찰되지 않았다.

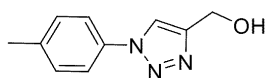
[0511] 중간체 32. (1-(m-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0512]

[0513] 단계 A에서 m-톨루이딘 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{11}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 189.2; m/z 실측치, 190.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.77 - 7.73 (m, 1H), 7.71 - 7.64 (m, 1H), 7.46 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.29 (ddt, $J = 7.6, 1.7, 0.9$ Hz, 1H), 5.31 (t, $J = 5.6$ Hz, 1H), 4.61 (dd, $J = 5.6, 0.7$ Hz, 2H), 2.50 (p, $J = 1.9$ Hz, 3H).

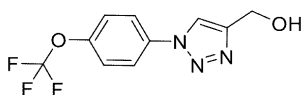
[0514] 중간체 33. (1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0515]

[0516] 단계 A에서 p-톨루이딘 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{11}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 189.2; m/z 실측치, 190.1 $[M+H]^+$.

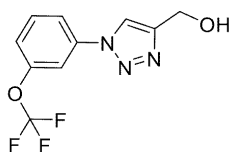
[0517] 중간체 34. (1-(4-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0518]

[0519] 단계 A에서 4-(트리플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 259.2; m/z 실측치, 260.1 $[M+H]^+$.

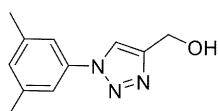
[0520] 중간체 35. (1-(3-(트리플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0521]

[0522] 단계 A에서 3-(트리플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 259.2; m/z 실측치, 260.1 $[M+H]^+$.

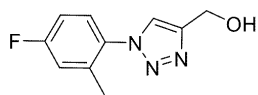
[0523] 중간체 36. (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0524]

[0525] 단계 A에서 3,5-다이메틸아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{13}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 203.2; m/z 실측치, 204.2 $[M+H]^+$.

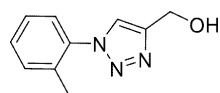
[0526] 중간체 37. (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0527]

[0528] 단계 A에서 4-플루오로-2-메틸아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 207.2; m/z 실측치, 208.1 $[M+H]^+$.

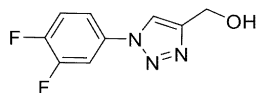
[0529] 중간체 38. (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0530]

[0531] 단계 A에서 o-톨루이딘을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{11}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 189.2; m/z 실측치, 190.1 $[M+H]^+$.

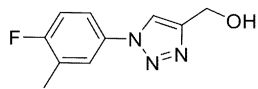
[0532] 중간체 39. (1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0533]

[0534] 단계 A에서 3,4-다이플루오로아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_7F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 211.2; m/z 실측치, 212.1 $[M+H]^+$.

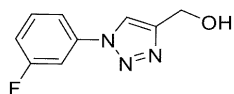
[0535] 중간체 40. (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0536]

[0537] 단계 A에서 4-플루오로-3-메틸아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 207.2; m/z 실측치, 208.1 $[M+H]^+$.

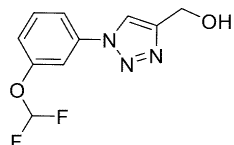
[0538] 중간체 41. (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0539]

[0540] 단계 A에서 3-플루오로아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_8FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 193.2; m/z 실측치, 194.1 $[M+H]^+$.

[0541] 중간체 42. (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.

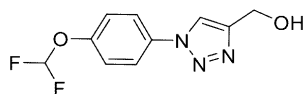


[0542]

[0543] 단계 A에서 3-(다이플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 241.2; m/z 실측치, 242.0

$[M+H]^+$.

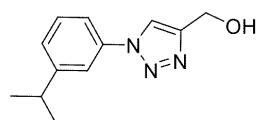
[0544] 중간체 43. (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0545]

[0546] 단계 A에서 4-(다이플루오로메톡시)아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 241.2; m/z 실측치, 242.0 $[M+H]^+$.

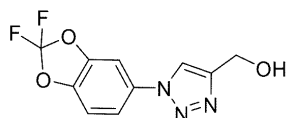
[0547] 중간체 44. (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0548]

[0549] 단계 A에서 3-아이소프로필아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_8F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 241.2; m/z 실측치, 242.0 $[M+H]^+$.

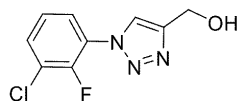
[0550] 중간체 45. (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0551]

[0552] 단계 A에서 2,2-다이플루오로-5-아미노벤조다이옥솔 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_7F_2N_3O_3$ 에 대한 질량 계산치, 255.2; m/z 실측치, 256.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.67 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.07 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 8.7, 2.2 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.36 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 4.61 (dd, J = 5.6, 0.7 Hz, 2H).

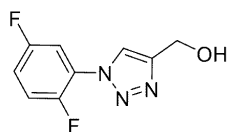
[0553] 중간체 46. (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0554]

[0555] 단계 A에서 3-클로로-2-플루오로아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_7ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 227.6; m/z 실측치, 228.0 $[M+H]^+$.

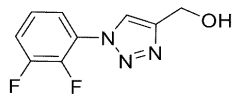
[0556] 중간체 47. (1-(2,5-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0557]

[0558] 단계 A에서 2,5-다이플루오로아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_7F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 211.2; m/z 실측치, 212.1 $[M+H]^+$.

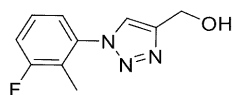
[0559] 중간체 48. (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0560]

[0561] 단계 A에서 2,3-다이플루오로아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_9H_7F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 211.2; m/z 실측치, 212.1 $[M+H]^+$.

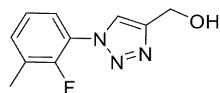
[0562] 중간체 49. (1-(3-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0563]

[0564] 단계 A에서 3-플루오로-2-메틸아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 207.2; m/z 실측치, 208.1 $[M+H]^+$.

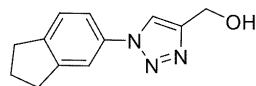
[0565] 중간체 50. (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0566]

[0567] 단계 A에서 2-플루오로-3-메틸아닐린 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{12}H_{13}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 215.3; m/z 실측치, 216.1 $[M+H]^+$.

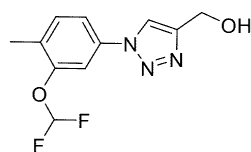
[0568] 중간체 51. (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0569]

[0570] 단계 A에서 5-아미노인단 및 단계 B에서 프로파르길 알코올을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{10}H_{10}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 207.2; m/z 실측치, 208.1 $[M+H]^+$.

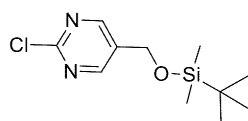
[0571] 중간체 52. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0572]

[0573] 3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸아닐린을 사용하여, 중간체 1, 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{11}F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 255.1; m/z 실측치, 256.0 $[M+H]^+$.

[0574] 중간체 53. 5-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘.

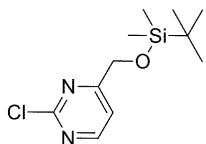


[0575]

[0576] 실온에서 DCM (38 mL) 중에 교반하는 (2-클로로피리미딘-5-일)메탄올 (946 mg, 6.5 mmol)에 이미다졸 (477 mg, 7 mmol), 이어서 tert-부틸(클로로)다이메틸실란 (1 g, 6.9 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 실온에서 30분 동안

교반한 다음, 물로 희석하였다. 층을 분리하고, 수층을 DCM (X3)으로 추출하여, 건조시켜 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 10%)에 의해, 정치시 고화되는 투명한 무색 오일 (1.37 g, 81%)로서의 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{11}\text{H}_{19}\text{ClN}_2\text{OSi}$ 에 대한 질량 계산치, 258.1; m/z 실측치, 259.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

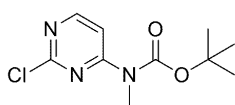
[0577] 중간체 54. 4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘.



[0578]

[0579] (2-클로로피리미딘-4-일)메탄올을 사용하여, 중간체 53과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{11}\text{H}_{19}\text{ClN}_2\text{OSi}$ 에 대한 질량 계산치, 258.1; m/z 실측치, 259.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

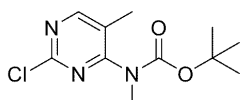
[0580] 중간체 55. tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트.



[0581]

[0582] THF (20 mL) 중의 2-클로로-N-메틸피리미딘-4-아민 (500 mg, 3.4 mmol), 다이-tert-부틸 디카르보네이트 (1.49 mL, 6.9 mmol), TEA (0.96 mL, 6.9 mmol), DMAP (42.5 mg, 0.34 mmol)의 용액을 70°C에서 3시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 20% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (762 mg, 88%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_{14}\text{ClN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 243.1; m/z 실측치, 244.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.51 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 3.33 (s, 3H), 1.52 (s, 9H).

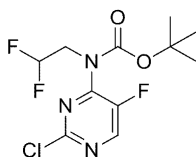
[0583] 중간체 56. tert-부틸 (2-클로로-5-메틸피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트.



[0584]

[0585] 2-클로로-N,5-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 중간체 55와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{11}\text{H}_{16}\text{ClN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 257.1; m/z 실측치, 258.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

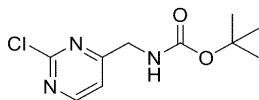
[0586] 중간체 57. tert-부틸 (2-클로로-5-플루오로피리미딘-4-일)(2,2-다이플루오로에틸)카르바메이트



[0587]

[0588] 2-클로로-N-(2,2-다이플루오로에틸)-5-플루오로피리미딘-4-아민을 사용하여, 중간체 55와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_{13}\text{ClF}_3\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8.92 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 6.47 – 6.15 (m, 1H), 4.22 (td, J = 14.8, 3.8 Hz, 2H), 1.44 (s, 9H).

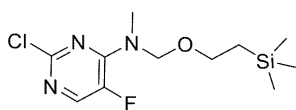
[0589] 중간체 58: *tert*-부틸 ((2-클로로피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트.



[0590]

[0591] EtOH (25 mL) 중의 2-클로로피리미딘-4-카르보닐트릴 (1.5 g, 10.7 mmol), 다이-*tert*-부틸 다이카르보네이트 (2.8 mL, 12.9 mmol) 및 10% Pd/C (572 mg, 0.5 mmol)의 혼합물을 수소 분위기 (1 atm, 벌룬) 하에 실온에서 교반하였다. 4시간 후에, 반응 혼합물을 셀라이트® 패드를 통해 여과하였다. 여과액을 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 생성물 (720 mg, 27%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₀H₁₄ClN₃O₂에 대한 질량 계산치, 243.7; m/z 실측치, 187.9 [M-t-Bu]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.72 (d, *J* = 5.1 Hz, 1H), 7.56 (t, *J* = 6.2 Hz, 1H), 7.39 (d, *J* = 5.1 Hz, 1H), 4.21 (d, *J* = 6.0 Hz, 2H), 1.40 (s, 9H).

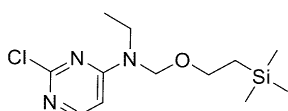
[0592] 중간체 59. 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민.



[0593]

[0594] DMF (28 mL) 중의 2-클로로-5-플루오로-N-메틸피리미딘-4-아민 (500 mg, 3 mmol), (2-(클로로메톡시)에틸)트라이메틸실란 (0.8 mL, 4.6 mmol), DIPEA (0.8 mL, 4.6 mmol)의 용액을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 추가의 (2-(클로로메톡시)에틸)트라이메틸실란 (0.8 mL, 4.6 mmol), DIPEA (0.8 mL, 4.6 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 6시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물에 염수 (50 mL)를 첨가하고, 반응 혼합물을 EtOAc (3 × 60 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 (MgSO₄), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 90% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (528 mg, 58%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₁H₁₉ClFN₃OSi에 대한 질량 계산치, 291.1; m/z 실측치, 292.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.27 (d, *J* = 6.1 Hz, 1H), 4.97 (d, *J* = 1.4 Hz, 2H), 3.55 – 3.51 (m, 2H), 3.17 (d, *J* = 2.5 Hz, 3H), 0.90 – 0.85 (m, 2H), -0.03 – -0.05 (m, 9H).

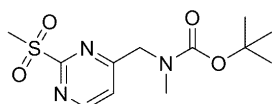
[0595] 중간체 60. 2-클로로-N-에틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민.



[0596]

[0597] 2-클로로-N-에틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 중간체 59와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₂H₂₂ClN₃OSi에 대한 질량 계산치, 287.1; m/z 실측치, 288.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.13 (d, *J* = 6.1 Hz, 1H), 6.79 (d, *J* = 6.1 Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.65 – 3.46 (m, 4H), 1.12 (t, *J* = 7.1 Hz, 3H), 0.92 – 0.84 (m, 2H), -0.02 – -0.05 (m, 9H).

[0598] 중간체 61: *tert*-부틸 메틸((2-(메틸설포닐)피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트.



[0599]

[0600] 단계 A. N-메틸-1-(2-(메틸티오)피리미딘-4-일)메탄아민. 실온에서 나트륨 트리아세톡시보로하이드라이드 (825 mg, 3.9 mmol)를 THF (28 mL) 중의 2-(메틸티오)피리미딘-4-카르브알데하이드 (300 mg, 1.9 mmol) 및 메틸 아민 (MeOH 중의 2 M, 1.3 mL, 2.5 mmol)의 혼합물에 첨가하였다. 16시간 후에, 반응 혼합물을 NaHCO₃의 포화 수용액 (50 mL) 으로 킨칭하였다. 혼합물을 EtOAc (3 × 75 mL)를 사용하여 추출하였다. 합한 유기물을

MgSO₄로 건조시켜, 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 90% EtOAc, 이어서 MeOH 중에 10% 2 M NH₃를 함유하는 0% DCM 내지 60% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (67 mg, 20%)을 얻었다. MS (ESI): C₇H₁₁N₃S에 대한 질량 계산치, 169.1; m/z 실측치, 170.1 [M+H]⁺.

[0601]

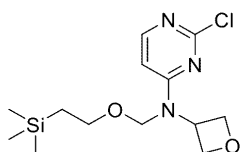
단계 B. tert-부틸 메틸((2-(메틸티오)피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트. N-메틸-1-(2-(메틸티오)피리미딘-4-일)메탄아민 (239 mg, 1.4 mmol), BOC-무수물 (0.9 mL, 4.2 mmol), DMAP (17 mg, 0.1 mmol), TEA (0.4 mL, 2.8 mmol) 및 THF (8 mL)의 혼합물을 실온에서 교반하였다. 16시간 후에, 물 (30 mL)을 첨가하고, DCM (3 × 50 mL)을 사용하여 혼합물을 추출하였다. 합한 유기물을 MgSO₄로 건조시켜, 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 40% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (151 mg, 40%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₂H₁₉N₃O₂S에 대한 질량 계산치, 269.1; m/z 실측치, 270.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.57 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.03 – 6.94 (m, 1H), 4.39 (s, 2H), 2.89 (s, 3H), 1.48 – 1.21 (m, 9H).

[0602]

단계 C. tert-부틸 메틸((2-(메틸설포닐)피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트. 0°C에서 mCPBA (276 mg, 1.2 mmol)를 DCM (6 mL) 중의 tert-부틸 메틸((2-(메틸티오)피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트 (151 mg, 0.6 mmol)의 혼합물에 서서히 첨가하였다. 3시간 후, 완전한 전환이 관찰되었다. 반응 혼합물을 NaHCO₃의 포화 수용액 (aq)(60 mL)으로 켄칭하였다. 혼합물을 DCM (3 × 80 mL)으로 추출하였다. 합한 유기물을 MgSO₄로 건조시켜, 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (132 mg, 78%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₂H₁₉N₃O₄S에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실측치, 202.1 [M-tBu]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.05 – 8.99 (m, 1H), 7.68 – 7.58 (m, 1H), 4.59 (s, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.94 (s, 3H), 1.51 – 1.19 (m, 9H).

[0603]

중간체 62: 2-클로로-N-(옥세탄-3-일)-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민.



[0604]

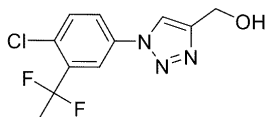
[0605]

단계 A. 2-클로로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민. DMF (17 mL) 중의 2,4-다이클로로피리미딘 (300 mg, 2.0 mmol), 3-옥세탄아민 (147 mg, 2.0 mmol) 및 DIPEA (0.7 mL, 4.0 mmol)의 혼합물을 실온에서 교반하였다. 16시간 후, 전환이 관찰되었다. 물 (20 mL)을 반응 혼합물에 첨가하여, EtOAc (3 × 30 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 MgSO₄로 건조시켜, 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물을 얻었다. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.67 – 8.60 (m, 1H), 8.04 – 7.92 (m, 1H), 6.57 – 6.38 (m, 1H), 4.98 – 4.87 (m, 1H), 4.80 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 4.49 – 4.41 (m, 2H).

[0606]

단계 B. 2-클로로-N-(옥세탄-3-일)-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민. 질소 분위기 하에, 실온에서 2-클로로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민 (374 mg, 2.0 mmol), DIPEA (0.7 mL, 4.0 mmol) (2-(클로로메톡시)에틸)트라이메틸실란 (0.7 mL, 4.0 mmol) 및 DMF (19 mL)의 혼합물을 교반하였다. 16시간 후, 완전한 전환이 관찰되었다. 물 (20 mL)을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc (3 × 30 mL)을 사용하여 추출하였다. 합한 유기물을 MgSO₄로 건조시켜, 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (187 mg, 29%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₃H₂₂ClN₃O₂Si에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.22 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 6.90 – 6.77 (m, 1H), 5.17 – 4.94 (m, 3H), 4.79 – 4.73 (m, 2H), 4.70 – 4.64 (m, 2H), 3.57 – 3.51 (m, 2H), 0.92 – 0.85 (m, 2H), -0.01 – -0.04 (m, 9H).

[0607] 중간체 63: (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.

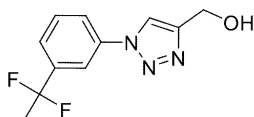


[0608]

[0609] 단계 A. 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)아닐린. 단계 A에서 1-(2-클로로-5-니트로페닐)에탄-1-온 및 단계 B에서 1-클로로-2-(1,1-다이플루오로에틸)-4-니트로벤젠을 사용하여, 중간체 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_8H_8ClF_2N_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 191.0; m/z 실험치 192.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.22 – 7.12 (m, 1H), 6.96 – 6.87 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 6.69 – 6.57 (m, 1H), 3.86 – 3.64 (s, 2H), 2.09 – 1.92 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

[0610] 단계 B. (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)아닐린을 사용하여, 중간체 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{10}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 273.0; m/z 실험치 274.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.07 – 7.92 (m, 2H), 7.90 – 7.74 (m, 1H), 7.68 – 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.00 – 4.79 (s, 2H), 2.19 – 2.01 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

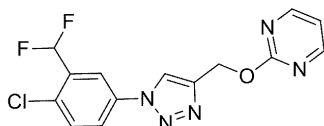
[0611] 중간체 64. (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.



[0612]

[0613] 3-(1,1-다이플루오로에틸)아닐린을 사용하여, 중간체 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{11}H_{11}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 239.1; m/z 실험치, 240.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.11 – 7.99 (s, 1H), 7.99 – 7.86 (s, 1H), 7.86 – 7.72 (m, 1H), 7.69 – 7.53 (m, 2H), 5.00 – 4.83 (s, 2H), 2.08 – 1.88 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

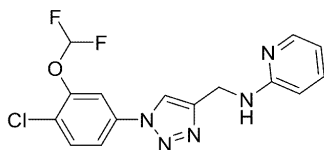
[0614] 실시예 1. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[0615]

[0616] 실온에서 DMF (1.0 mL) 중의 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 7, 25.3 mg, 0.097 mmol)의 용액에 NaH (광유 중의 60% 분산액) (11.7 mg, 0.29 mmol)를 첨가하였다. 생성된 반응물을 5분 동안 교반한 다음, 2-클로로피리미딘 (14.5 mg, 0.127 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 실온에서 20시간 동안 교반한 다음, 물 (0.10 mL)을 첨가하여 키펅하였다. 혼합물을 EtOAc (5 mL) 및 H_2O (5 mL)로 희석하였다. 층을 분리하고, 수층을 EtOAc (3×5 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 H_2O (1×5 mL), 염수 (1×5 mL)로 세정하여, 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 60% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (19.2 mg, 58%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실험치, 338.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.58 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.18 (s, 1H), 8.02 – 8.00 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.63 – 7.59 (m, 1H), 7.14 – 6.84 (m, 2H), 5.71 – 5.65 (m, 2H).

[0617] 실시예 2. N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리딘-2-아민.

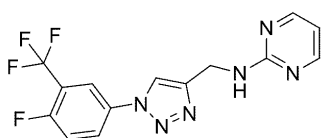


[0618]

[0619] 단계 A. 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르보알데하이드. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1, 150 mg, 0.54 mmol)을 함유하는 둥근 바닥 플라스크에 데스-마틴 페리오디난 (461.6 mg, 1.09 mmol) 및 DCM (20 mL)을 첨가하였다. 플라스크를 주위 분위기 하에 밀봉하고, 실온에서 4시간 동안 빠르게 교반하였다. 반응물을 포화 중탄산나트륨 수용액 (2.5 mL) 및 10% 티오황산나트륨 (2.5 mL) 수용액으로 토크하였다. 2상 혼합물을 백색의 회뿌연 유기상이 투명하고 무색이 될 때까지 (60분) 격렬하게 교반하였다. 층을 분리하여, 수층을 DCM (1X)으로 추출하였다. 합한 유기물을 염수로 세정하고, 건조시켜 (Na_2SO_4), 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 30% EtOAc)에 의해, 황백색 고체로서의 표제 화합물 (140 mg, 94%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{10}\text{H}_6\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 273.0; m/z 실측치 274.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

[0620] 단계 B. N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민. DCM (5 mL) 중의 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르보알데하이드 (26 mg, 0.095 mmol) 및 2-아미노 피리딘 (10.7 mg, 0.114 mmol)의 용액에 Et_2O (0.5 mL) 중의 1 N HCl을 주입하였다. 생성된 용액을 실온에서 10분 동안 교반한 다음, $\text{NaHB}(\text{OAc})_3$ (30 mg, 0.143 mmol)를 주입하였다. 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 완료된 반응물을 DCM (5 mL)으로 희석하여, 물로 토크하였다. 층을 분리하여, 수층을 DCM (1X)으로 추출하였다. 합한 유기물을 염수로 세정하고, 건조시켜 (Na_2SO_4), 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , MeOH/DCM 중의 0 내지 10% 2M NH_3)에 의해, 표제 화합물 (16 mg, 48%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{15}\text{H}_{12}\text{ClF}_2\text{N}_5\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치 352.0. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.17 – 8.05 (m, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.69 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.63 – 7.43 (m, 3H), 6.86 – 6.42 (m, 3H), 5.67 (s, 1H), 4.81 – 4.71 (m, 2H).

[0621] 실시예 3. N-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



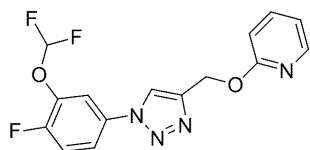
[0622]

[0623] 단계 A. 4-(클로로메틸)-1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸. 2M Na_2CO_3 로 환기되도록 장착된 플라스크에서 DCM (30 mL) 중의 (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5, 1.5 g, 5.7 mmol)의 현탁액에 SOCl_2 (15 mL)를 첨가하였다. 반응물은 균질해졌고 (약 5분), 투명한 용액을 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 감압 하에 농축하여, 황백색 고체로서의 표제 화합물 1.5 g을 얻어, 추가의 정제없이 사용하였다. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.05 (s, 1H), 8.00 (dd, $J = 5.8$, 2.7 Hz, 1H), 7.99 – 7.94 (m, 1H), 7.42 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 4.80 (s, 2H).

[0624] 단계 B. N-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민. DMF (1.5 mL) 중의 4-(클로로메틸)-1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸 (55 mg, 0.19 mmol), 피리미딘-2-아민 (45 mg, 0.47 mmol), K_2CO_3 (130 mg, 0.94 mmol)의 혼합물을 80°C 가열 블록에서 24시간 동안 가열하였다. 혼합물을 물 (35 mL)에 부어, EtOAc로 추출하였다. 용매를 감압 하에 제거하여, 잔류물을 SiO_2 상에 로딩하였다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산/EtOAc 0 내지 100%)에 의해, 표제 화합물 (13 mg, 19%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{14}\text{H}_{10}\text{F}_4\text{N}_6$ 에 대한 질량 계산치, 338.1; m/z 실측치, 339.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3)

δ 8.33 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.99 – 7.95 (m, 2H), 7.95 – 7.91 (m, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.64 – 6.59 (m, 1H), 5.87 – 5.80 (m, 1H), 4.83 (d, J = 6.2 Hz, 2H).

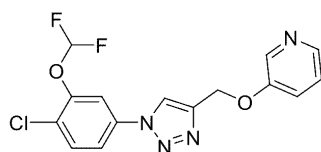
[0625] 실시예 4. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0626]

[0627] THF (4.5 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6, 180 mg, 0.69 mmol), 피리딘-2-올 (66 mg, 0.69 mmol) 및 트라이페닐포스핀 (182 mg, 0.69 mmol)의 용액에 DBAD (160 mg, 0.69 mmol)를 첨가하였다. 생성된 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 용매를 감압 하에 제거하였다. 정제 (FCC, SiO₂, 헵탄/EtOAc (0 내지 80%))에 의해, 표제 화합물 (28 mg, 11%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₅H₁₁F₃N₄O₂에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.37 – 8.12 (m, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 2.5, 6.7 Hz, 1H), 7.66 – 7.51 (m, 2H), 7.34 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.92 (ddd, J = 0.7, 5.2, 7.1 Hz, 1H), 6.85 – 6.40 (m, 2H), 5.60 (s, 2H). 1-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2(1H)-온 (75 mg, 32%)을 또한 얻었다.

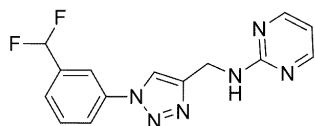
[0628] 실시예 5. 3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]-1H-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0629]

[0630] DMF (0.7 mL) 중의 피리딘-3-올 (11 mg, 0.12 mmol) 및 K₂CO₃ (64 mg, 0.46 mmol)의 용액에 DMF (0.5 mL) 중의 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4, 41 mg, 0.14 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반하였다. 완료시, 반응 혼합물을 H₂O 및 EtOAc로 희석하였다. 수층을 추가로 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 (Na₂SO₄), 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헵탄 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (24 mg, 58% 수율)을 얻었다. MS (ESI): C₁₅H₁₁ClF₂N₄O₂에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.42 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 8.27 (dd, J = 4.6, 1.4 Hz, 1H), 8.14 – 8.04 (m, 1H), 7.78 – 7.69 (m, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 1H), 7.60 – 7.56 (m, 1H), 7.40 – 7.33 (m, 1H), 7.31 – 7.21 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.34 (s, 2H).

[0631] 실시예 6. N-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민.

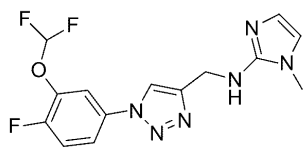


[0632]

[0633] (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 17, 32.4 mg, 0.145 mmol), 2-클로로피리미딘 (21.5 mg, 0.188 mmol), TEA (0.03 mL, 0.217 mmol) 및 EtOH (0.723 mL)을 마이크로파 바이알에서 배합하였다. 바이알을 N₂로 퍼징하고, 밀봉하여, 마이크로파 반응기에서 120℃에서 2시간 동안, 이어서 150℃에서 10분 동안 가열하였다. 조반응 혼합물을 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, DCM 중의 0 내지 8% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (21.3 mg, 49%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₄H₁₂F₂N₆에 대한 질량 계산치, 302.1; m/z 실측치, 303.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.33 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.00 (s, 1H), 7.92 – 7.82 (m, 2H), 7.68 – 7.55 (m, 2H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 6.61 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.66 (s, 1H), 4.83

(d, $J = 6.2$ Hz, 2H).

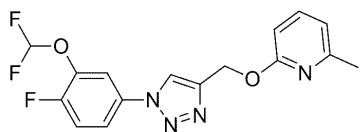
[0634] 실시예 7. *N*-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-이미다졸-2-아민.



[0635]

[0636] N_2 분위기 하에 tBuOH (4 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 18, 50 mg, 0.17 mmol) 및 2-브로모-1-메틸-1*H*-이미다졸의 용액에 2-다이-*tert*-부틸포스포노-2',4',6'-트리아이소프로필바이페닐 (14.4 mg, 0.033 mmol), 트리스(다이벤질리덴아세톤)다이팔라듐(0) (15.5 mg, 0.017 mmol) 및 칼륨 *tert*-부톡사이드 (76 mg, 0.68 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 110°C에서 96시간 동안 교반하였다. 생성된 고체를 여과하여, 용매를 감압 하에 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc / 헵탄 0 내지 100%; 이어서 MeOH/DCM 0 내지 90%)한 후, 추가로 정제하여 (RP HPLC; 고정상: C^{18} 엑스브리지 30×100 mm 5 μ m), 이동상: 수중의 81% 10mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 19% CH_3CN 내지 수중의 64% 10mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 36% CH_3CN 의 그라디언트), 백색 고체로서의 표제 화합물 (11 mg, 19%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 338.1; m/z 실측치, 339.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 3.38 (s, 3H) 4.13 - 4.31 (m, 1H) 4.70 (d, $J = 6.24$ Hz, 2H) 6.63 (t, $J = 72.83$ Hz, 1H) 6.53 (d, $J = 1.39$ Hz, 1H) 6.69 (d, $J = 1.39$ Hz, 1H) 7.32 (t, $J = 9.25$ Hz, 1H) 7.51 - 7.61 (m, 1H) 7.68 (dd, $J = 6.70, 2.54$ Hz, 1H) 8.08 (s, 1H).

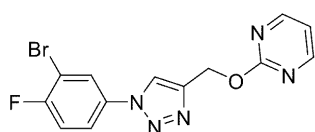
[0637] 실시예 8. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘.



[0638]

[0639] 1,4-다이옥산 (2 mL) 중의 2-브로모-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘 (중간체 7, 75 mg, 0.18 mmol)의 용액에 트라이메틸보록신 (0.03 mL, 0.21 mmol), Cs_2CO_3 (118 mg, 0.36 mmol) 및 (2-다이사이클로헥실포스포노-2',4',6'-트리아이소프로필-1,1'-바이페닐)[2-(2'-아미노-1,1'-바이페닐)]팔라듐(II) 메탄설포네이트 (15.3 mg, 0.018 mmol)를 N_2 분위기 하에 밀봉관에 첨가하였다. 혼합물을 마이크로파 조사 하에 12분 동안 120°C로 가열하였다. 혼합물을 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헵탄 중의 EtOAc 0 내지 100%)에 의해, 표제 화합물을 얻었다. 표제 화합물을 추가로 정제하여 (RP HPLC, 고정상: ^{18}C 엑스브리지 30×100 mm 5 μ m), 이동상: 수중의 90% 10 mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 10% CH_3CN 내지 수중의 0% 10 mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 100% CH_3CN 의 그라디언트), 표제 화합물 (39 mg, 61%)을 얻었다. HRMS = 350.099. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 2.49 (s, 3 H) 5.59 (s, 2 H) 6.49 - 6.81 (m, 1 H) 6.61 (d, $J = 8.1$ Hz, 1 H) 6.77 (d, $J = 7.2$ Hz, 1 H) 7.35 (t, $J = 9.2$ Hz, 1 H) 7.49 (dd, $J = 8.2, 7.4$ Hz, 1 H) 7.59 (ddd, $J = 9.0, 3.9, 2.7$ Hz, 1 H) 7.70 (dd, $J = 6.4, 2.6$ Hz, 1 H) 8.04 (s, 1 H).

[0640] 실시예 9. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

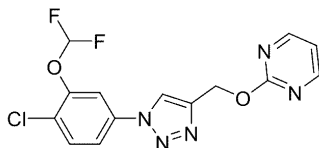


[0641]

[0642] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 349.0;

m/z 실측치, 350.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 8.09 – 8.08 (m, 1H), 7.99 (dd, J = 5.8, 2.7 Hz, 1H), 7.67 (ddd, J = 8.9, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.30 – 7.28 (m, 1H), 7.00 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.68 – 5.65 (m, 2H).

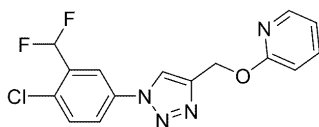
[0643] 실시예 10. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0644]

[0645] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.20 – 8.04 (m, 1H), 7.73 – 7.68 (m, 1H), 7.65 – 7.60 (m, 1H), 7.59 – 7.55 (m, 1H), 7.03 – 6.90 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.67 (s, 2H).

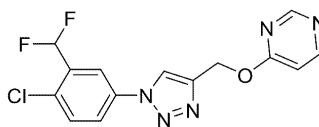
[0646] 실시예 11. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0647]

[0648] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_2N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 336.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.21 (ddd, J = 5.0, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.02 – 7.99 (m, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 2H), 7.14 – 6.85 (m, 1H), 6.95 – 6.90 (m, 1H), 6.81 (dt, J = 8.3, 0.9 Hz, 1H), 5.64 – 5.57 (m, 2H).

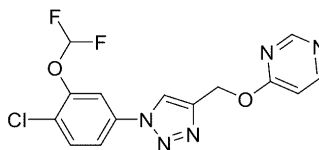
[0649] 실시예 12. 4-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0650]

[0651] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 4-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.85 (s, 1H), 8.48 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 1H), 7.00 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 5.8, 1.2 Hz, 1H), 5.67 (s, 2H).

[0652] 실시예 13. 4-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

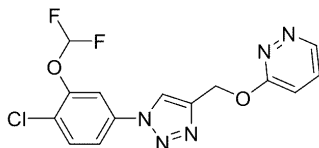


[0653]

[0654] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 4-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계

산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.83 (s, 1H), 8.47 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.73 - 7.67 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 5.9, 1.2 Hz, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.65 (s, 2H).

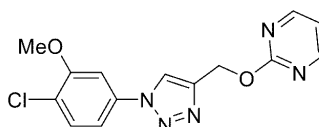
[0655] 실시예 14. 3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리다진.



[0656]

[0657] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 3-클로로피리다진을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.47 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.74 - 7.68 (m, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.80 (dd, J = 5.9, 1.2 Hz, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.65 (s, 2H).

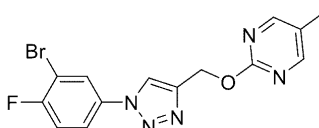
[0658] 실시예 15. 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0659]

[0660] (1-(4-클로로-3-메톡시페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로피리미딘 (중간체 15) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 7.06 - 6.95 (m, 1H), 5.67 (s, 2H), 3.99 (s, 3H).

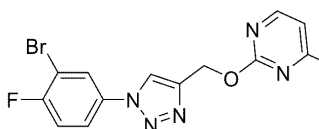
[0661] 실시예 16. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0662]

[0663] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 363.0; m/z 실측치, 363.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.98 (dd, J = 5.8, 2.7 Hz, 1H), 7.67 (ddd, J = 8.9, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.30 - 7.27 (m, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.26 (s, 3H).

[0664] 실시예 17. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.

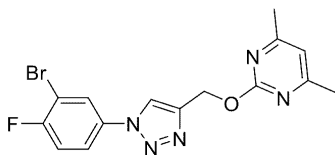


[0665]

[0666] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치,

363.0; m/z 실측치, 363.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.99 (dd, J = 5.8, 2.6 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.8, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.31 – 7.28 (m, 1H), 6.87 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.50 (s, 3H).

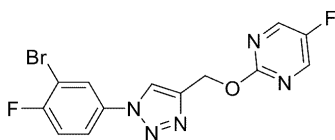
[0667] 실시예 18. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘.



[0668]

[0669] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-4,6-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.08 (s, 1H), 7.99 (dd, J = 5.8, 2.7 Hz, 1H), 7.66 (ddd, J = 8.9, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.33 – 7.27 (m, 1H), 6.73 (s, 1H), 5.64 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.44 (s, 6H).

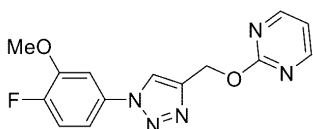
[0670] 실시예 19. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[0671]

[0672] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8BrF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.0; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.98 (dd, J = 5.8, 2.7 Hz, 1H), 7.67 (ddd, J = 8.9, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.29 (dd, J = 8.9, 7.8 Hz, 1H), 5.63 (s, 2H).

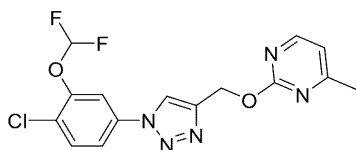
[0673] 실시예 20. 2-[[1-(4-플루오로-3-메톡시-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0674]

[0675] (1-(4-플루오로-3-메톡시페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실측치, 302.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.46 (dd, J = 7.4, 2.5 Hz, 1H), 7.23 – 7.12 (m, 2H), 7.05 – 6.94 (m, 1H), 5.66 (s, 2H), 3.97 (s, 3H).

[0676] 실시예 21. 2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.

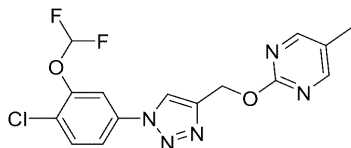


[0677]

[0678] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한

질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.74 - 7.65 (m, 1H), 7.63 - 7.58 (m, 1H), 7.60 - 7.52 (m, 1H), 6.86 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.48 (s, 3H).

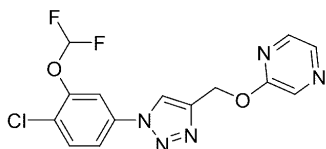
[0679] 실시예 22. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0680]

[0681] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.37 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.75 - 7.67 (m, 1H), 7.64 - 7.58 (m, 2H), 7.58 - 7.53 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 2.25 (s, 3H).

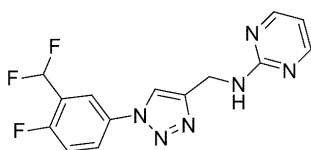
[0682] 실시예 23. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피라진.



[0683]

[0684] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-플루오로피라진을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.30 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.19 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 8.13 (dd, J = 2.8, 1.4 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.74 - 7.68 (m, 1H), 7.65 - 7.60 (m, 1H), 7.60 - 7.55 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.61 (s, 2H).

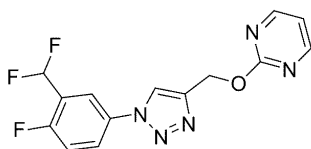
[0685] 실시예 24. N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



[0686]

[0687] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 3, 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 320.1; m/z 실측치, 321.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.82 (d, J = 6.01 Hz, 2H), 5.80 (br s, 1H), 6.60 (t, J = 4.62 Hz, 1H), 6.75 - 7.15 (m, 1H), 7.30 (br t, J = 8.90 Hz, 1H), 7.77 - 7.93 (m, 2H), 7.97 (s, 1H), 8.33 (d, J = 4.62 Hz, 2H).

[0688] 실시예 25. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

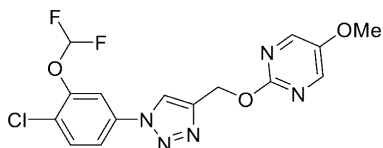


[0689]

[0690] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로피리미딘

을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 321.1; m/z 실측치, 322.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.67 (s, 2H), 6.78 - 7.12 (m, 2H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.82 - 8.01 (m, 2H), 8.14 (s, 1H), 8.58 (d, J = 4.6 Hz, 2H).

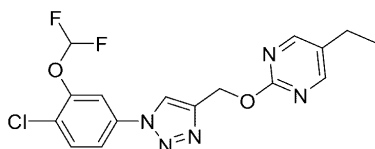
[0691] 실시예 26. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0692]

[0693] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.15 - 8.08 (m, 1H), 7.74 - 7.67 (m, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.55 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 (s, 3H).

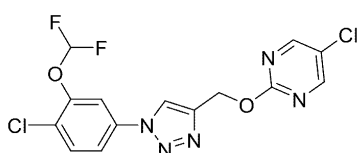
[0694] 실시예 27. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0695]

[0696] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 4.40 (s, 2H), 8.21 - 8.00 (m, 1H), 7.79 - 7.67 (m, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.61 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

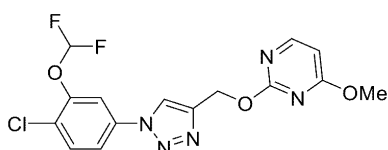
[0697] 실시예 28. 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0698]

[0699] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9Cl_2F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.16 - 8.02 (m, 1H), 7.73 - 7.68 (m, 1H), 7.65 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.53 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H).

[0700] 실시예 29. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘.

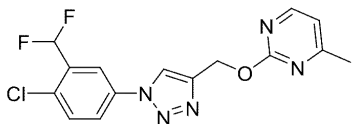


[0701]

[0702] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-4-메톡시

피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.22 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.75 – 7.68 (m, 1H), 7.63 – 7.59 (m, 1H), 7.58 – 7.53 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 6.43 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 3.98 (s, 3H).

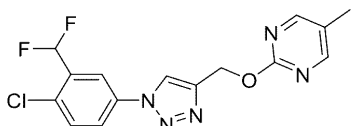
[0703] 실시예 30. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[0704]

[0705] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.90 – 7.86 (m, 1H), 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.12 – 6.84 (m, 2H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.49 (s, 3H).

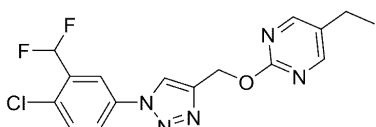
[0706] 실시예 31. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0707]

[0708] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.84 (m, 1H), 7.66 – 7.55 (m, 1H), 6.99 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.63 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H).

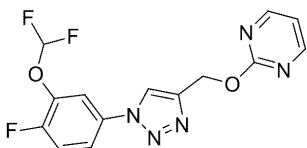
[0709] 실시예 32. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0710]

[0711] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (s, 1H), 8.17 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.63 – 7.59 (m, 1H), 6.99 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.61 (q, J = 7.6 Hz, 3H), 1.27 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

[0712] 실시예 33. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

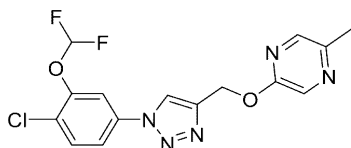


[0713]

[0714] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-플루오로피리

미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.58 (d, $J = 4.9$ Hz, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.70 (dd, $J = 2.7, 6.6$ Hz, 1H), 7.65 - 7.54 (m, 1H), 7.35 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 7.02 (t, $J = 4.7$ Hz, 1H), 6.65 (t, $J = 72.6$ Hz, 1H), 5.66 (s, 2H).

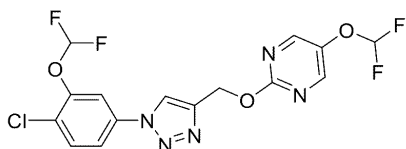
[0715] 실시예 34. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진.



[0716]

[0717] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-메틸피라진을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 8.11 - 8.04 (m, 1H), 8.01 - 7.94 (m, 1H), 7.74 - 7.68 (m, 1H), 7.65 - 7.58 (m, 1H), 7.59 - 7.55 (m, 1H), 6.64 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.57 (s, 2H), 2.49 (s, 3H).

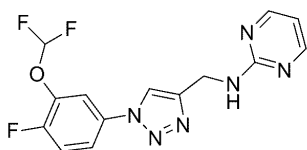
[0718] 실시예 35. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘.



[0719]

[0720] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_4N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 419.0; m/z 실측치, 420.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.75 - 7.69 (m, 1H), 7.65 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.55 (m, 1H), 6.64 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 6.53 (t, $J = 71.9$ Hz, 1H), 5.65 (s, 2H).

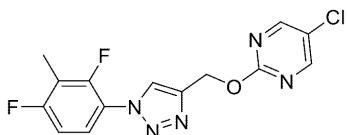
[0721] 실시예 36. N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



[0722]

[0723] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 18) 및 2-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 6과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.33 (d, $J = 4.9$ Hz, 2H), 7.93 (s, 1H), 7.67 (dd, $J = 2.5, 6.5$ Hz, 1H), 7.56 (ddd, $J = 2.7, 3.9, 9.0$ Hz, 1H), 7.33 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 6.61 (s, 2H), 5.81 - 5.57 (m, 1H), 4.82 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H).

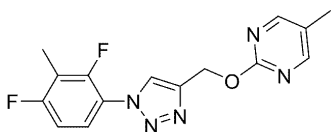
[0724] 실시예 37. 5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0725]

[0726] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.50 (s, 2H), 8.13 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 7.73 – 7.66 (m, 1H), 7.07 – 6.99 (m, 1H), 5.68 – 5.62 (m, 2H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H).

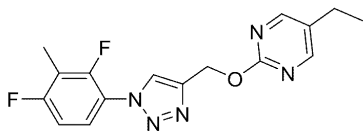
[0727] 실시예 38. 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0728]

[0729] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 8.15 – 8.11 (m, 1H), 7.69 (td, $J = 8.6, 5.7$ Hz, 1H), 7.02 (td, $J = 8.7, 1.8$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H), 2.25 (t, $J = 0.7$ Hz, 3H).

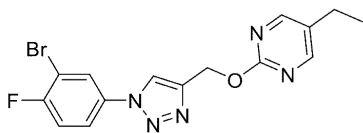
[0730] 실시예 39. 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0731]

[0732] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.9$ Hz, 1H), 7.73 – 7.66 (m, 1H), 7.02 (td, $J = 8.6, 1.9$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.63 – 2.57 (m, 2H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H), 1.26 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

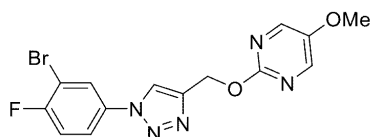
[0733] 실시예 40. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0734]

[0735] DMF 대신에 THF 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (s, 2H), 8.08 (s, 1H), 7.99 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (ddd, $J = 8.9, 4.1, 2.7$ Hz, 1H), 7.31 – 7.27 (m, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.61 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.27 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

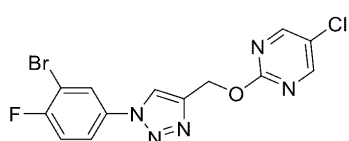
[0736] 실시예 41. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0737]

[0738] (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}BrFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.0; m/z 실측치, 380.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (ddd, $J = 8.9, 4.1, 2.6$ Hz, 1H), 7.31 – 7.27 (m, 1H), 5.60 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.88 (s, 3H).

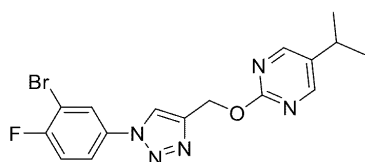
[0739] 실시예 42. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-클로로-피리미딘.



[0740]

[0741] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8BrClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 383.0; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.29 (dd, $J = 9.0, 7.9$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

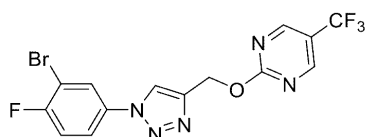
[0742] 실시예 43. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.



[0743]

[0744] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 391.0; m/z 실측치, 392.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.42 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 8.08 (s, 1H), 7.99 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.31 – 7.28 (m, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.97 – 2.87 (m, 1H), 1.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 6H).

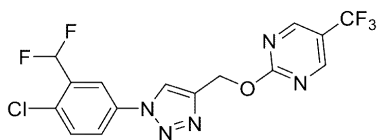
[0745] 실시예 44. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[0746]

[0747] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8BrF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 417.0; m/z 실측치, 418.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.82 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.99 (dd, $J = 5.7, 2.7$ Hz, 1H), 7.68 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.29 (dd, $J = 8.9, 7.8$ Hz, 1H), 5.73 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H).

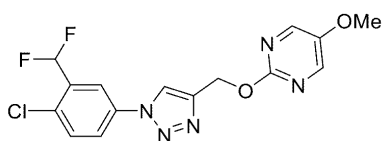
[0748] 실시예 45. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[0749]

[0750] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9ClF_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 405.0; m/z 실측치, 406.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.82 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 8.18 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.00 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.74 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

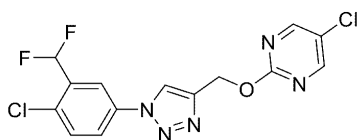
[0751] 실시예 46. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0752]

[0753] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.91 – 7.86 (m, 1H), 7.61 (dt, J = 8.7, 1.2 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H).

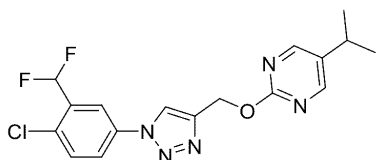
[0754] 실시예 47. 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0755]

[0756] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_6Cl_2F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 1H), 7.00 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

[0757] 실시예 48. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.

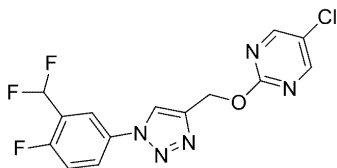


[0758]

[0759] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.90 – 7.87 (m, 1H), 7.61

(d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.99 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.97 – 2.88 (m, 1H), 1.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 6H).

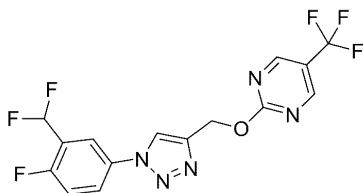
[0760] 실시예 49. 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0761]

[0762] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 355.0; m/z 실측치, 356.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.66 (s, 2H), 6.96 (t, $J = 55.02$ Hz, 1H), 7.34 (t, $J = 9.02$ Hz, 1H), 7.77 – 8.03 (m, 2H), 8.13 (s, 1H), 8.52 (s, 2H).

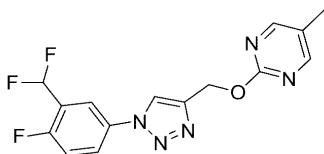
[0763] 실시예 50. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[0764]

[0765] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 389.1; m/z 실측치, 390.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.75 (s, 2H), 6.96 (t, $J = 54.56$ Hz, 1H), 7.35 (t, $J = 9.02$ Hz, 1H), 7.76 – 8.05 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.83 (s, 2H).

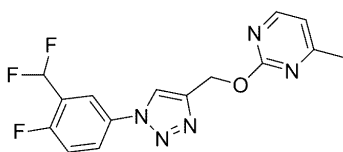
[0766] 실시예 51. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0767]

[0768] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 336.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.27 (s, 3H), 5.65 (s, 2H), 6.96 (t, $J = 54.56$ Hz, 1H), 7.33 (t, $J = 8.90$ Hz, 1H), 7.69 – 8.03 (m, 2H), 8.14 (s, 1H), 8.39 (s, 2H).

[0769] 실시예 52. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.

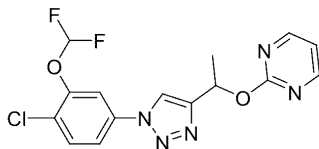


[0770]

[0771] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중

간체 9) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 336.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.50 (s, 3H), 5.67 (s, 2H), 6.96 (t, J = 54.56 Hz, 1H), 6.87 (d, J = 4.85 Hz, 1H), 7.33 (t, J = 9.02 Hz, 1H), 7.86 – 7.93 (m, 1H), 7.96 (dd, J = 5.66, 2.66 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 8.41 (d, J = 4.85 Hz, 1H).

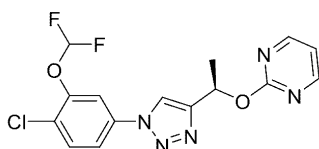
[0772] 실시예 53. (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[0773]

[0774] R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 2) 및 2-클로로 피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.10 – 8.02 (m, 1H), 7.72 – 7.64 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.58 – 7.53 (m, 1H), 7.00 – 6.93 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 6.51 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 1.85 (d, J = 6.6 Hz, 3H).

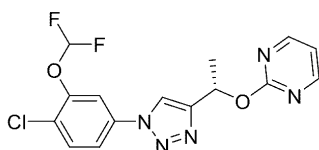
[0775] 실시예 54. (R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[0776]

[0777] SFC 정제 (고정상: 키랄팩(Chiralpak) IF 5 μm 250 $\times$ 21 mm, 이동상: 20% 메탄올, 80% CO_2) 거울상 이성질체 순도 (SFC/ 키랄팩 IF): 100%. 체류 시간: 5.40분. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.11 – 7.96 (m, 1H), 7.73 – 7.65 (m, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 1H), 7.57 – 7.52 (m, 1H), 7.01 – 6.91 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 6.51 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 1.85 (d, J = 6.6 Hz, 3H).

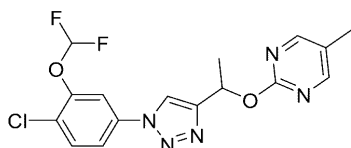
[0778] 실시예 55. (S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[0779]

[0780] SFC 정제 (고정상: 키랄팩 IF 5 μm 250 $\times$ 21 mm, 이동상: 20% 메탄올, 80% CO_2) 거울상 이성질체 순도 (SFC/ 키랄팩 IF): 99.6%. 체류 시간: 7.05분. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.11 – 7.97 (m, 1H), 7.75 – 7.65 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.57 – 7.53 (m, 1H), 7.01 – 6.92 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 6.51 (q, J = 6.6 Hz, 1H), 1.85 (d, J = 6.6 Hz, 3H).

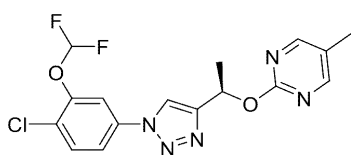
[0781] 실시예 56. (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0782]

[0783] R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 2) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.35 (s, 2H), 8.09 - 7.99 (m, 1H), 7.74 - 7.66 (m, 1H), 7.62 - 7.57 (m, 1H), 7.57 - 7.52 (m, 1H), 6.84 - 6.42 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.84 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H). 실시예 56을 키랄(Chiral) SFC 정제 [고정상: 키랄팩 IF ($5\mu m$, 4.6×250 mm), 이동상: 25% MeOH: 75% CO_2]를 거쳐, 대응하는 단일 거울상 이성질체 (실시예 57 및 실시예 58)를 얻고, 절대 입체화합은 결정되지 않았다. 거울상 이성질체 순도를 키랄팩 IF 컬럼 ($5\mu m$ 4.6×250 mm), 이동상: 25% MeOH: 75% CO_2 및 유량: 2 mL/min을 사용하여 7분에 걸쳐서 (온도 = $35^\circ C$) 분석 SFC에 의해 확인하였다. 용리를 254 nm에서의 흡광도에 따라 모니터링하였다.

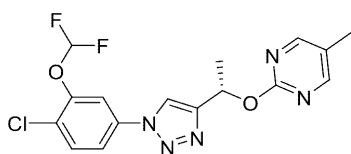
[0784] 실시예 57. (R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0785]

[0786] 거울상 이성질체 순도 (SFC/ 키랄팩 IF): 100%. 체류 시간: 5.93분. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.35 (s, 2H), 8.05 - 8.01 (m, 1H), 7.71 - 7.66 (m, 1H), 7.62 - 7.57 (m, 1H), 7.57 - 7.51 (m, 1H), 6.82 - 6.41 (m, 2H), 2.24 (s, 3H), 1.84 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

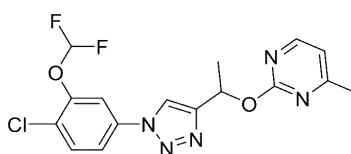
[0787] 실시예 58. (S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0788]

[0789] 거울상 이성질체 순도 (SFC/ 키랄팩 IF): 100%. 체류 시간: 8.74분. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.34 (s, 2H), 8.13 - 7.97 (m, 1H), 7.73 - 7.65 (m, 1H), 7.60 - 7.57 (m, 1H), 7.57 - 7.52 (m, 1H), 6.84 - 6.39 (m, 2H), 2.23 (s, 3H), 1.83 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

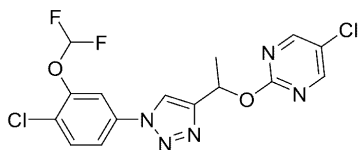
[0790] 실시예 59. (R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-4-메틸-피리미딘.



[0791]

[0792] R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 2) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.36 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.04 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.70 - 7.65 (m, 1H), 7.61 - 7.58 (m, 1H), 7.57 - 7.53 (m, 1H), 6.86 - 6.79 (m, 1H), 6.62 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 6.53 (q, $J = 6.6$ Hz, 1H), 2.47 (s, 3H), 1.83 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

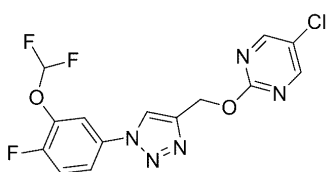
[0793] 실시예 60. (R/S)-5-클로로-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[0794]

[0795] R/S-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 2) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}Cl_2F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 401.0; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.47 (s, 2H), 8.02 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.72 - 7.65 (m, 1H), 7.63 - 7.58 (m, 1H), 7.57 - 7.52 (m, 1H), 6.63 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 6.44 (q, $J = 6.6$ Hz, 1H), 1.85 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

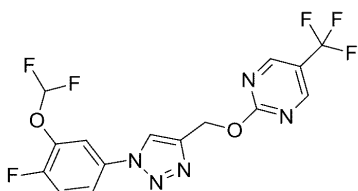
[0796] 실시예 61. 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0797]

[0798] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.01 - 2.06 (m, 1H), 4.08 - 4.15 (m, 1H), 5.64 (s, 2H), 6.64 (t, $J = 72.36$ Hz, 1H), 7.35 (t, $J = 9.13$ Hz, 1H), 7.58 (ddd, $J = 8.90, 3.81, 2.77$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 6.70, 2.54$ Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.51 (s, 2H).

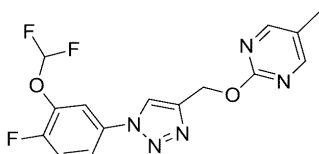
[0799] 실시예 62. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[0800]

[0801] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9F_6N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 405.1; m/z 실측치, 406.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.81 (s, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.69 (dd, $J = 2.4, 6.6$ Hz, 1H), 7.59 (br d, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.34 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 6.65 (t, $J = 72.1$ Hz, 1H), 5.72 (s, 2H).

[0802] 실시예 63. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

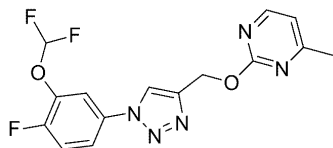


[0803]

[0804] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.69 (dd, $J = 2.5, 6.5$ Hz, 1H), 7.58 (td, $J = 3.2, 8.9$ Hz, 1H), 7.34 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 6.64 (t, $J = 72.4$ Hz, 1H), 5.83 - 5.41 (m, 2H), 2.26 (s, 3H).

[0805] 실시예 64. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.

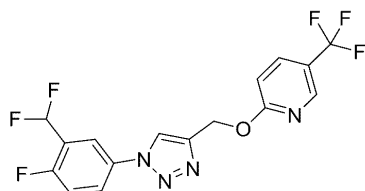


[0806]

[0807] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.70 (dd, $J = 2.5, 6.5$ Hz, 1H), 7.64 - 7.51 (m, 1H), 7.34 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 6.87 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 6.65 (t, $J = 72.6$ Hz, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.50 (s, 3H).

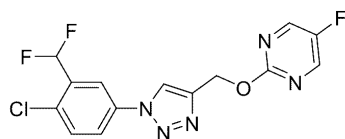
[0808] 실시예 65. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘.



[0809]

[0810] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{10}F_6N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 388.1; m/z 실측치, 389.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.66 (s, 2H), 6.73 - 7.14 (m, 2H), 7.33 (t, $J = 9.02$ Hz, 1H), 7.81 (dd, $J = 8.67, 2.43$ Hz, 1H), 7.86 - 7.99 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.50 (s, 1H).

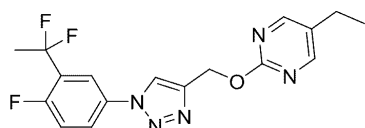
[0811] 실시예 66. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[0812]

[0813] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 355.0; m/z 실측치, 356.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.01 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.91 - 7.86 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 6.99 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

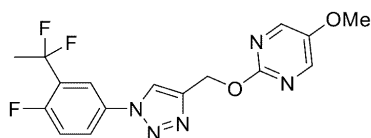
[0814] 실시예 67. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0815]

[0816] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (s, 2H), 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.80 (m, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 1H), 5.74 – 5.55 (m, 2H), 2.70 – 2.52 (m, 2H), 2.05 (t, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H), 1.27 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

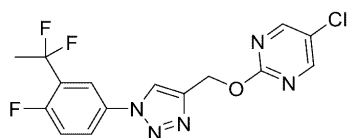
[0817] 실시예 68. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0818]

[0819] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.11 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.89 (dd, $J = 6.2, 2.8$ Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.30 (dd, $J = 9.8, 8.8$ Hz, 1H), 5.61 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 2.05 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

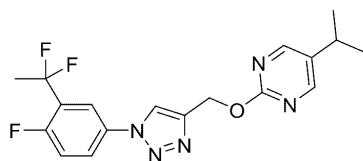
[0820] 실시예 69. 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0821]

[0822] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.11 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.89 (dd, $J = 6.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.84 (d, $J = 12.9$ Hz, 1H), 7.31 (dd, $J = 9.8, 8.9$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.05 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

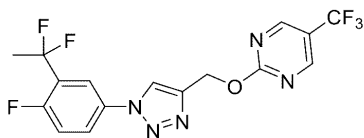
[0823] 실시예 70. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.



[0824]

[0825] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.42 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.90 (dd, $J = 6.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.87 – 7.81 (m, 1H), 7.35 – 7.27 (m, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.92 (t, $J = 7.0$ Hz, 1H), 2.05 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 6H), 1.30 (d, $J = 7.0$ Hz, 3H).

[0826] 실시예 71. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



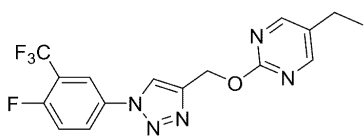
[0827]

[0828]

DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 403.1; m/z 실측치, 404.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.85 – 8.78 (m, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.81 (m, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 1H), 5.74 (s, 2H), 2.05 (td, J = 18.6, 1.2 Hz, 3H).

[0829]

실시예 72. 5-에틸-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



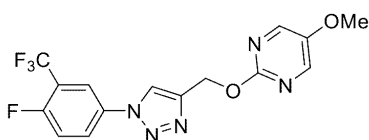
[0830]

[0831]

DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (t, J = 0.7 Hz, 2H), 8.14 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.70 – 2.54 (m, 2H), 1.27 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

[0832]

실시예 73. 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



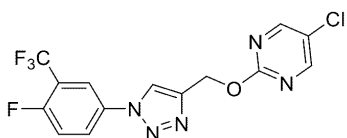
[0833]

[0834]

DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.16 – 8.09 (m, 1H), 8.04 – 7.98 (m, 1H), 7.99 – 7.93 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.61 (s, 2H), 3.88 (s, 3H).

[0835]

실시예 74. 5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



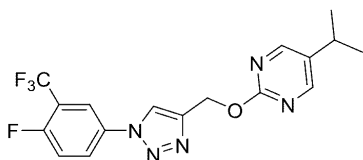
[0836]

[0837]

DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 373.0; m/z 실측치, 374.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.16 – 8.11 (m, 1H), 8.04 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.41 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

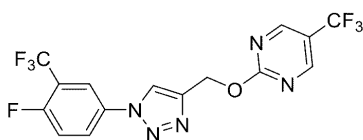
[0838]

실시예 75. 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.



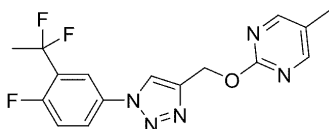
[0841]

[0842]



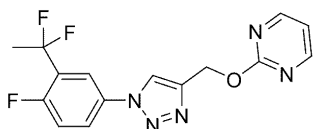
[0844]

[0845]



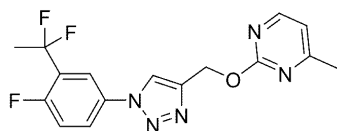
[0847]

[0848]



- 135 -

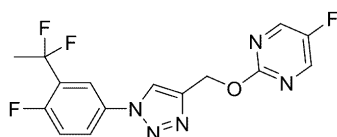
[0850] 실시예 79. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[0851]

[0852] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.41 (t, $J = 5.3$ Hz, 1H), 8.13 (s, 1H), 7.96 – 7.77 (m, 2H), 7.36 – 7.28 (m, 2H), 6.86 (d, $J = 5.3$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 3.5$ Hz, 2H), 2.66 – 2.31 (m, 2H), 2.05 (t, $J = 18.3$ Hz, 3H).

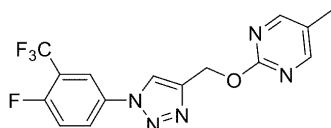
[0853] 실시예 80. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[0854]

[0855] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.11 (s, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.81 (m, 1H), 7.31 (t, $J = 9.4$ Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.16 – 1.96 (m, 3H).

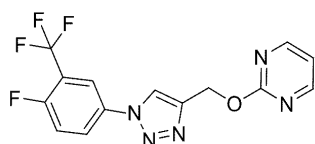
[0856] 실시예 81. 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0857]

[0858] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (d, $J = 1.2$ Hz, 2H), 8.13 (s, 1H), 8.04 – 7.92 (m, 2H), 7.40 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 5.68 – 5.60 (m, 2H), 2.34 – 2.18 (m, 3H).

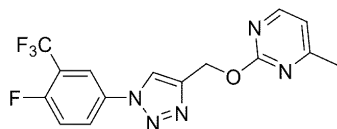
[0859] 실시예 82. 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0860]

[0861] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 – 8.54 (m, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.08 – 7.89 (m, 2H), 7.40 (t, $J = 9.2$ Hz, 1H), 7.01 (t, $J = 4.7$ Hz, 1H), 5.68 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H).

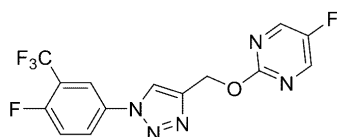
[0862] 실시예 83. 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[0863]

[0864] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, $J = 5.2$ Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 – 7.90 (m, 2H), 7.40 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 6.87 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.50 (d, $J = 2.5$ Hz, 3H).

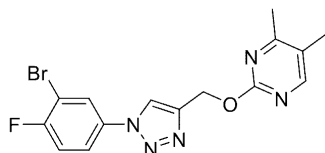
[0865] 실시예 84. 5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0866]

[0867] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.44 (d, $J = 3.1$ Hz, 2H), 8.13 (s, 1H), 8.07 – 7.90 (m, 2H), 7.41 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 3.0$ Hz, 2H).

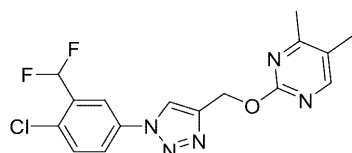
[0868] 실시예 85. 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[0869]

[0870] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}BrFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 (s, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.66 (ddd, $J = 8.9, 4.1, 2.7$ Hz, 1H), 7.30 – 7.27 (m, 1H), 5.62 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

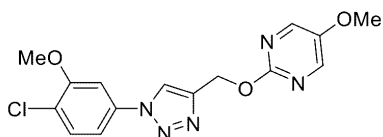
[0871] 실시예 86. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[0872]

[0873] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.22 – 8.20 (m, 1H), 8.17 – 8.16 (m, 1H), 8.00 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.90 – 7.86 (m, 1H), 7.62 – 7.58 (m, 1H), 6.99 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

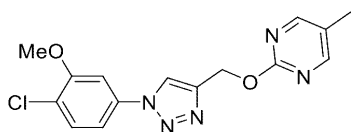
[0874] 실시예 87. 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0875]

[0876] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-메톡시페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 15) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}ClN_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.15 - 8.04 (m, 1H), 7.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 5.60 (s, 2H), 3.99 (s, 3H), 3.88 (s, 3H).

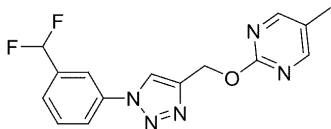
[0877] 실시예 88. 2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0878]

[0879] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(4-클로로-3-메톡시페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 15) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}ClN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.23 - 8.08 (m, 1H), 7.49 (d, J = 8.5 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.16 (dd, J = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 3.99 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).

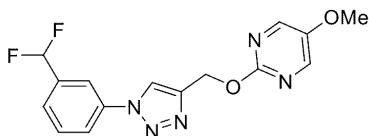
[0880] 실시예 89. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0881]

[0882] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 12) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.92 - 7.89 (m, 1H), 7.88 - 7.85 (m, 1H), 7.66 - 7.60 (m, 1H), 7.60 - 7.56 (m, 1H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.28 - 2.23 (m, 3H).

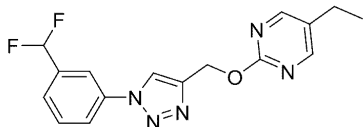
[0883] 실시예 90. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[0884]

[0885] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 12) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.91 - 7.89 (m, 1H), 7.88 - 7.85 (m, 1H), 7.65 - 7.60 (m, 1H), 7.60 - 7.55 (m, 1H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.87 (s, 3H).

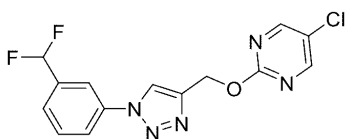
[0886] 실시예 91. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[0887]

[0888] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 12) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.91 – 7.88 (m, 1H), 7.87 – 7.83 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 1H), 7.58 – 7.54 (m, 1H), 6.71 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.63 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.59 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 1.24 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

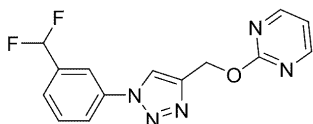
[0889] 실시예 92. 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0890]

[0891] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 12) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.50 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.88 – 7.85 (m, 1H), 7.66 – 7.61 (m, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 1H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

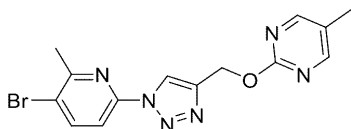
[0892] 실시예 93. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[0893]

[0894] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 12) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.56 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.18 (s, 1H), 7.91 – 7.89 (m, 1H), 7.88 – 7.84 (m, 1H), 7.65 – 7.60 (m, 1H), 7.59 – 7.56 (m, 1H), 6.99 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

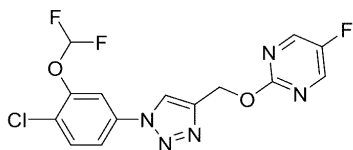
[0895] 실시예 94. 2-[[1-(5-브로모-6-메틸피리딘-2-일)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[0896]

[0897] DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(5-브로모-6-메틸피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}BrN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 360.0; m/z 실측치 361.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 1H), 8.39 – 8.36 (m, 2H), 8.00 – 7.96 (m, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 5.63 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.68 (s, 3H), 2.25 (s, 3H).

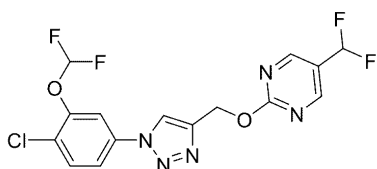
[0898] 실시예 95. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[0899]

[0900] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.14 - 8.09 (m, 1H), 7.72 - 7.66 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.64 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H).

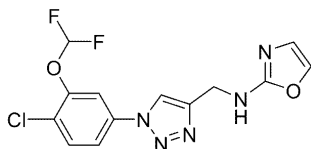
[0901] 실시예 96. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[0902]

[0903] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 403.1; m/z 실측치, 404.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 - 8.63 (m, 2H), 8.22 - 8.07 (m, 1H), 7.75 - 7.64 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.54 (m, 1H), 6.73 (t, $J = 55.6$ Hz, 1H), 6.64 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.71 (s, 2H).

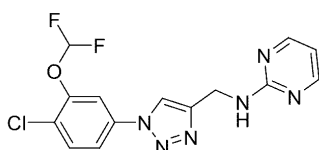
[0904] 실시예 97. N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메틸]옥사졸-2-아민.



[0905]

[0906] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르보알데하이드 및 옥사졸-2-아민을 사용하여, 실시예 2와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 341.0; m/z 실측치, 342.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 - 7.97 (m, 1H), 7.74 - 7.64 (m, 1H), 7.65 - 7.51 (m, 2H), 7.22 - 7.14 (m, 1H), 6.87 - 6.40 (m, 2H), 5.30 (s, 1H), 4.70 (d, $J = 5.7$ Hz, 2H).

[0907] 실시예 98. N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.

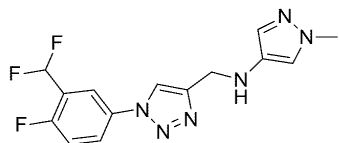


[0908]

[0909] 단계 A에서 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 단계 B에서 피리미딘-2-아민을 사용하여, 실시예 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.33 (d, $J =$

4.8 Hz, 2H), 8.00 - 7.92 (m, 1H), 7.72 - 7.68 (m, 1H), 7.62 - 7.57 (m, 1H), 7.56 - 7.52 (m, 1H), 6.89 - 6.34 (m, 2H), 4.82 (dd, $J = 6.2, 0.7$ Hz, 2H).

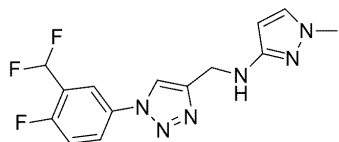
[0910] 실시예 99. *N*-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민.



[0911]

[0912] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 단계 B에서 1-메틸-1H-피라졸-4-아민을 사용하여, 실시예 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, 323.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 3.48 (br s, 1H), 3.80 (s, 3H), 4.37 (s, 2H), 6.75 - 7.10 (m, 2H), 7.17 (s, 1H), 7.32 (br t, $J = 9.02$ Hz, 1H), 7.75 - 8.05 (m, 3H).

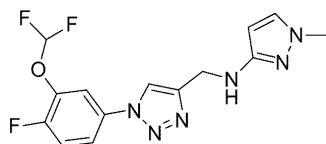
[0913] 실시예 100. *N*-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민.



[0914]

[0915] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 단계 B에서 1-메틸-1H-피라졸-3-아민을 사용하여, 실시예 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, 323.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 3.74 (s, 3H), 4.18 (br s, 1H), 4.56 (br s, 2H), 5.58 (br s, 1H), 6.75 - 7.20 (m, 2H), 7.31 (br t, $J = 9.02$ Hz, 1H), 7.72 - 8.17 (m, 3H).

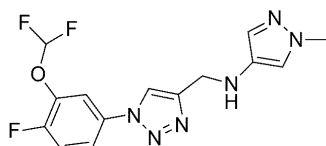
[0916] 실시예 101. *N*-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민.



[0917]

[0918] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 단계 B에서 1-메틸-1H-피라졸-3-아민을 사용하여, 실시예 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 338.1; m/z 실측치, 339.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.91 (s, 1H), 7.67 (br d, $J = 4.2$ Hz, 1H), 7.61 - 7.48 (m, 1H), 7.33 (t, $J = 9.5$ Hz, 1H), 7.12 (br d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 6.64 (t, $J = 72.4$ Hz, 1H), 5.57 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 4.55 (br s, 2H), 4.20 (br s, 1H), 3.74 (s, 3H).

[0919] 실시예 102. *N*-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민.

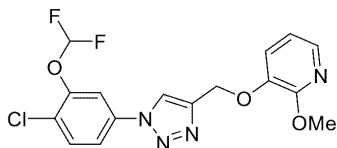


[0920]

[0921] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 단계 B에서 1-메틸-1H-피라졸-4-아민을 사용하여, 실시예 3과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS

(ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 338.1; m/z 실측치, 339.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 7.86 (s, 1H), 7.68 (br d, $J = 4.6$ Hz, 1H), 7.61 - 7.47 (m, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.17 (s, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.87 - 6.40 (m, 1H), 4.36 (s, 2H), 3.80 (d, $J = 0.7$ Hz, 3H).

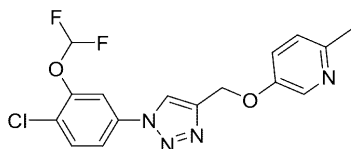
[0922] 실시예 103. 3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘.



[0923]

[0924] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 2-메톡시피리딘-3-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_3$ 에 대한 질량 계산치, 382.1; m/z 실측치, 383.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.10 (s, 1H), 7.79 (dd, $J = 5.0$, 1.5 Hz, 1H), 7.75 - 7.68 (m, 1H), 7.66 - 7.59 (m, 1H), 7.58 - 7.53 (m, 1H), 7.30 (dd, $J = 7.8$, 1.5 Hz, 1H), 6.85 (dd, $J = 7.8$, 5.0 Hz, 1H), 6.63 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.36 (s, 2H), 4.02 (s, 3H).

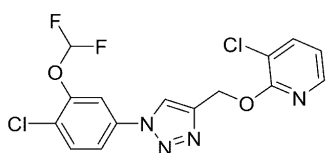
[0925] 실시예 104. 5-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-2-메틸-피리딘.



[0926]

[0927] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 6-메틸피리딘-3-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 367.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz $CDCl_3$) δ 8.29 (d, $J = 3.0$ Hz, 1H), 8.08 - 7.98 (m, 1H), 7.74 - 7.70 (m, 1H), 7.66 - 7.61 (m, 1H), 7.60 - 7.55 (m, 1H), 7.30 - 7.22 (m, 1H), 7.10 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 6.64 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 2.50 (s, 3H).

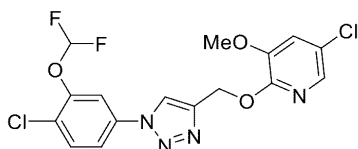
[0928] 실시예 105. 3-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0929]

[0930] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 3-클로로피리딘-2-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}Cl_2F_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 386.0; m/z 실측치, 387.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.10 (dd, $J = 4.9$, 1.7 Hz, 1H), 8.09 - 8.08 (m, 1H), 7.74 - 7.70 (m, 1H), 7.67 (dd, $J = 7.6$, 1.7 Hz, 1H), 7.64 - 7.59 (m, 1H), 7.59 - 7.55 (m, 1H), 6.91 (dd, $J = 7.6$, 4.9 Hz, 1H), 6.64 (t, $J = 72.6$ Hz, 1H), 5.68 (s, 2H).

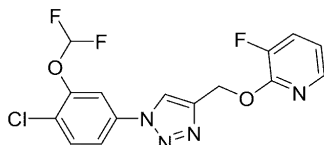
[0931] 실시예 106. 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘.



[0932]

[0933] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 5-클로로-3-메톡시피리딘-2-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}Cl_2F_2N_4O_3$ 에 대한 질량 계산치, 416.0; m/z 실측치, 417.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.07 (s, 1H), 7.72 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.71 - 7.68 (m, 1H), 7.62 - 7.58 (m, 1H), 7.57 - 7.53 (m, 1H), 7.06 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.63 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 3.86 (s, 3H).

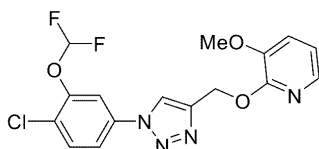
[0934] 실시예 107. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘.



[0935]

[0936] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 3-플루오로피리딘-2-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_3N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 370.0; m/z 실측치, 371.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 - 8.06 (m, 1H), 7.97 (dd, J = 5.0, 1.5 Hz, 1H), 7.72 - 7.70 (m, 1H), 7.64 - 7.60 (m, 1H), 7.59 - 7.55 (m, 1H), 7.40 - 7.34 (m, 1H), 6.97 - 6.85 (m, 1H), 6.64 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 5.68 (s, 2H).

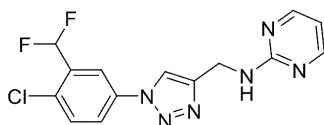
[0937] 실시예 108. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘.



[0938]

[0939] 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-4-(클로로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 4) 및 3-메톡시피리딘-2-올을 사용하여, 실시예 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_3$ 에 대한 질량 계산치, 382.1; m/z 실측치, 383.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.08 (s, 1H), 7.80 - 7.74 (m, 1H), 7.72 - 7.67 (m, 1H), 7.62 - 7.58 (m, 1H), 7.57 - 7.53 (m, 1H), 7.12 - 7.07 (m, 1H), 6.93 - 6.87 (m, 1H), 6.63 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 5.68 (s, 2H), 3.87 (s, 3H).

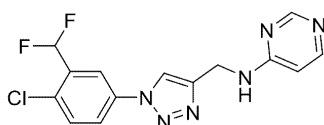
[0940] 실시예 109. N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



[0941]

[0942] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 19) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 6과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.34 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.00 (s, 1H), 7.98 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.89 - 7.85 (m, 1H), 7.61 - 7.57 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.61 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 4.83 (dd, J = 6.2, 0.7 Hz, 2H).

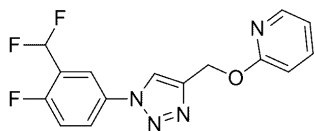
[0943] 실시예 110. N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-4-아민.



[0944]

[0945] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 19) 및 4-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 6과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.65 (s, 1H), 8.20 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.00 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.88 – 7.84 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 6.99 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 6.44 (dd, $J = 6.0, 1.3$ Hz, 1H), 5.54 (s, 1H), 4.81 (d, $J = 5.8$ Hz, 2H).

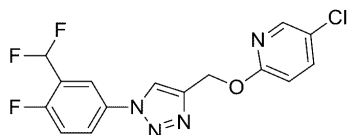
[0946] 실시예 111. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0947]

[0948] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 320.1; m/z 실측치, 321.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.62 (s, 2H), 6.73 – 7.15 (m, 3H), 7.33 (t, $J = 8.90$ Hz, 1H), 7.55 – 7.73 (m, 1H), 7.84 – 8.01 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.15 – 8.30 (m, 1H).

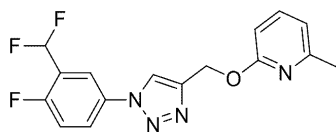
[0949] 실시예 112. 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0950]

[0951] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 5-클로로-2-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 354.0; m/z 실측치, 355.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5.57 (s, 2H), 6.77 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 6.80 – 7.13 (m, 1H), 7.33 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 7.56 (dd, $J = 8.8, 2.5$ Hz, 1H), 7.84 – 7.98 (m, 2H), 8.07 (s, 1H), 8.15 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H).

[0952] 실시예 113. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘.



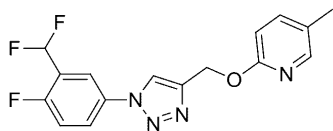
[0953]

[0954] 단계 A. 2-브로모-6-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘. (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-브로모-6-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[0955] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘. 1,4 다이옥산 (0.65 mL) 중의 2-브로모-6-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘 (25 mg, 0.06 mmol), CS_2CO_3 (41 mg, 0.12 mmol)의 용액에 2,4,6-트라이메틸-1,3,5,2,4,6-트라이옥사트라이보리난 (0.01 mL, 0.07 mmol) 및 (2-다이사이클로헥실포스포노-2',4',6'-트리아이소프로필-1,1'-바이페닐)[2-(2'-아미노-1,1'-바이페닐)]팔라듐(II) 메탄설포네이트 (Xphos Palladacycle Gen. 3) (5.3 mg, 0.006 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 12분 동안 마이크로파 조사 하에 120°C에서 가열하였다. 혼합물을 진공에서 농축하였다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헵탄 중의 EtOAc 0 내지 100%). 정제 (RP HPLC, 고정상: C18 엑스브리지 30 $\times$ 100 mm 5 μm , 이동상: 수중의 90% 10mM NH_4CO_3H pH 9 용액, 10% CH_3CN 내지 수중의 0% 10 mM NH_4CO_3H pH 9 용액, 100% CH_3CN 의 그라디언트)에 의해, 표제 화합물 (46 mg, 68%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_4O$ 에 대한 질량

계산치, 334.1; m/z 실측치, 335.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.49 (s, 3H), 5.60 (s, 2H), 6.61 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.77 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 6.81 - 7.14 (m, 1H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.49 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.83 - 7.99 (m, 2H), 8.08 (s, 1H).

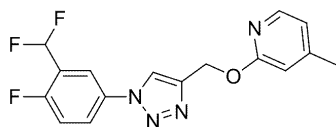
[0956] 실시예 114. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘.



[0957]

[0958] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-플루오로-5-메틸 피리딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 334.1; m/z 실측치, 335.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.27 (s, 3H), 5.58 (s, 2H), 6.73 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 6.79 - 7.16 (m, 1H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.43 (dd, J = 8.4, 1.97 Hz, 1H), 7.84 - 7.97 (m, 2H), 8.01 (s, 1H), 8.08 (s, 1H).

[0959] 실시예 115. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘.

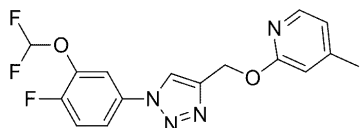


[0960]

[0961] 단계 A. 4-브로모-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘. (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 4-브로모-2-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[0962] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘 4-브로모-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘을 사용하여, 실시예 113 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 334.1; m/z 실측치, 335.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2.31 (s, 3H), 5.60 (s, 2H), 6.63 (s, 1H), 6.76 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 6.80 - 7.12 (m, 1H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.80 - 7.98 (m, 2H), 8.02 - 8.20 (m, 2H).

[0963] 실시예 116. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘.

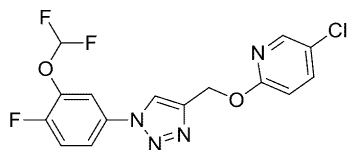


[0964]

[0965] 단계 A. 4-브로모-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 4-브로모-2-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[0966] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘 4-브로모-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘을 사용하여, 실시예 113 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 351.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 2.30 (s, 3H), 5.58 (s, 2H), 6.42 - 6.84 (m, 3H), 7.33 (t, J = 9.25 Hz, 1H), 7.58 (ddd, J = 8.96, 3.90, 2.75 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 6.65, 2.60 Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 8.05 (d, J = 5.20 Hz, 1H).

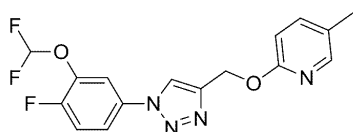
[0967] 실시예 117. 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[0968]

[0969] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 5-클로로-2-플루오로피리딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. HRMS = 370.044; ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 5.57 (s, 2H), 6.46 - 6.87 (m, 2H), 7.35 (t, J = 9.25 Hz, 1H), 7.49 - 7.63 (m, 2H), 7.70 (dd, J = 6.65, 2.60 Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 8.15 (d, J = 2.60 Hz, 1H).

[0970] 실시예 118. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘.

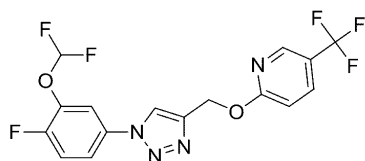


[0971]

[0972] 단계 A. 5-클로로-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 5-클로로-2-플루오로피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[0973] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘 5-클로로-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘을 사용하여, 실시예 113 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{F}_3\text{N}_4\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 351.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 2.26 (s, 3H), 5.56 (s, 2H), 6.44 - 6.81 (m, 2H), 7.33 (t, J = 9.25 Hz, 1H), 7.42 (dd, J = 8.38, 2.02 Hz, 1H), 7.58 (ddd, J = 8.81, 3.90, 2.89 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 6.65, 2.60 Hz, 1H), 7.94 - 8.01 (m, 1H), 8.03 (s, 1H).

[0974] 실시예 119. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘.

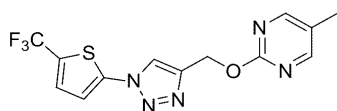


[0975]

[0976] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-플루오로-5-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 중간체 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. HRMS = 404.070; ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 5.65 (s, 2H), 6.45 - 6.81 (m, 1H), 6.89 (d, J = 8.96 Hz, 1H), 7.34 (t, J = 9.25 Hz, 1H), 7.52 - 7.63 (m, 1H), 7.70 (dd, J = 6.36, 2.60 Hz, 1H), 7.81 (dd, J = 8.81, 2.17 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.37 - 8.58 (m, 1H).

[0977] 이전 실시예에서 기재된 방법과 유사한 방식으로 실시예 120 내지 실시예 152를 제조할 수 있다.

[0978] 실시예 120. 5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.

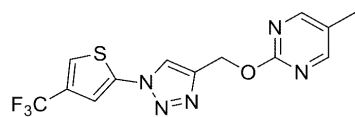


[0979]

[0980] MS (ESI): $C_{13}H_{10}F_3N_5OS$ 에 대한 질량 계산치, 341.06

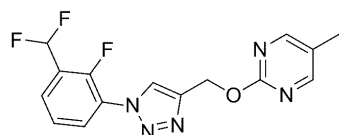
[0981] 실시예 121. 5-메틸-2-((1-(4-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.

[0982]



[0983] MS (ESI): $C_{13}H_{10}F_3N_5OS$ 에 대한 질량 계산치, 341.06

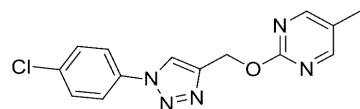
[0984] 실시예 122. 2-((1-(3-(다이플루오로페닐)-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘. 122.



[0985]

[0986] MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.10

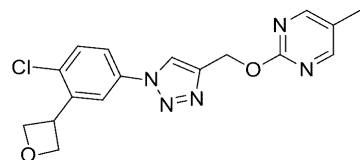
[0987] 실시예 123. 2-((1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[0988]

[0989] MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 301.07

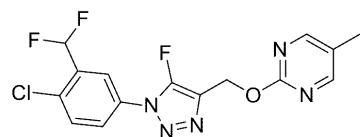
[0990] 실시예 124. 2-((1-(4-클로로-3-(옥세탄-3-일)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[0991]

[0992] MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 357.10

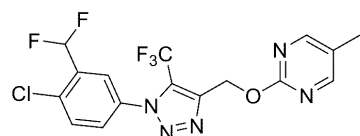
[0993] 실시예 125. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-플루오로-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[0994]

[0995] MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 369.06

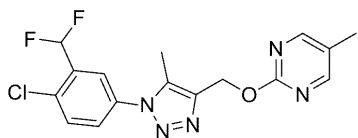
[0996] 실시예 126. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-(트라이플루오로메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[0997]

[0998] MS (ESI): $C_{16}H_{11}ClF_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 419.06

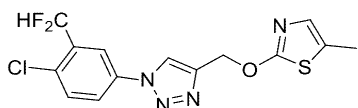
[0999] 실시예 127. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[1000]

[1001] MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.09

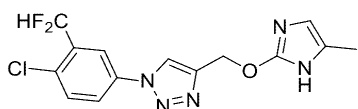
[1002] 실시예 128. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸티아졸.



[1003]

[1004] MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_4OS$ 에 대한 질량 계산치, 356.03.

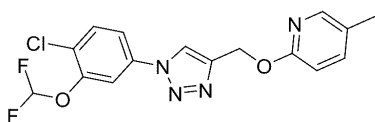
[1005] 실시예 129. 1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(((5-메틸-1H-이미다졸-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트리아졸.



[1006]

[1007] MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 339.07

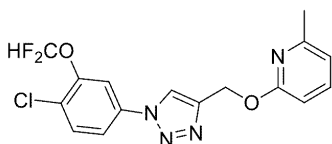
[1008] 실시예 130. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리딘.



[1009]

[1010] MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.07

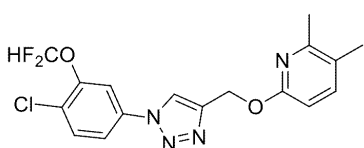
[1011] 실시예 131. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피리딘.



[1012]

[1013] MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.07

[1014] 실시예 132. 6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피리딘.



[1015]

[1016] MS (ESI): $C_{17}H_{15}ClF_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 380.09

[1017] 실시예 133. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피라진.

[1018]

[1019] MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.06

[1020] 실시예 134. 5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피라진.

[1021]

[1022] MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.08

[1023] 실시예 135. 5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘.

[1024]

[1025] MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.06

[1026] 실시예 136. 6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-3,4-다이메틸피리다진.

[1027]

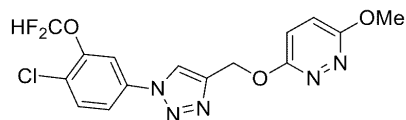
[1028] MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.08

[1029] 실시예 137. 3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(트라이플루오로메틸)피리다진.

[1030]

[1031] MS (ESI): $C_{15}H_9ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 421.04r

[1032] 실시예 138. 3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메톡시피리다진.



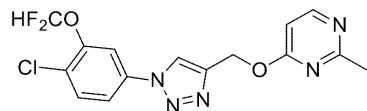
[1033]

[1034] MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 383.06

[1035] 실시예

139.

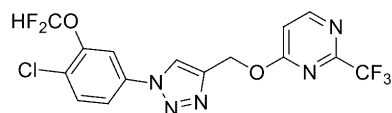
4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘.



[1036]

[1037] MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.06

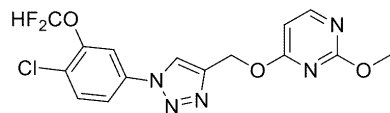
[1038] 실시예 140. 4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-(트리플루오로메틸)피리미딘.



[1039]

[1040] MS (ESI): $C_{15}H_9ClF_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 421.04

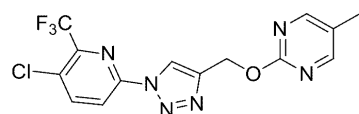
[1041] 실시예 141. 4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메톡시피리미딘.



[1042]

[1043] MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 383.06

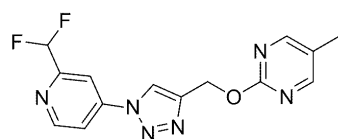
[1044] 실시예 142. 2-((1-(5-클로로-6-(트리플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[1045]

[1046] MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 370.06

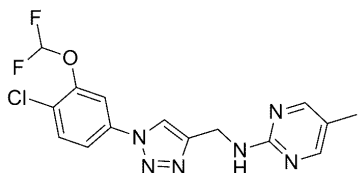
[1047] 실시예 143. 2-((1-(2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[1048]

[1049] MS (ESI): $C_{14}H_{12}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 318.10

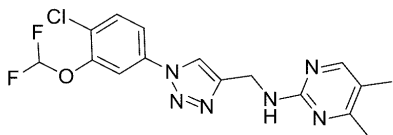
[1050] 실시예 144. N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민.



[1051]

[1052] MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 366.08

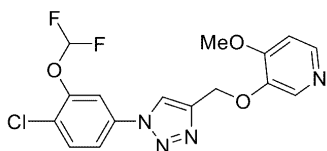
[1053] 실시예 145. N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민.



[1054]

[1055] MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 380.10

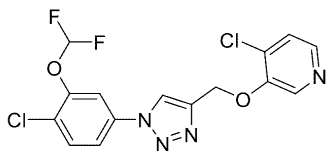
[1056] 실시예 146.
3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메톡시피리딘.



[1057]

[1058] MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_4O_3$ 에 대한 질량 계산치, 382.1

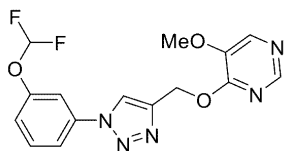
[1059] 실시예 147.
4-클로로-3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘.



[1060]

[1061] MS (ESI): $C_{15}H_{10}Cl_2F_2N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 386.0

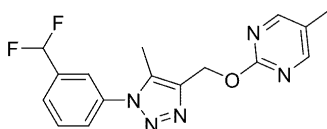
[1062] 실시예 148. 4-((1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘.



[1063]

[1064] MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 349.1

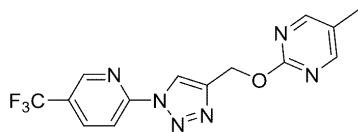
[1065] 실시예 149. 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[1066]

[1067] MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1

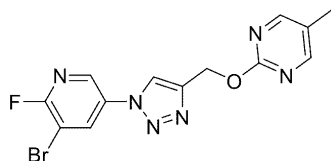
[1068] 실시예 150. 5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[1069]

[1070] MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1

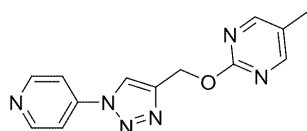
[1071] 실시예 151. 2-((1-(5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[1072]

[1073] MS (ESI): $C_{13}H_{10}BrFN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 364.0

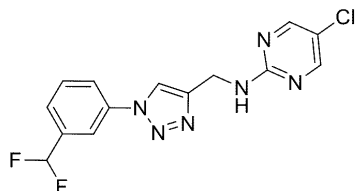
[1074] 실시예 152. 5-메틸-2-((1-(피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[1075]

[1076] MS (ESI): $C_{13}H_{12}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 268.1

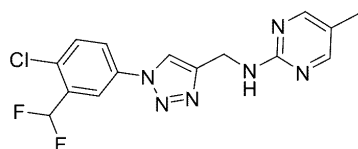
[1077] 실시예 153: 5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



[1078]

[1079] DMF (1.5 mL) 중의 4-(클로로메틸)-1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸 (25 mg, 0.103 mmol) 및 2-아미노-5-클로로피리미딘 (17 mg, 0.13 mmol)의 용액에 K_2CO_3 (57 mg, 0.41 mmol)를 첨가하였다. 생성된 혼합물을 100℃에서 72시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (8 mL)로 희석하여, EtOAc (3×10 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 Na_2SO_4 로 건조시켜, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 0 내지 80% EtOAc/헥산)에 의해, 표제 화합물 (6.2 mg, 18%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 336.07; m/z 실측치, 337.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.33 – 8.19 (m, 2H), 8.03 – 7.95 (m, 1H), 7.91 – 7.80 (m, 2H), 7.68 – 7.54 (m, 2H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.85 (s, 1H), 4.80 (dd, J = 6.2, 0.6 Hz, 2H).

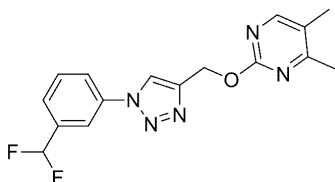
[1080] 실시예 154: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민.



[1081]

[1082] EtOH (1 mL) 중의 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 19) (35 mg, 0.14 mmol), 2-클로로-5-메틸피리미딘 (22.6 mg, 0.18 mmol) 및 트라이에틸아민 (0.06 mL, 0.4 mmol) 의 용액을 밀봉하여, 마이크로파 반응기에서 1시간 동안 180℃에서, 이어서 1시간 동안 200℃에서 가열하였다. 혼합물을 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, MeOH/DCM 0 내지 8%)에 의해, 표제 화합물 (8.3 mg, 17 %)을 얻었다. MS (ESI): C₁₅H₁₃ClF₂N₆에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 351.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.19 (s, 2H), 7.99 (s, 1H), 7.97 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.87 (dd, J = 8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 4.81 (d, J = 6.2 Hz, 2H), 2.16 (s, 3H).

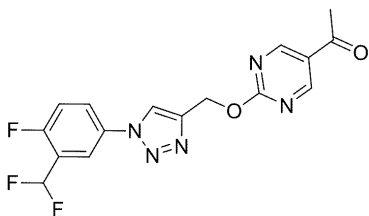
[1083] 실시예 155: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[1084]

[1085] THF (1 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 12, 50 mg, 0.22 mmol)의 용액에 NaH (광유 중의 60% 분산액, 26.6 mg, 0.67 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 5분 동안 교반한 다음, 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘 (38 mg, 0.27 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 하룻밤 동안 실온에서 교반 하였다. 혼합물을 H₂O로 켄칭하고, EtOAc 및 H₂O로 희석하였다. 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na₂SO₄), 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, EtOAc/헥산 0 내지 50%)에 의해, 표제 화합물 (44 mg, 60%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₆H₁₅F₂N₅O에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.23 – 8.12 (m, 2H), 7.93 – 7.83 (m, 2H), 7.67 – 7.54 (m, 2H), 6.72 (t, J = 56.0 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

[1086] 실시예 156: 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.

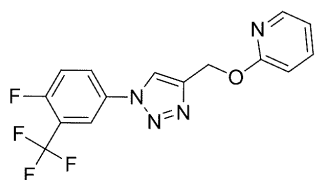


[1087]

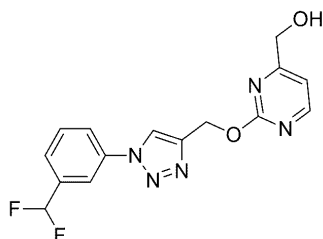
[1088] ACN (0.02 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9, 110 mg, 0.41 mmol), Cs₂CO₃ (535.9 mg, 1.64 mmol) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-온 (83.6 mg, 0.53 mmol)의 용액을 110℃에서 하룻밤 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 냉각시켜, EtOAc로 희석하고, 포화 NH₄Cl 수용액으로 세정하였다. 유기층을 건조시키고 (Na₂SO₄), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 50% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (12 mg, 8%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₆H₁₂F₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 9.14 – 9.05 (s, 2H), 8.19 – 8.11 (s, 1H), 7.98 – 7.87 (m, 2H), 7.40 – 7.31 (m, 1H), 7.09 – 6.80 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.80 – 5.71 (s, 2H), 2.66 – 2.57 (s, 3H).

[1089] 실시예 157: (R/S)-1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.

실시예 158: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘.



실시예 159: [2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.

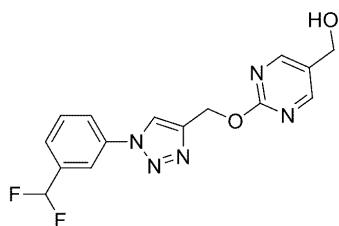


단계 B. [2-[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올. THF (2 mL) 중의

4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시) 피리미딘 (78 mg, 0.17 mmol)의 용액에 TBAF (THF 중의 1 M, 0.2 mL, 0.2 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 실온에서 15분 동안 교반한 다음, 포화 NH₄Cl 수용액으로 켄칭하여, EtOAc로 희석하였다. 층을 분리하여, 유기 층을 건조시킨 다음 (Na₂SO₄), 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, EtOAc/헥산 0 내지 80%)에 의해, 표제 화합물 (26 mg, 39%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₅H₁₃F₂N₅O₂에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.1 [M+H]⁺.

¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.50 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.91 – 7.89 (m, 1H), 7.88 – 7.84 (m, 1H), 7.65 – 7.60 (m, 1H), 7.60 – 7.56 (m, 1H), 7.02 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.73 (d, J = 4.5 Hz, 2H), 3.33 (t, J = 5.4 Hz, 1H).

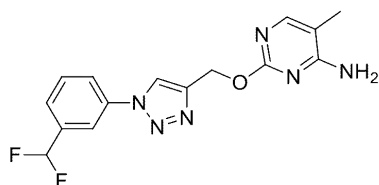
[1099] 실시예 160: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



[1100]

[1101] 단계 A에서 5-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 53)을 사용하여, 실시예 159와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₃F₂N₅O₂에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.54 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.88 – 7.83 (m, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 1H), 7.58 – 7.55 (m, 1H), 6.71 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.63 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.67 (s, 2H), 2.88 (s, 1H).

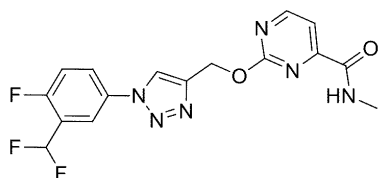
[1102] 실시예 161: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



[1103]

[1104] 마이크로파 바이알에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 12, 26 mg, 0.12 mmol), 2-클로로-5-메틸피리미딘-4-아민 (20 mg, 0.14 mmol) 및 Cs₂CO₃ (113 mg, 0.35 mmol)를 ACN (0.7 mL)에 용해시켰다. 반응물을 마이크로파 반응기에서 140°C에서 2시간 동안 가열하였다. 반응물을 실온으로 냉각시켜, EtOAc 및 H₂O로 희석한 다음, 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na₂SO₄), 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, EtOAc/헥산 0 내지 70%)에 의해, 표제 화합물 (13.4 mg, 29%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₅H₁₄F₂N₆O에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실측치, 333.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.15 (s, 1H), 7.93 – 7.82 (m, 3H), 7.66 – 7.54 (m, 2H), 6.71 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.55 (s, 2H), 5.02 (s, 2H), 2.07 – 1.99 (m, 3H).

[1105] 실시예 162: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-카르복스아미드.



[1106]

[1107]

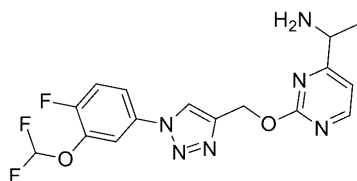
단계 A: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-카르복실산. (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 메틸 2-클로로피리미딘-4-카르복실레이트를 사용하여, 실시예 161과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$.

[1108]

단계 B: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-카르복스아미드. DCM (3 mL) 중의 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-카르복실산 (15 mg, 0.041 mmol), 메틸아민 (1.5 mg, 0.045 mmol), EDCI (16 mg, 0.082 mmol) 및 HOBt (11 mg, 0.082 mmol)의 용액에 DIEA (21 μ L, 0.123 mmol)를 첨가하였다. 얻어진 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 DCM으로 희석하여, 물 및 염수로 세정하였다. 유기층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 0 내지 80% EtOAc/헥산)에 의해, 표제 화합물 (6.1 mg, 39%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 378.1; m/z 실측치, 379.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.77 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.17 – 8.09 (m, 2H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.93 – 7.86 (m, 1H), 7.82 – 7.75 (m, 1H), 7.39 – 7.30 (m, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.70 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 3.06 (d, J = 5.1 Hz, 3H).

[1109]

실시예 163: (R/S) 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄아민.



[1110]

[1111]

단계 A. (R/S) *tert*-부틸 (1-(2-클로로피리미딘-4-일)에틸)카르바메이트. 질소 분위기 하에 실온에서 NaH (광유 중의 60% 분산액, 154 mg, 3.8 mmol)를 DMF (50 mL) 중의 *tert*-부틸 ((2-클로로피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트 (중간체 58, 720 mg, 3.0 mmol)의 혼합물에 조금씩 첨가하였다. 30분 후에, 0°C에서 MeI (0.22 mL, 3.5 mmol)를 첨가하였다. 16시간 후, 완전한 전환이 관찰되었다. EtOAc (200 mL)를 첨가하였다. 혼합물을 염수 (1x 350 mL)로 세정하였다. 유기물을 건조시키고 ($MgSO_4$), 여과하여, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 0 내지 99% EtOAc/헥산)에 의해, 표제 화합물 (299 mg, 39%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{11}H_{16}ClN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 257.1; m/z 실측치, 201.9 $[M-t-Bu]^+$.

[1112]

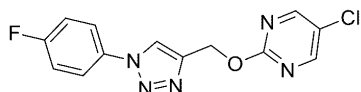
단계 B. (R/S) *tert*-부틸 (1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에틸)카르바메이트. DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 R/S *tert*-부틸 (1-(2-클로로피리미딘-4-일)에틸)카르바메이트를 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{21}H_{23}F_3N_6O_4$ 에 대한 질량 계산치, 480.1; m/z 실측치, 480.9 $[M+H]^+$.

[1113]

단계 C. 트라이플루오로아세트산 염으로서의 (R/S) 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄아민. DCM (5 mL) 중의 (R/S) *tert*-부틸 (1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에틸)카르바메이트 (13 mg, 0.03 mmol)의 혼합물에 TFA (0.04 mL, 0.5 mmol)를 첨가하였다. 완료시, 반응 혼합물을 감압 하에 농축시켰다. 정제 (HPLC 방법 E)에 의해, 표제 화합물 (3.6 mg, 35%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치,

380.1; m/z 실측치, 381.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_2Cl_2) δ 8.47 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.72 (dd, J = 6.7, 2.6 Hz, 1H), 7.60 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.7 Hz, 1H), 7.37 (dd, J = 9.7, 8.9 Hz, 1H), 7.03 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.69 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.63 – 5.57 (m, 2H), 4.04 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 1.39 (d, J = 6.7 Hz, 3H).

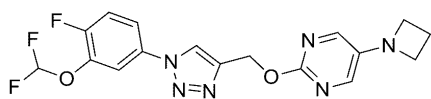
[1114] 실시예 164: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1115]

[1116] 마이크로파 바이알에 2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-클로로피리미딘 (실시예 42, 25 mg, 0.07 mmol), 아제티딘 (0.005 mL, 0.08 mmol), 트랜스-비스(아세테이트)비스[o-(다이-오-톨릴포스피노)벤질]다이팔라듐(II) (6 mg, 0.007 mmol), 몰리브덴 헥사카르보닐 (17 mg, 0.07 mmol), DBU (0.01 mL, 0.08 mmol) 및 THF (0.5 mL)를 주입하여, 질소로 퍼징하고, 마이크로파 조사 하에서 20분 동안 150°C로 가열하였다. 반응 혼합물을 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc), 이어서 역상 HPLC (방법 E)에 의해 부산물로서 표제 화합물 (7 mg, 25%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{13}H_9ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 305.1; m/z 실측치, 306.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.89 (s, 1H), 8.77 – 8.75 (m, 2H), 7.98 – 7.93 (m, 2H), 7.49 – 7.42 (m, 2H), 5.54 (s, 2H).

[1117] 실시예 165: 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1118]

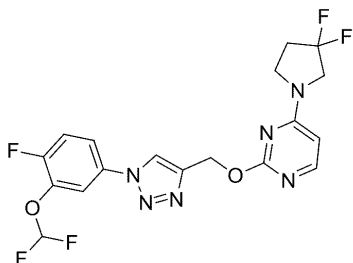
[1119] 단계 A. 5-(아제티딘-1-일)-2-(메틸티오)피리미딘. 톨루엔 (1.7 mL) 중의 아제티딘 (0.03 mL, 0.5 mmol), 5-브로모-2-(메틸티오)피리미딘 (100 mg, 0.49 mmol), Xantphos (4,5-비스(다이페닐포스피노)-9,9-다이메틸잔텐) (9.9 mg, 0.02 mmol), $Pd(OAc)_2$ (2 mg, 0.01 mmol) 및 $NaOt-Bu$ (140 mg, 1.5 mmol)의 혼합물을 110°C에서 가열하였다. 3시간 후, 반응 혼합물을 실온으로 냉각시켜, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (39 mg, 44%)을 얻었다. MS (ESI): $C_8H_{11}N_3S$ 에 대한 질량 계산치, 181.1; m/z 실측치, 182.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 7.96 (s, 2H), 3.87 (t, J = 7.3 Hz, 4H), 2.45 (s, 3H), 2.40 – 2.32 (m, 2H).

[1120] 단계 B. 5-(아제티딘-1-일)-2-(메틸설포닐)피리미딘. 0°C에서 $mCPBA$ (1.6 g, 7.3 mmol)를 DCM (12 mL) 중의 5-(아제티딘-1-일)-2-(메틸티오)피리미딘 (531 mg, 2.9 mmol)의 혼합물에 서서히 첨가하였다. 16시간 후에, 반응 혼합물을 포화 $NaHCO_3$ 수용액 (60 mL)으로 토크하였다. 혼합물을 DCM (3 × 80 mL)으로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜 ($MgSO_4$), 여과하고, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (290 mg, 46%)을 얻었다. MS (ESI): $C_8H_{11}N_3O_2S$ 에 대한 질량 계산치, 213.1; m/z 실측치, 214.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.10 (s, 2H), 4.08 (t, J = 7.5 Hz, 4H), 3.24 (s, 3H), 2.48 – 2.40 (m, 2H).

[1121] 단계 C. 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 5-(아제티딘-1-일)-2-(메틸설포닐)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 392.1; m/z 실측치, 393.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.92 (s,

1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.92 (s, 2H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 3.84 (t, $J = 7.2$ Hz, 4H), 2.38 – 2.29 (m, 2H).

[1122] 실시예 166: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘.

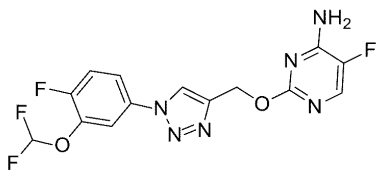


[1123]

[1124] 단계 A. 2-클로로-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘. DCM (23 mL) 중의 2,4-다이클로로피리미딘 (500 mg, 3.4 mmol), 3,3-다이플루오로피롤리딘 하이드로클로라이드 (481 mg, 3.4 mmol) 및 TEA (0.56 mL, 4.0 mmol)의 혼합물을 실온에서 교반하였다. 3시간 후, 물 (50 mL)을 반응 혼합물에 첨가하였다. 혼합물을 EtOAc (3 × 75 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 (MgSO₄), 여과하여, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (392 mg, 53%)을 얻었다. MS (ESI): C₈H₈ClF₂N₃에 대한 질량 계산치, 219.0; m/z 실측치, 220.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.14 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 6.61 (br s, 1H), 3.89 (t, $J = 13.0$ Hz, 2H), 3.75 – 3.61 (m, 2H).

[1125] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₈H₁₅F₅N₆O₂에 대한 질량 계산치, 442.1; m/z 실측치, 442.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.92 (s, 1H), 8.09 (d, $J = 5.9$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.88 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.33 – 6.26 (m, 1H), 5.45 (s, 2H), 3.97 – 3.83 (m, 2H), 3.74 – 3.59 (m, 2H).

[1126] 실시예 167: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[1127]

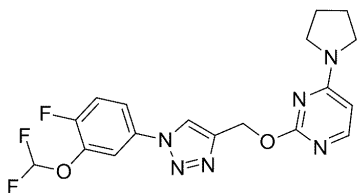
[1128] 단계 A: 4-클로로-5-플루오로-2-(메틸설포닐)피리미딘. 0°C에서 0°C에서 0°C에서 mCPBA (77%, 2.5 g, 11.2 mmol)를 DCM (25 mL) 중의 4-클로로-5-플루오로-2-(메틸티오)피리미딘 (1.0 g, 5.6 mmol)의 혼합물에 서서히 첨가하였다. 16시간 후에, 반응 혼합물을 포화 NaHCO₃ 수용액 (60 mL)으로 켄칭하였다. 혼합물을 DCM (3 × 80 mL)으로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 (MgSO₄), 여과하여, 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산 중의 0 내지 99% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.2 g, 98%)을 얻었다. MS (ESI): C₅H₄ClFN₂O₂S에 대한 질량 계산치, 210.0; m/z 실측치, 211.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9.26 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 3.43 (s, 3H).

[1129] 단계 B. 4-클로로-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘. 질소 분위기 하에 THF (2.7 mL) 중의 NaH (광유 중의 60% 분산액, 15 mg, 0.4 mmol)의 현탁액에 ((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6, 50 mg, 0.2

mmol)을 첨가하였다. 5분 후에, 0℃에서 4-클로로-5-플루오로-2-(메틸설포닐)피리미딘 (49 mg, 0.2 mmol)을 첨가하였다. 완료시, 염수 (20 mL)를 첨가하여, 혼합물을 EtOAc (3 × 30 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 (MgSO₄), 여과하여, 진공 하에 농축시켰다. MS (ESI): C₁₄H₈ClF₄N₅O₂에 대한 질량 계산치, 389.0; m/z 실측치, 390.1 [M+H]⁺.

[1130] 단계 C. 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민. 마이크로파 바이알에 4-클로로-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘 (75 mg, 0.2 mmol), 암모니아 (MeOH 중의 2M, 1.9 mL, 3.9 mmol) 및 THF (1.9 mL)를 주입하였다. 바이알을 마이크로파 조사 하에 8시간 동안 100℃로 가열하였다. 반응 혼합물을 진공 하에 농축시키고, 조물질을 역상 HPLC (애질런트, H₂O/NH₄OH:MeCN 그래디언트)를 사용하여 정제하여, 표제 화합물 (14.9 mg, 21%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₄H₁₀F₄N₆O₂에 대한 질량 계산치, 370.1; m/z 실측치, 371.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.91 (s, 1H), 8.01 – 7.96 (m, 2H), 7.86 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.55 – 7.23 (m, 3H), 5.35 (s, 2H).

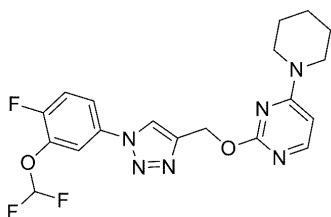
[1131] 실시예 168: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



[1132]

[1133] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₈H₁₇F₃N₆O₂에 대한 질량 계산치, 406.1; m/z 실측치, 406.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.97 (s, 1H), 8.07 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.7 Hz, 1H), 7.90 – 7.85 (m, 1H), 7.70 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 72.7 Hz, 1H), 6.44 (d, J = 6.7 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.72 – 3.63 (m, 2H), 2.08 – 1.90 (m, 4H).

[1134] 실시예 169: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘.

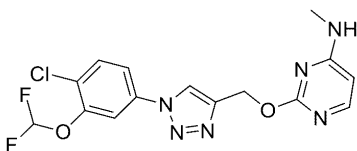


[1135]

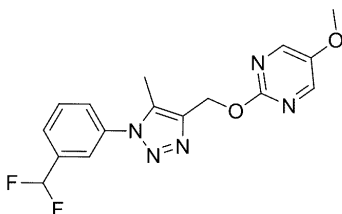
[1136] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-(피페리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₉H₁₉F₃N₆O₂에 대한 질량 계산치, 420.2; m/z 실측치, 421.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.90 (s, 1H), 8.03 – 7.96 (m, 2H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.49 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 3.67 – 3.53 (m, 4H), 1.70 – 1.57 (m, 2H), 1.54 – 1.42 (m, 4H).

[1137] 실시예 170: 4-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]모르폴린.

실시예 171: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



실시예 172: 2-[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시-5-메톡시-피리미딘.



- 160 -

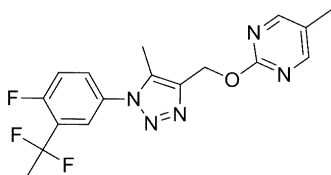
화하였다. 층을 분리하여, 수층을 다이에틸 에테르 (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에서 농축시켰다. 조 잔류물을 정제없이 다음으로 진행시켰다.

[1148] 단계 B. 에틸 1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르복실레이트. DMSO (3.5 mL) 중의 1-아지도-3-(다이플루오로메틸)벤젠 (0.59 g, 3.5 mmol)의 용액에 에틸 아세토아세테이트 (0.7 mL, 5.2 mmol), 이어서 다이메틸아민 (0.02 mL, 0.17 mmol)을 첨가하였다. 바이알을 N_2 로 퍼징한 다음, 밀봉하여, 70°C 에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 실온으로 냉각시킨 다음, EtOAc 및 H_2O 로 희석하였다. 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 H_2O (X5), 이어서 염수 (X3)로 세정한 다음, 건조시켜 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 50%)에 의해, 정치시 고화되는 담 황색 오일로서의 표제 화합물 (67%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{13}\text{H}_{13}\text{F}_2\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, 282.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

[1149] 단계 C. (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. -78°C에서 LAH (THF 중의 1 M, 3.5 mL, 3.5 mmol)를 THF 중에 교반하는 에틸 1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르복실레이트 (395 mg, 1.4 mmol)에 적가하였다. 반응물을 -78°C에서 2시간 동안 교반한 다음, 실온으로 가온시켜, 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 0°C로 냉각시켜, EtOAc로 서서히 켄칭한 다음, 혼합물을 실온으로 가온시켜, L(+)-타르타르산 칼륨 나트륨 염 (로셀(Rochelle) 염)의 포화 용액으로 희석하였다. 혼합물을 1시간 동안 격렬하게 교반한 다음, 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시킨 다음 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켜, 황색 오일 (296 mg, 88%)을 얻어, 정제없이 사용하였다. MS (ESI) $\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{F}_2\text{N}_3\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 239.1; m/z 실측치 240.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 7.69 - 7.63 (m, 3H), 7.63 - 7.57 (m, 1H), 6.73 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 4.83 (s, 2H), 2.40 (s, 3H).

[1150] 단계 D. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘. THF (1 mL) 중에 교반하는 (1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (45 mg, 0.19 mmol)에 NaH (광유 중의 60% 분산액, 22.6 mg, 0.56 mmol)을 첨가하고, 반응물을 5분 동안 교반하였다. 이어서, 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 첨가하고, 반응물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 H_2O 로 켄칭한 다음, EtOAc 및 H_2O 로 희석하였다. 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 H_2O (1X), 염수 (1X)로 세정한 다음, 건조시켜 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 60 %)에 의해, 표제 화합물 (41 mg, 62%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{F}_2\text{N}_5\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CDCl_3) δ 8.24 (s, 2H), 7.71 - 7.56 (m, 4H), 6.73 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.88 (s, 3H), 2.45 (s, 3H).

[1151] 실시예 173: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

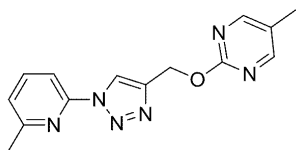


[1152]

[1153] 단계 A. 2-(1,1-다이플루오로에틸)-1-플루오로-4-니트로벤젠. 78°C에서 DCM (50 mL) 중에 교반하는 1-(2-플루오로-5-니트로페닐)에탄올 (3.0 g, 16.5 mmol)의 용액에 DAST (10 mL, 75.7 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 실온으로 가온시켜, 5일 동안 교반하였다. 반응물을 얼음 위에 부은 다음, 얼음을 녹여, 층을 분리하였다. 수층을 DCM (2X)으로 추출한 다음, 합한 유기 층을 염수로 세정하여, 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 20%)에 의해, 표제 화합물 (2.73 g, 81%)을 얻었다. ^1H NMR (500 MHz, CDCl_3) δ 8.49 (dd, J = 6.3, 2.8 Hz, 1H), 8.35 (dt, J = 8.9, 3.5 Hz, 1H), 7.31 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 2.04 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

- [1154] 단계 B. 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로아닐린. EtOH (30 mL)에 용해시킨 2-(1,1-다이플루오로에틸)-1-플루오로-4-니트로벤젠 (1 g, 4.86 mmol)에, 10% Pd/C (0.52 g, 0.49 mmol)를 첨가하였다. 반응물을 수소 분위기 하에 두고, 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 셀라이트® 패드를 통해 여과하여, EtOAc를 사용하여 행구고, 여과액을 진공 하에 농축시켜, 표제 화합물 (863 mg, 101%)을 얻어, 정제없이 사용하였다. MS (ESI): $C_8H_8F_3N$ 에 대한 질량 계산치, 175.1; m/z 실측치, 176.1 $[M+H]^+$.
- [1155] 단계 C. 4-아지도-2-(1,1-다이플루오로에틸)-1-플루오로벤젠. 둥근 바닥 플라스크에서 3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로아닐린 (854 mg, 4.9 mmol)에, H_2SO_4 (1 mL, 18.8 mmol), 이어서 TFA (5 mL, 65.3 mmol)를 서서히 첨가하였다. 반응물을 0°C로 냉각시킨 다음, 교반하면서 H_2O (3 mL) 중의 $NaNO_2$ (482 mg, 7 mmol)의 용액을 적가하였다. 반응물을 0°C에서 15분 동안 교반한 다음, H_2O (6 mL) 중의 아지드화나트륨 (594.3 mg, 9 mmol)의 용액을 적가하였다. 반응물을 빙욕으로부터 제거하여, 실온에서 30분 동안 교반하였다. 혼합물을 다이에틸 에테르로 희석하여, NaOH (3 N) 용액을 사용하여 pH 12로 염기화하였다. 층을 분리하여, 수층을 다이에틸 에테르 (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에서 농축시켰다. 조 잔류물을 정제없이 다음으로 진행시켰다.
- [1156] 단계 D. 에틸 1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르복실레이트. DMSO (5 mL) 중의 4-아지도-2-(1,1-다이플루오로에틸)-1-플루오로벤젠 (0.981 g, 4.9 mmol)의 용액에, 에틸 아세토아세테이트 (0.9 mL, 7.3 mmol), 이어서 다이메틸아민 (0.025 mL, 0.24 mmol)을 첨가하였다. 바이알을 N_2 로 퍼징한 다음, 밀봉하여, 70°C에서 2일 동안 교반하였다. 반응물을 실온으로 냉각시킨 다음, EtOAc 및 H_2O 로 희석하였다. 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 H_2O (5X), 이어서 염수 (3X)로 세정한 다음, 건조시켜 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 50%)에 의해, 정지시 고화되는 황색 오일 (1.32 g, 87%)로서의 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): $C_{14}H_{14}F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1 $[M+H]^+$.
- [1157] 단계 E. (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.
- [1158] -78°C에서 LAH (THF 중의 1 M, 4.5 mL, 4.5 mmol)를 THF 중에 교반하는 에틸 1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-카르복실레이트 (537 mg, 1.7 mmol)에 적가하였다. 반응물을 -78°C에서 1시간 동안 교반한 다음, 실온으로 가온시켜, 3시간 동안 교반하였다. 반응물을 0°C로 냉각시켜, EtOAc로 서서히 켄칭한 다음, 혼합물을 실온으로 가온시켜, 나트륨 칼륨 타르테이트 4수화물의 포화 용액으로 희석하였다. 혼합물을 10분 동안 격렬하게 교반한 다음, 층을 분리하여, 수층을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세정한 다음, 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에 농축시켜, 황색 오일을 얻어, 정제없이 사용하였다. MS (ESI) $C_{12}H_{12}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 271.1; m/z 실측치 272.1 $[M+H]^+$.
- [1159] 단계 F. 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘. THF (0.8 mL) 중에 교반하는 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (25 mg, 0.09 mmol)에, NaH (광유 중의 60% 분산액, 12.5 mg, 0.31 mmol)를 첨가하고, 반응물을 5분 동안 교반하였다. 이어서, 2-클로로-5-메틸피리미딘을 첨가하고, 반응물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 H_2O 로 켄칭한 다음, 공기 스트림 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , EtOAc/헥산 0 내지 80%)에 의해, 표제 화합물 (20 mg, 60%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.37 (s, 2H), 7.66 (dd, J = 6.3, 2.6 Hz, 1H), 7.53 (ddd, J = 8.5, 4.1, 2.6 Hz, 1H), 7.32 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.56 (s, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.11 – 1.96 (m, 3H).

[1160] 실시예 174: 5-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딘)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



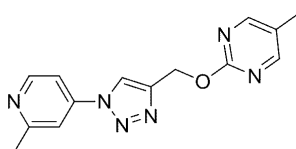
[1161]

[1162] 단계 A. 5-메틸테트라졸로[1,5-a]피리딘. 2-메틸피리딘 *N*-옥사이드 (400 mg, 3.7 mmol), 다이페닐포스포릴 아지드 (4 mL, 18.6 mmol) 및 피리딘 (0.6 mL, 7.4 mmol)을 배합하고, 질소로 퍼징하여, 밀봉하고, 120°C에서 하룻밤 동안 교반하였다. 혼합물을 실온으로 냉각시킨 다음, 실리카 겔 컬럼 상에 직접 로딩하였다. 정제 (FCC, SiO₂, MeOH/DCM 중의 10% 2N NH₃ 0 내지 5%)에 의해, 백색 고체로서의 표제 화합물 (257 mg, 52%)을 얻었다. MS (ESI): C₆H₆N₄에 대한 질량 계산치, 134.1; m/z 실측치, 135.1 [M+H]⁺.

[1163] 단계 B. (1-(6-메틸피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메탄올. 톨루엔 (7.7 mL) 중의 5-메틸테트라졸로[1,5-a]피리딘 (257 mg, 1.9 mmol) 및 구리 (I) 트라이플루오로메탄설포네이트 벤젠 복합체 (96.4 mg, 0.19 mmol)의 용액에, 프로파르길 알코올 (0.13 mL, 2.3 mmol)을 첨가하였다. 바이알을 질소로 퍼징한 다음, 밀봉하여, 100°C에서 하룻밤 동안 교반하였다. 혼합물을 DCM으로 희석하여, 물 (x1), 염수 (x1)로 세정한 다음, 건조시키고 (Na₂SO₄), 감압 하에 농축시켜, 옅은 주황색 고체 (191 mg, 53%)를 얻었다. 조생성물을 정제 없이 사용하였다. MS (ESI): C₉H₁₀N₄O에 대한 질량 계산치, 190.1; m/z 실측치, 191.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CD₃OD) δ 8.68 (s, 1H), 7.96 - 7.88 (m, 2H), 7.37 - 7.33 (m, 1H), 4.77 (d, *J* = 0.7 Hz, 2H), 2.59 (s, 3H).

[1164] 단계 C. 5-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딘)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘. DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(6-메틸피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₁₄N₆O에 대한 질량 계산치, 282.1; m/z 실측치, 283.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.71 (s, 1H), 8.37 (d, *J* = 0.8 Hz, 2H), 7.96 (d, *J* = 8.1 Hz, 1H), 7.76 (t, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.17 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 5.63 (d, *J* = 0.7 Hz, 2H), 2.57 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

[1165] 실시예 175: 5-메틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딘)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1166]

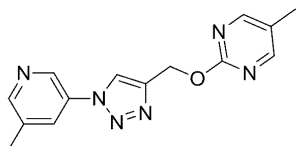
[1167] 단계 A. 4-아지도-2-메틸피리딘. H₂O (2.5 mL) 중에 교반하는 4-클로로-2-피콜린 하이드로클로라이드 (600 mg, 3.7 mmol)에, pH가 7로 측정될 때까지 NaOH (H₂O 중의 1 M) 용액을 첨가하였다. 이어서, 아지드화나트륨 (476 mg, 7.3 mmol)을 첨가하고, 반응물을 환류 하에 하룻밤 동안 가열하였다. 반응물을 실온으로 냉각시킨 다음, 에테르 (3x)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시켜 (Na₂SO₄), 감압 하에 농축시키고, 무색 오일을 얻어, 정제없이 사용하였다.

[1168] 단계 B. (1-(2-메틸피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메탄올. 4-아지도-2-메틸피리딘 (491 mg, 3.7 mmol)을 tBuOH (4.5 mL) 및 H₂O (4.5 mL)의 혼합물에 용해시켰다. 이어서, 프로파르길 알코올 (0.26 mL, 4.4 mmol), 이어서 황산 구리 (II) 5수화물 (91 mg, 0.37 mmol) 및 L-아스코르브산나트륨 (72.5 mg, 0.37 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 실온에서 하룻밤 동안 교반한 다음, NH₄OH (H₂O 중 28%) 및 H₂O로 희석하였다. 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (6x) 및 DCM (3x)으로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세정하여, 건조시키고 (Na₂SO₄), 감압 하에 농축시켜, 표제 화합물 (356 mg, 51%)을 얻어, 정제없이 사용하였다. MS (ESI): C₉H₁₀N₄O에 대한 질량 계산치, 190.1; m/z 실측치, 191.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.66 (s, 1H), 8.61 (d, *J* =

5.7 Hz, 1H), 7.93 - 7.90 (m, 1H), 7.83 (dd, $J = 5.8, 2.1$ Hz, 1H), 4.80 (s, 2H), 2.67 (s, 3H).

[1169] 단계 C. 5-메틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘. DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(2-메틸피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{14}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 282.1; m/z 실측치, 283.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.65 (d, $J = 5.6$ Hz, 1H), 8.38 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 8.21 (s, 1H), 7.61 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.49 (ddd, $J = 5.4, 2.1, 0.7$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).

[1170] 실시예 176: 5-메틸-2-[[1-(5-메틸-3-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



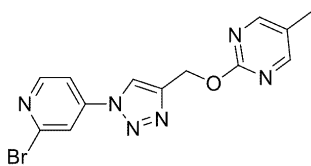
[1171]

[1172] 단계 A. 3-아지도-5-메틸피리딘. 둥근 바닥 플라스크에서 3-아미노-5-메틸피리딘 (483 mg, 4.5 mmol)에, H_2SO_4 (0.9 mL, 17.2 mmol), 이어서 TFA (4.6 mL, 59.9 mmol)를 서서히 첨가하였다. 반응물을 0°C로 냉각시킨 다음, 교반하면서 H_2O (3 mL) 중의 $NaNO_2$ (442 mg, 6.4 mmol)의 용액을 적가하였다. 반응물을 0°C에서 15분 동안 교반한 다음, H_2O (3 mL) 중의 아지드화나트륨 (544 mg, 8.4 mmol)의 용액을 적가하였다. 반응물을 빙욕으로부터 제거하여, 실온에서 30분 동안 교반하였다. 혼합물을 다이에틸 에테르로 희석하여, NaOH (3 N) 용액을 사용하여 pH 12로 염기화하였다. 층을 분리하여, 수층을 다이에틸 에테르 (3X)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에서 농축시켰다. 조 잔류물을 정제없이 다음으로 진행시켰다.

[1173] 단계 B. (1-(5-메틸피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올. $tBuOH$ (6 mL) 및 H_2O (6 mL)에 용해시킨 3-아지도-5-메틸피리딘 (599 mg, 4.5 mmol)에, 프로파르길 알코올 (0.3 mL, 5.2 mmol), 이어서 황산 구리(II) 5수화물 (109 mg, 0.44 mmol) 및 L-아스코르브산나트륨 (90 mg, 0.45 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 하룻밤 동안 실온에서 교반하였다. 아침에, LCMS는 전환을 나타내지 않았다. 혼합물을 K_2CO_3 (약 200 mg)를 사용하여 pH 8로 염기화한 다음, 실온에서 추가로 5시간 동안 교반하였다. 반응물을 EtOAc 및 NH_4OH (H_2O 중 28%)로 희석한 다음, 층을 분리하여, 수층을 EtOAc (x 3)로 추출하였다. 합한 유기 층을 건조시키고 (Na_2SO_4), 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , MeOH/DCM 0 내지 5%)에 의해, 표제 화합물 (57.5 mg, 6.7%)을 얻었다. MS (ESI): $C_9H_{10}N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 190.1; m/z 실측치, 191.1 $[M+H]^+$.

[1174] 단계 C. 5-메틸-2-[[1-(5-메틸-3-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘. DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(5-메틸피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{14}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 282.1; m/z 실측치, 283.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.77 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 8.53 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 8.38 (s, 2H), 8.19 - 8.13 (m, 1H), 7.97 - 7.94 (m, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).

[1175] 실시예 177: 2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

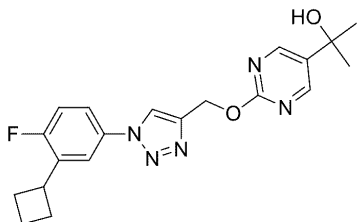


[1176]

[1177] 단계 A에서 2-브로모피리딘-4-아민을 사용하여, 실시예 176과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_{11}BrN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 346.0; m/z 실측치, 347.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.87

(s, 1H), 8.53 (d, $J = 5.5$ Hz, 1H), 8.46 (s, 2H), 8.24 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 8.01 (dd, $J = 5.6, 1.9$ Hz, 1H), 5.60 (s, 2H), 2.27 (s, 3H).

[1178] 실시예 178: 2-[2-[[1-(3-사이클로부틸-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.

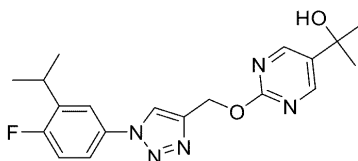


[1179]

[1180] 단계 A. 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올. DMF 대신에 THF를 사용하여, (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}BrN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 407.0; m/z 실측치, 408.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.99 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (ddd, $J = 8.8, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.30 - 7.26 (m, 2H), 5.65 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 1.63 (s, 6H).

[1181] 단계 B. 2-[2-[[1-(3-사이클로부틸-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올. THF (1 mL) 중의 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (30 mg, 0.07 mmol)의 용액에, 사이클로부틸아연 브로마이드 (THF 중의 0.5 M, 0.3 mL, 0.15 mmol) 및 $Pd(t-Bu_3P)_2$ (1.9 mg, 0.004 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 50°C에서 하룻밤 동안 교반하였다. 혼합물을 정제 하였으나 (FCC, SiO_2 , MeOH/DCM 0 내지 10%), 생성물은 불순물을 함유하였다. 화합물을 염기성 HPLC (길슨, 워 터즈 엑스브리지(waters Xbridge) 50 $\times$ 150 mm, 15분에 걸쳐 5 내지 95% MeCN/20 mM NH_4OH , 80 mL/min)로 다시 정제하여, 표제 화합물 (15.8 mg, 56%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{20}H_{22}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.2; m/z 실측치, 384.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.61 (ddd, $J = 6.3, 2.7, 0.8$ Hz, 1H), 7.46 (dddd, $J = 8.8, 4.2, 2.7, 0.6$ Hz, 1H), 7.11 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.83 - 3.72 (m, 1H), 2.46 - 2.36 (m, 2H), 2.28 - 2.16 (m, 2H), 2.14 - 2.03 (m, 1H), 1.96 - 1.87 (m, 1H), 1.62 (s, 6H).

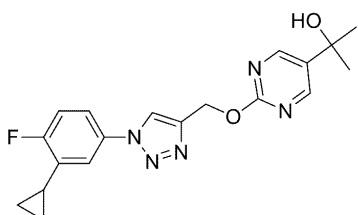
[1182] 실시예 179: 2-[2-[[1-(4-플루오로-3-아이소프로필-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1183]

[1184] 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 178, 단계 A로부터의 생성물) 및 2-프로필아연 브로마이드를 사용하여, 실시예 178 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{22}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.2; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$.

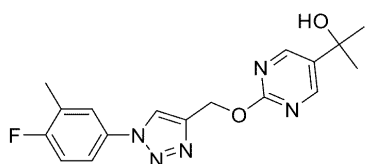
[1185] 실시예 180: 2-[2-[[1-(3-사이클로프로필-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1186]

[1187] 1,4-다이옥산 (1 mL) 및 물 (0.2 mL) 중의 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 178, 단계 A로부터의 생성물, 42 mg, 0.1 mmol), K_2CO_3 (43 mg, 0.31 mmol) 및 RuPhos-Pd-G3 (4.3 mg, 0.005 mmol)의 용액에, 사이클로프로필보론산 (19.3 mg, 0.23 mmol)을 첨가하였다. 바이알을 밀봉하여, 반응물을 100℃에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 물로 희석하여, 격막으로 캡핑하고, 실온에서 9일 동안 정치하였다. 이어서, 혼합물을 실리카 플러그를 통해 여과하고, EtOAc 및 DCM으로 행군 다음, 감압 하에 농축시켰다. 잔류물을 MeOH에 재용해시키고, 0.45 μ m 시린지를 통해 여과하여, 분취용 HPLC (길슨, 워터즈 엑스브리지 50 $\times$ 150 mm, 15분에 걸쳐 5 내지 95% MeCN/20 mM NH_4OH , 80 mL/min)에 의해 정제하였다. 순수한 생성물을 함유하는 분획을 동결시키고, 2일 동안 동결 건조시켜, 표제 화합물 (8 mg, 21%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{19}H_{20}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.2; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.04 (s, 1H), 7.42 (ddd, J = 8.8, 4.2, 2.8 Hz, 1H), 7.28 – 7.27 (m, 1H), 7.14 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.15 (ddd, J = 13.7, 8.6, 5.2 Hz, 1H), 1.76 (s, 1H), 1.63 (s, 6H), 1.11 – 1.05 (m, 2H), 0.81 (dt, J = 6.7, 4.8 Hz, 2H).

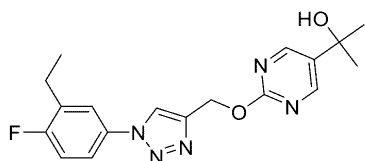
[1188] 실시예 181: 2-[2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1189]

[1190] 1,4-다이옥산 (1.05 mL) 중의 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 178, 단계 A로부터의 생성물, 42 mg, 0.1 mmol), K_2CO_3 (44 mg, 0.32 mmol) 및 RuPhos-Pd-G3 (4.3 mg, 0.005 mmol)의 용액에 트라이메틸보록신 (0.04 mL, 0.3 mmol)을 첨가하였다. 바이알을 밀봉하여, 반응물을 90℃에서 3시간 동안 교반하였다. 이어서, 혼합물을 실리카 플러그를 통해 여과하고, DCM으로 행군 다음, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , MeOH/DCM 0 내지 10%)에 의해, 표제 화합물 (20.9 mg, 59%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{17}H_{18}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.06 (s, 1H), 7.59 (ddd, J = 6.5, 2.7, 0.9 Hz, 1H), 7.50 – 7.45 (m, 1H), 7.14 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.37 (d, J = 2.0 Hz, 3H), 1.77 (s, 1H), 1.63 (s, 6H).

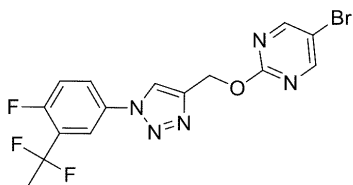
[1191] 실시예 182: 2-[2-[[1-(3-에틸-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1192]

[1193] 1,4-다이옥산 (0.5 mL) 및 물 (0.2 mL) 중의 2-(2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 178, 단계 A로부터의 생성물, 32 mg, 0.08 mmol), 칼륨 에틸트라이플루오로보레이트 (10.7 mg, 0.08 mmol), 제3인산칼륨 (50 mg, 0.24 mmol), RuPhos-Pd-G3 (3.3, 0.004 mmol)의 용액을 질소로 퍼징하여, 밀봉하고, 90℃에서 2일 동안 교반하였다. 반응물을 실리카 플러그를 통해 여과하고, EtOAc로 행군 다음, 감압 하에 증발시켰다. 잔류물을 MeOH에 용해시킨 다음, 분취용 HPLC (길슨, 워터즈 엑스브리지 50 $\times$ 150 mm, 15분에 걸쳐 5 내지 95% MeCN/20 mM NH_4OH , 80 mL/min)에 의해 정제하여, 순수한 생성물을 함유하는 분획을 동결시키고, 2일에 걸쳐 동결 건조시켜, 표제 화합물 (5.7 mg, 20%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{18}H_{20}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 357.2; m/z 실측치, 358.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.59 (dd, J = 6.4, 2.7 Hz, 1H), 7.48 (ddd, J = 8.8, 4.2, 2.8 Hz, 1H), 7.14 (t, J = 8.9 Hz, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.75 (q, J = 8.0 Hz, 2H), 1.62 (s, 6H), 1.28 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

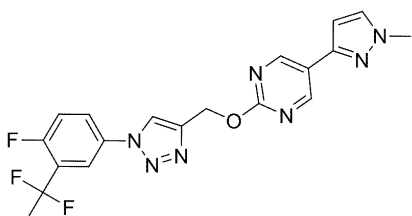
[1194] 실시예 183: 5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1195]

[1196] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 5-브로모-2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}BrF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 413.0; m/z 실측치, 414.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.66 – 8.54 (s, 2H), 8.15 – 8.09 (m, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.37 – 7.28 (m, 1H), 5.69 – 5.58 (m, 2H), 2.14 – 1.94 (m, 3H).

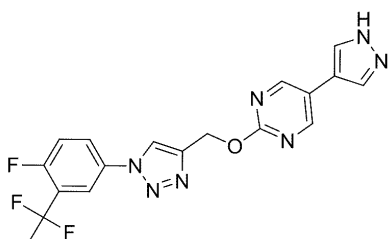
[1197] 실시예 184: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메틸피라졸-3-일)피리미딘.



[1198]

[1199] 바이알에서, THF/ H_2O (3 mL/0.3 mL) 중의 5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘 (실시예 183, 25 mg, 0.060 mmol), 1-메틸-3-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-1H-피라졸 (15.07 mg, 0.072 mmol), Na_2CO_3 (20 mg, 0.181 mmol) 및 $PdCl_2(dppf)$ (4 mg, 0.006 mmol)의 현탁액을 캡핑하여, 마이크로파 조사 하에 1.5시간 동안 100°C에서 가열하였다. 완료된 반응물을 EtOAc로 희석하고, 물, 염수로 세정하여, 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 50% EtOAc로 용리)에 의해, 표제 화합물 (13.8 mg, 55%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{19}H_{16}F_3N_7O$ 에 대한 질량 계산치, 415.1; m/z 실측치, 416.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.96 – 8.90 (s, 2H), 8.17 – 8.12 (s, 1H), 7.94 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.79 (m, 1H), 7.46 – 7.39 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.36 – 7.27 (t, $J = 9.4$ Hz, 1H), 6.55 – 6.48 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 5.74 – 5.67 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.06 – 3.90 (s, 3H), 2.17 – 1.96 (m, 3H).

[1200] 실시예 185: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1H-피라졸-4-일)피리미딘.



[1201]

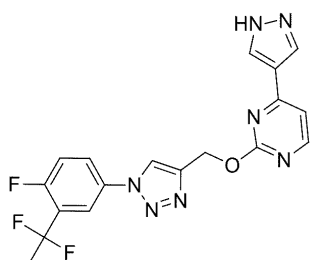
[1202] 단계 A: 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘. 5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘 (실시예 183) 및 1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-4-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-1H-피라졸을 사용하여, 실시예 184와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

MS (ESI): $C_{23}H_{22}F_3N_7O_2$ 에 대한 질량 계산치, 485.2; m/z 실측치, 486.1 $[M+H]^+$.

[1203] 단계 B: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1H-피라졸-4-일)피리미딘. MeOH (3 mL) 중의 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘 (27 mg, 0.06 mmol)의 용액에 3M HCl (3 mL)을 주입하고, 실온에서 4시간 동안 교반하였다. 완료된 반응물을 감압 하에 농축시키고, DCM에 재현탁하였다. 유기물을 포화 $NaHCO_3$ 수용액, 물, 이어서 염수로 세정하였다. 유기물을 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM 중의 0 내지 3% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (15.3 mg, 32%)을 얻었다.

MS (ESI): $C_{18}H_{14}F_3N_7O$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.73 – 8.68 (s, 2H), 8.36 – 8.32 (s, 1H), 7.99 – 7.94 (m, 1H), 7.92 – 7.83 (m, 2H), 7.39 – 7.32 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.72 – 5.63 (s, 2H), 3.40 – 3.32 (s, 2H), 2.15 – 1.97 (t, J = 18.6 Hz, 2H).

[1204] 실시예 186: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘.



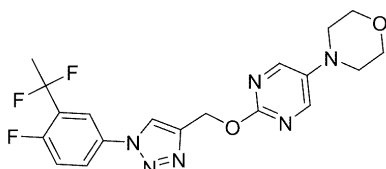
[1205]

[1206] 단계 A: 2-클로로-4-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘. THF (9 mL) 중의 2-클로로-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘 (284 mg, 1.6 mmol) 및 3,4-다이하이드로-2H-피란 (661 mg, 7.9 mmol)을 포함하는 플라스크에, TFA (12 μ L, 0.16 mmol)를 주입하고, 77°C에서 하룻밤 동안 교반하였다. 완료된 반응물을 EtOAc로 희석하고, 물, 염수로 세정하여, 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 60% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (360 mg, 86%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{12}H_{13}ClN_4O$ 에 대한 질량 계산치, 264.1; m/z 실측치, 265.0 $[M+H]^+$.

[1207] 단계 B: 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘. (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 156과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{23}H_{22}F_3N_7O_2$ 에 대한 질량 계산치, 485.2; m/z 실측치, 486.1 $[M+H]^+$.

[1208] 단계 C: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘. 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-(테트라하이드로-2H-피란-2-일)-1H-피라졸-4-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 185, 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{14}F_3N_7O$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.52 – 8.44 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.25 – 8.17 (d, J = 2.6 Hz, 3H), 7.96 – 7.87 (m, 1H), 7.89 – 7.80 (m, 1H), 7.36 – 7.26 (m, 1H), 7.18 – 7.10 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 5.76 – 5.64 (s, 2H), 5.34 – 5.25 (s, 1H), 2.11 – 1.98 (m, 3H).

[1209] 실시예 187: 4-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린.



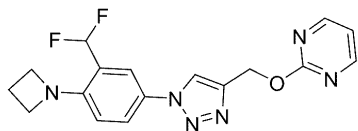
[1210]

[1211]

N_2 하에 바이알에, THF (1 mL) 중의 5-브로모-2-((1-(3-(1,1-다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 183, 28 mg, 0.07 mmol), 모르폴린 (0.01 mL, 0.08 mmol), NaOtBu (8 mg, 0.08 mmol), 2-다이사이클로헥실포스포노-2',6'-다이아이소프로폭시-1,1'-바이페닐[2-(2'-아미노-1,1'-바이페닐)]팔라듐(II) 메탄설포네이트 (RuPhos-Pd-G3) (6 mg, 0.01 mmol), 2-다이사이클로헥실포스포노-2',6'-다이아이소프로폭시바이페닐 (RuPhos) (4 mg, 0.01 mmol)을 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 밀봉하여, 85°C로 가열한 다음, 하룻밤 동안 교반하였다. 이어서, 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 셀라이트® 패드를 통해 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (염기성 HPLC, 애질런트 분취용 시스템, 워터즈 엑스브리지 C18 5 μ m 50×100 mm 컬럼, 22분에 걸쳐서 5 내지 95% MeCN/20 mM NH_4OH , 80 mL/min으로)에 의해, 표제 화합물 (13 mg, 45%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{19}H_{19}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 420.3; m/z 실측치, 421.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.18 – 8.14 (s, 2H), 8.06 – 8.03 (s, 1H), 7.85 – 7.80 (m, 1H), 7.79 – 7.73 (m, 1H), 7.27 – 7.20 (m, 1H), 5.57 – 5.50 (s, 2H), 3.85 – 3.77 (m, 4H), 3.08 – 3.00 (m, 4H), 2.05 – 1.90 (m, 3H).

[1212]

실시예 188: 2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



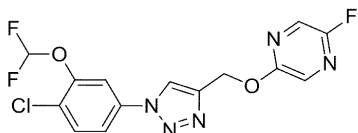
[1213]

[1214]

ACN (2 mL) 중의 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 25, 30 mg, 0.09 mmol)의 용액에 아제티딘 (5.3 mg, 0.09 mmol) 및 DIPEA (30 mg, 0.23 mmol)를 첨가하였다. 생성된 반응 혼합물을 90°C로 가열하고, 하룻밤 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시켜, EtOAc로 희석한 후, NH_4Cl 용액으로 세정하였다. 유기층을 분리하여, 건조시키고 ($MgSO_4$), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산 중의 0 내지 100% 아세트산에틸)에 의해, 표제 화합물 (19 mg, 0.05 mmol, 57%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 358.3; m/z 실측치, 359.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.58 – 8.54 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 8.05 – 8.01 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.75 – 7.70 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.67 – 7.62 (m, 1H), 7.00 – 6.96 (m, 1H), 6.90 – 6.65 (m, 1H), 6.57 – 6.53 (d, J = 8.9 Hz, 1H), 5.68 – 5.62 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 4.14 – 4.08 (m, 4H), 2.45 – 2.36 (m, 2H).

[1215]

실시예 189: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피라진.



[1216]

[1217]

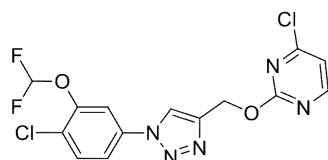
단계 A. 2-클로로-5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피라진. (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2,4-다이클로로피라진을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9Cl_2F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.0 $[M+H]^+$.

[1218]

단계 B. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피라진. DMSO (0.8 mL) 중의 2-클로로-5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피라진

진 (42 mg, 0.108 mmol)의 용액에 CsF (164 mg, 1.1 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 밀봉한 반응 용기에서 2.5 시간 동안 100℃로 가열하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시킨 후, 물, ACN 및 몇 방울의 HCl (1M, aq)로 희석하였다. 정제 (페노메넥스(Phenomenex) C18 제미니(Gemini) 5 μ m, 250×4.6 mm가 구비된 세미 분취용 (semi-prep) RP-HPLC; 0.1% TFA 첨가를 포함하는 수중의 5 내지 95% 아세토니트릴) 후에, NaHCO₃ (aq)를 사용하여 유리 염기로 전환시켜, 표제 화합물 (8 mg, 20%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₄H₉ClF₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CD₃CN) δ 8.47 – 8.36 (m, 1H), 8.27 – 8.19 (m, 1H), 8.10 (dd, *J* = 8.2, 0.7 Hz, 1H), 7.82 – 7.67 (m, 3H), 7.12 (t, *J* = 76 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H).

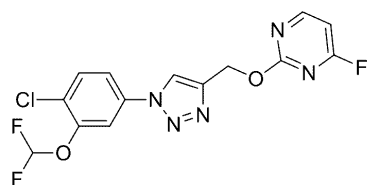
[1219] 실시예 190: 4-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1220]

[1221] 실온에서 ACN (1 mL) 중의 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민 (실시예 382, 25 mg, 0.068 mmol)의 용액에, 아이소펜틸 니트라이트 (0.0137 mL, 0.1 mmol) 및 염화 구리 (II) (9.6 mg, 1.071 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 3시간 동안 가열 환류하였다. 반응 혼합물을 물 (5 mL) 및 몇 방울의 HCl로 희석하여, 시린지 필터 (0.25 μ m)를 통해 여과하였다. 정제 (세미 분취용 HPLC (0.1% TFA 첨가를 포함하는 MeCN 중의 95% 내지 5% 물, 페노메넥스 C18 제미니, 5 μ m, 250×4.6 mm))에 의해 표제 화합물을 얻어, 이를 NaHCO₃ (aq)를 사용한 중화에 의해 유리 염기로 전환시키고, EtOAc로 추출하여, 표제 화합물 (7 mg, 27%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₄H₉Cl₂F₂N₅O₂에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CD₃CN) δ 8.55 – 8.48 (m, 1H), 8.45 (t, *J* = 1.3 Hz, 1H), 7.82 – 7.68 (m, 3H), 7.24 – 7.16 (m, 1H), 6.94 (t, *J* = 60 Hz, 1H), 5.63 (s, 1H).

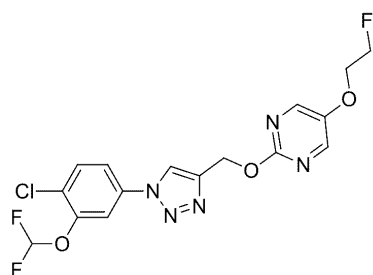
[1222] 실시예 191: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-플루오로-피리미딘.



[1223]

[1224] DMSO 대신에 MeCN을 사용하여, 4-클로로-2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 190)을 사용하여, 실시예 189, 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₉ClF₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.59 (dd, *J* = 11.5, 5.5 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.73 (d, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.66 – 7.62 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 6.69 (dd, *J* = 5.5, 2.6 Hz, 1H), 6.66 (t, *J* = 72.5 Hz, 1H).

[1225] 실시예 192: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘.

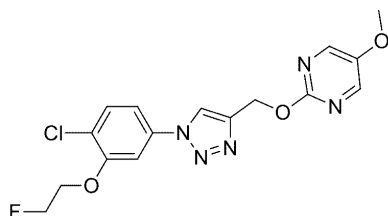


[1226]

[1227] 단계 A. 2-클로로-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘. DMF (2.9 mL) 중의 2-클로로피리미딘-5-올 (1 g, 7.6 mmol) 및 1-플루오로-2-요오도에탄 (1.73 g, 9.9 mmol)의 혼합물에 Cs_2CO_3 (3.2 g, 9.9 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 3시간 동안 격렬하게 교반하였다. 반응 혼합물을 EtOAc (20 mL)로 희석하여, 여과하고, 고체를 EtOAc (20 mL)로 세정하였다. 여과액을 물 (3×30 mL)로 세정하고, 건조시켜 (Na_2SO_4), 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM/EtOAc)에 의해, 백색 고체 (847 mg, 62.6%)로서의 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_6\text{H}_6\text{ClFN}_2\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 176.0; m/z 실측치, 171.1[M+H]⁺.

[1228] 단계 B. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) (41.2 mg, 0.15 mmol) 및 2-클로로-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{ClF}_3\text{N}_5\text{O}_3$ 에 대한 질량 계산치, 415.1; m/z 실측치, 416.1[M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.56 (s, 1H), 8.34 (s, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.75 – 7.66 (m, 3H), 6.87 (m, 1H), 5.59 (s, 2H), 4.81-4.80 (m, 1H), 4.71-4.70 (m, 1H), 4.36 – 4.34 (m, 1H), 4.30 – 4.29 (m, 1H).

[1229] 실시예 193: 2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1230]

[1231] 단계 A. 2-클로로-5-(4-(하이드록시메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-1-일)페놀.

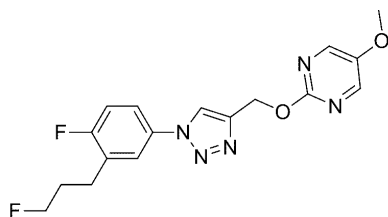
[1232] 건조 DMSO 중의 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) (110 mg, 0.4 mmol) 및 *t*BuOK (134 mg, 1.2 mmol)의 혼합물을 실온에서 15시간 동안 교반하였다. 아세트산 (3 mL)을 첨가하여, 반응물을 채취하였다. 혼합물을 C18 역상 HPLC (TFA 완충 MeCN/물)에 의해 정제하여, 백색 고체 (18 mg, 20%)로서의 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_9\text{H}_8\text{ClN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 225.0; m/z 실측치, 226.1[M+H]⁺.

[1233] 단계 B. (1-(4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올.

[1234] DMF (0.8mL) 중의 2-클로로-5-(4-(하이드록시메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-1-일)페놀 (18 mg, 0.08 mmol) 및 Cs_2CO_3 (65 mg, 0.2 mmol)에, 1-플루오로-2-요오도에탄 (16.6 mg, 0.096 mmol)을 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반한 다음, EtOAc (30 mL)로 희석하여, 물 (3×20 mL)로 세정하고, 건조시켜 (Na_2SO_4), 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM/EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (19 mg, 87%)을 얻었다. MS (ESI): $\text{C}_{11}\text{H}_{11}\text{ClFN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 271.0; m/z 실측치, 272.1[M+H]⁺.

[1235] 단계 C. 2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘. (1-(4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{16}\text{H}_{15}\text{ClFN}_5\text{O}_3$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ 8.39 (s, 1H), 8.25 (s, 2H), 7.52 (t, *J* = 1.1 Hz, 2H), 7.31 (dd, *J* = 8.5, 2.4 Hz, 1H), 5.56 (s, 2H), 4.87 – 4.83 (m, 1H), 4.80 – 4.75 (m, 1H), 4.43 – 4.39 (m, 1H), 4.39 – 4.33 (m, 1H), 3.88 (s, 2H).

[1236] 실시예 194: 2-[[1-[4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1237]

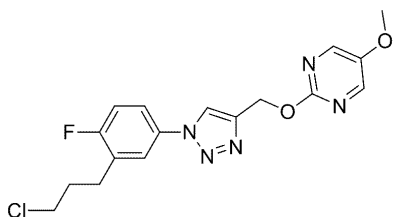
[1238] 단계 A. (E)-2-((1-(4-플루오로-3-(3-((테트라하이드로-2H-피란-2-일)옥시)프로프-1-엔-1-일)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘. 마이크로파관에서 2-((1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘 (실시예 41, 80 mg, 0.21 mmol), (E)-4,4,5,5-테트라메틸-2-(3-((테트라하이드로-2H-피란-2-일)옥시)프로프-1-엔-1-일)-1,3,2-다이옥사보롤란 (84 mg, 0.31 mmol), Pd(PPh₃)₄ (12 mg, 0.01 mmol) 및 Na₂CO₃ 용액 (1.0 M, 0.63 mL, 0.62 mmol)의 혼합물을 마이크로파 조사 하에 110℃에서 20분 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 EtOAc (10 mL)로 희석하고, 물 (2×10 mL)로 세정하였다. 유기 상을 건조시키고 (Na₂SO₄), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산/EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (68 mg, 73.2%)을 얻었다. MS (ESI): C₂₂H₂₄FN₅O₄에 대한 질량 계산치, 441.2; m/z 실측치, 442.3 [M+H]⁺.

[1239] 단계 B. 2-((1-(4-플루오로-3-(3-((테트라하이드로-2H-피란-2-일)옥시)프로필)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘. MeOH (10 mL) 중의 (E)-2-((1-(4-플루오로-3-(3-((테트라하이드로-2H-피란-2-일)옥시)프로프-1-엔-1-일)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘 (22 mg, 0.05 mmol)의 용액을 질소로 퍼징하였다. Pd/C (10%, 30 mg)를 첨가하였다. 혼합물을 수소로 2회 퍼징하였다. 혼합물을 수소 분위기 하에 실온에서 15분 동안 교반하였다. 혼합물을 여과하여, 여과액을 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, 헥산/EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (22 mg, 99%)을 얻었다. MS (ESI): C₂₂H₂₆FN₅O₄에 대한 질량 계산치, 443.2; m/z 실측치, 444.3 [M+H]⁺.

[1240] 단계 C. 3-(2-플루오로-5-(4-(((5-메톡시피리미딘-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-1-일)페닐)프로판-1-올. 실온에서, MeOH (10 mL) 중의 2-((1-(4-플루오로-3-(3-((테트라하이드로-2H-피란-2-일)옥시)프로필)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘 (22 mg, 0.05 mmol)에, 진한 HCl을 적가하였다. 혼합물을 실온에서 15분 동안 교반하였다. 혼합물에 물 0.1 mL를 첨가하여, 휘발성 물질을 감압 하에 제거하고, 고진공 하에 건조시켰다. 정제 (FCC, SiO₂, DCM/메탄올)에 의해, 표제 화합물을 얻었다. C₁₇H₁₈FN₅O₃에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.2 [M+H]⁺.

[1241] 단계 D. 2-((1-(4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘. -78℃에서, DCM (0.2 mL) 중의 3-(2-플루오로-5-(4-(((5-메톡시피리미딘-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트리아졸-1-일)페닐)프로판-1-올 (21 mg, 0.058 mmol)에, (다이에틸아미노)황 트라이플루오라이드 (0.072 mL, 0.6 mmol)를 교반하면서 첨가하였다. 반응물을 교반하면서 실온으로 서서히 가온시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (세미 분취용 RP-HPLC (0.1% TFA 첨가를 포함하는 MeCN 중의 95% 내지 5% 물, 페노메넥스 C18 체미니, 5 μm, 250×4.6 mm)에 의해, 표제 화합물 (1.2 mg, 6%) 및 2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘을 얻었다. MS (ESI): C₁₇H₁₇F₂N₅O₂에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.50 (s, 1H), 8.23 (s, 2H), 7.70 (dd, J = 6.4, 2.8 Hz, 1H), 7.65 – 7.58 (m, 1H), 7.19 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.45 (s, 2H), 4.45 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 4.33 (t, J = 5.9 Hz, 1H), 3.80 (s, 3H), 2.78 (t, J = 7.9 Hz, 2H).

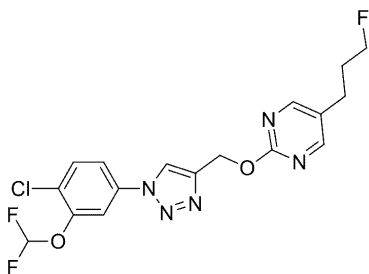
[1242] 실시예 195: 2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1243]

[1244] 실시예 194, 단계 D의 합성의 부산물로서 표제 화합물 (1.3 mg, 6%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}ClFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.62 (s, 1H), 8.35 (s, 2H), 7.82 (dd, $J = 6.3, 2.7$ Hz, 1H), 7.78 – 7.71 (m, 1H), 7.31 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.57 (s, 2H), 3.92 (s, 3H), 3.64 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 2.94 (t, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.15 (ddd, $J = 7.7, 6.3, 1.3$ Hz, 2H).

[1245] 실시예 196: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘.



[1246]

[1247] 단계 A: 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로프-2-인-1-올. DMF (33 mL) 중의 5-브로모-2-메톡시피리미딘 (4.0 g, 21 mmol), 트라이메틸아민 (5.9 mL, 42 mmol), $PdCl_2(PPh_3)_2$ (1.5 g, 2.1 mmol) 및 CuI (0.4 g, 2.1 mmol)의 탈기된 용액에, 프로프-2-인-1-올 (3.1 mL, 53 mmol)을 첨가하였다. 반응물을 밀봉하여, 4시간 동안 90°C로 가열하였다. 반응물을 염수로 희석하여, EtOAc (50 mL $\times$ 3)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시켜, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산/EtOAc; 4 : 1)에 의해, 표제 화합물 (1.8 g, 52%)을 얻었다. MS (ESI): $C_8H_8N_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 164.1; m/z 실측치, $[M+H]^+$ 165.1.

[1248] 단계 B: 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로판-1-올. 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로프-2-인-1-올 (1.8 g, 11 mmol)의 에탄올 용액 (65 mL)을 Pd/C (10% wt, 583 mg)에 첨가하였다. 반응 혼합물을 수소 분위기 하에 (1 atm) 3시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 규조토를 통해 여과하고, 감압 하에 농축시켜, 표제 화합물 (1.5 g, 81%)을 얻었다. MS (ESI): $C_8H_{12}N_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 168.1; m/z 실측치, $[M+H]^+$ 169.1.

[1249] 단계 C: 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로필 4-메틸벤젠설포네이트. DCM (17 mL) 중의 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로판-1-올 (450 mg, 2.7 mmol)의 용액에, 트라이메틸아민 (1.1 mL, 8.0 mmol) 및 설포닐 클로라이드 (1.02 g, 5.35 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 반응물을 $NaHCO_3$ (aq, 25 mL)로 희석하여, 수층을 EtOAc (30 mL $\times$ 3)로 추출하였다. 합한 유기 추출물을 건조시켜, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산/EtOAc; 5 : 1)에 의해, 표제 화합물 (540 mg, 63%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{15}H_{18}N_2O_4S$ 에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, $[M+H]^+$ 323.1.

[1250] 단계 D: 5-(3-플루오로프로필)-2-메톡시피리미딘. THF (10 mL) 중의 3-(2-메톡시피리미딘-5-일)프로필 4-메틸벤젠설포네이트 (750 mg, 2.3 mmol)의 용액에 TBAF (THF 중의 1.0 M, 3.5 mL, 3.5 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 30분 동안 60°C로 가열하였다. 반응 혼합물을 감압 하에 농축시켰다. 조 생성물을 EtOAc (50 mL)로 희석하고, $NaHCO_3$ (aq, 30 mL) 및 염수 (30 mL)로 세정하였다. 합한 유기물을 건조시켜, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산: EtOAc; 5 : 1)에 의해, 표제 화합물 (290 mg, 73%)을 얻었다. MS

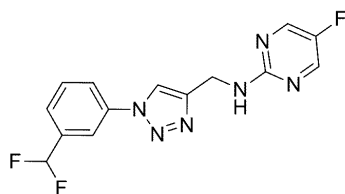
(ESI): $C_8H_{11}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 170.1; m/z 실측치, $[M+H]^+$ 171.1.

[1251] 단계 E: 5-(3-플루오로프로필)피리미딘-2(1H)-온 하이드로클로라이드 염. HCl (다이옥산 중의 4M, 1.1 mL, 4.4 mmol) 및 물 (0.26 mL, 14.7 mmol) 중의 5-(3-플루오로프로필)-2-메톡시피리미딘 (250 mg, 1.47 mmol)의 용액을 5시간 동안 100°C로 가열하였다. 혼합물을 감압 하에 농축시켜, 백색 HCl 염으로서의 표제 화합물을 얻어, 추가의 정제 없이 다음 단계에서 사용하였다. MS (ESI): $C_7H_9FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 156.1; m/z 실측치, $[M+H]^+$ 157.1.

[1252] 단계 F. 2-클로로-5-(3-플루오로프로필)피리미딘. $POCl_3$ (2 mL) 중의 5-(3-플루오로프로필)피리미딘-2(1H)-온 하이드로클로라이드 (120 mg, 0.62 mmol)의 혼합물을 95°C에서 20시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 냉각시키고, 감압 하에 농축시켰다. 잔류물을 EtOAc (30 mL)로 희석하여, $NaHCO_3$ (포화 수용액 3×20 mL)로 세정하였다. 유기물을 건조시켜, 여과하고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , 헥산/EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (66 mg, 66%)을 얻었다. MS (ESI): $C_7H_8ClFN_2$ 에 대한 질량 계산치, 174.0; m/z 실측치, 175.0 $[M+H]^+$.

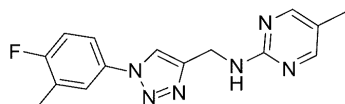
[1253] 단계 G. 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘. (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-(3-플루오로프로필)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.74 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.67 – 7.56 (m, 2H), 6.68 (t, $J = 72.5$ Hz, 1H), 5.67 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.57 (t, $J = 5.7$ Hz, 1H), 4.46 (t, $J = 5.7$ Hz, 1H), 2.76 (t, $J = 7.7$ Hz, 2H), 2.15 – 1.92 (m, 2H).

[1254] 실시예 197: N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-플루오로-피리미딘-2-아민.



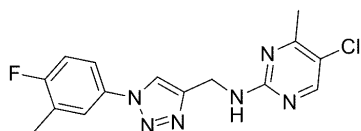
[1255] 2-아미노-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 320.1; m/z 실측치, 321.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (d, $J = 2.2$ Hz, 2H), 7.99 (s, 1H), 7.98 – 7.77 (m, 2H), 7.70 – 7.53 (m, 2H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 4.79 (d, $J = 6.4$ Hz, 2H).

[1257] 실시예 198: N-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메틸]-5-메틸피리미딘-2-아민.



[1258] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 26) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 6과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}FN_6$ 에 대한 질량 계산치, 298.1; m/z 실측치, 299.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.52 – 8.50 (m, 1H), 8.18 – 8.14 (m, 2H), 7.88 – 7.83 (m, 1H), 7.75 – 7.69 (m, 1H), 7.40 – 7.30 (m, 2H), 4.58 (d, $J = 6.1$ Hz, 2H), 2.34 – 2.29 (m, 3H), 2.08 – 2.04 (m, 3H).

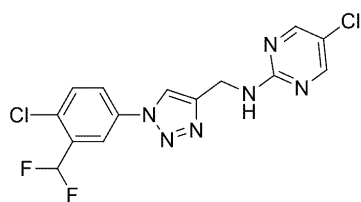
[1260] 실시예 199: 5-클로로-N-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민.



[1261]

[1262] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 26) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 6과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}ClFN_6$ 에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실험치, 332.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.54 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.88 – 7.79 (m, 2H), 7.76 – 7.70 (m, 1H), 7.35 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 4.59 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.32 (d, J = 2.0 Hz, 3H).

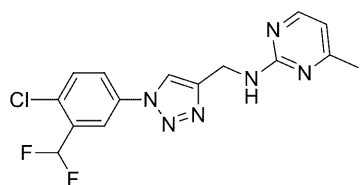
[1263] 실시예 200: 5-클로로-N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



[1264]

[1265] 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}Cl_2F_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 370.0; m/z 실험치, 371.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (s, 2H), 8.00 – 7.95 (m, 2H), 7.90 – 7.83 (m, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.88 (t, J = 6.4 Hz, 1H), 4.79 (d, J = 6.1 Hz, 2H).

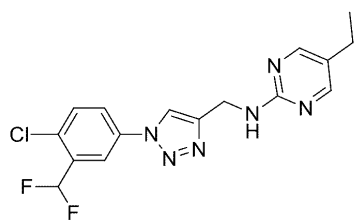
[1266] 실시예 201: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민.



[1267]

[1268] 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClF_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실험치, 351.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.99 – 7.95 (m, 1H), 7.88 – 7.83 (m, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 6.52 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.12 (s, 1H), 4.85 (d, J = 6.1 Hz, 2H), 2.39 (s, 3H).

[1269] 실시예 202: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민.

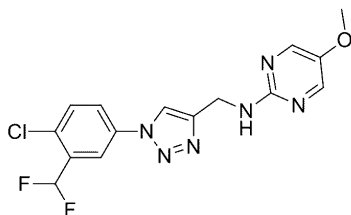


[1270]

[1271] 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClF_2N_6$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실험치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (s, 2H), 8.11 (s, 1H), 7.99 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.85 (dd, J = 8.7, 2.5 Hz, 1H), 7.58 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.10

(s, 1H), 6.97 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 4.89 (d, $J = 5.5$ Hz, 2H), 2.54 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.23 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

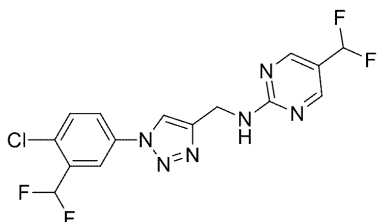
[1272] 실시예 203: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-메톡시-피리미딘-2-아민.



[1273]

[1274] 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 367.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.10 (s, 2H), 7.99 – 7.96 (m, 2H), 7.89 – 7.83 (m, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 1H), 6.98 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 5.55 – 5.42 (m, 1H), 4.78 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H), 3.81 (s, 3H).

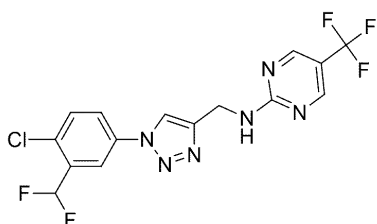
[1275] 실시예 204: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘-2-아민.



[1276]

[1277] 2-클로로-5-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_4N_6$ 에 대한 질량 계산치, 386.1; m/z 실측치, 387.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (s, 2H), 8.02 – 7.99 (m, 1H), 7.98 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 7.89 – 7.84 (m, 1H), 7.60 (dd, $J = 8.6$, 1.0 Hz, 1H), 6.99 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 6.59 (t, $J = 56.0$ Hz, 1H), 6.05 (s, 1H), 4.86 (d, $J = 6.2$ Hz, 2H).

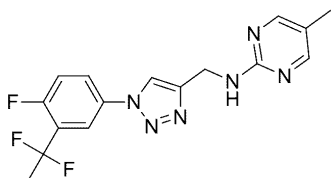
[1278] 실시예 205: N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민.



[1279]

[1280] 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_5N_6$ 에 대한 질량 계산치, 404.1; m/z 실측치, 405.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 2H), 8.02 (s, 1H), 7.98 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 1H), 6.98 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 6.43 – 6.31 (m, 1H), 4.87 (d, $J = 6.0$ Hz, 2H).

[1281] 실시예 206: N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민.

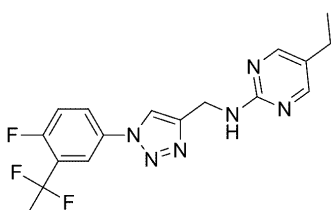


[1282]

[1283] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 20)을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.46 – 8.44 (m, 1H), 8.20 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 8.07 – 8.03 (m, 1H), 8.02 – 7.96 (m, 1H), 7.46 (t, $J = 9.7$ Hz, 1H), 4.74 (s, 2H), 2.16 (s, 3H), 2.06 (td, $J = 18.7, 1.1$ Hz, 3H).

[1284]

실시예 207: N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민.

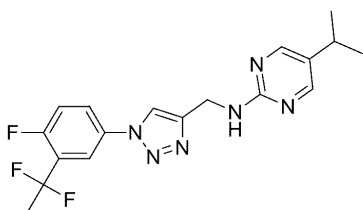


[1285]

[1286] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 20) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 362.1; m/z 실측치, 363.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.45 (s, 1H), 8.22 (s, 2H), 8.07 – 7.95 (m, 2H), 7.45 (t, $J = 9.6$ Hz, 1H), 4.74 (s, 2H), 2.52 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.14 – 1.99 (m, 3H), 1.21 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

[1287]

실시예 208: N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-아이소프로필-피리미딘-2-아민.

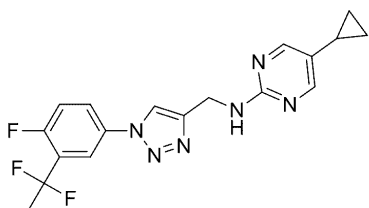


[1288]

[1289] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 20) 및 2-클로로-4-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 376.2; m/z 실측치, 377.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.46 (s, 1H), 8.25 (s, 2H), 8.07 – 8.03 (m, 1H), 8.02 – 7.97 (m, 1H), 7.46 (t, $J = 9.6$ Hz, 1H), 4.75 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.89 – 2.78 (m, 1H), 2.06 (td, $J = 18.7, 1.1$ Hz, 3H), 1.27 (d, $J = 7.0$ Hz, 6H).

[1290]

실시예 209: 5-사이클로프로필-N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



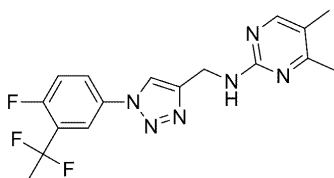
[1291]

[1292]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 20) 및 2-클로로-4-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 374.1; m/z 실측치, 375.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.45 (s, 1H), 8.15 (s, 2H), 8.07 – 8.02 (m, 1H), 8.02 – 7.95 (m, 1H), 7.46 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 4.74 (s, 2H), 2.13 – 1.99 (m, 3H), 1.84 – 1.73 (m, 1H), 0.99 – 0.88 (m, 2H), 0.68 – 0.60 (m, 2H).

[1293]

실시예 210: N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-4,5-다이메틸-피리미딘-2-아민.



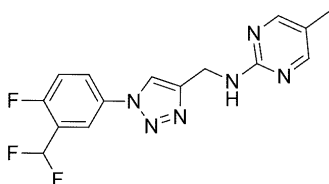
[1294]

[1295]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 20) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 362.1; m/z 실측치, 363.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.44 (s, 1H), 8.07 – 7.96 (m, 3H), 7.49 – 7.42 (m, 1H), 4.74 (s, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.14 – 2.11 (m, 3H), 2.11 – 2.00 (m, 3H).

[1296]

실시예 211: N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민.



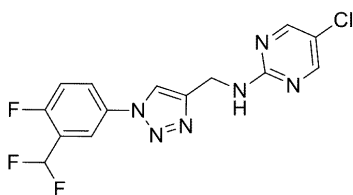
[1297]

[1298]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 334.1; m/z 실측치, 335.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 – 8.16 (m, 2H), 7.96 – 7.94 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 2H), 7.30 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 54.7 Hz, 1H), 5.52 (s, 1H), 4.87 – 4.75 (m, 2H), 2.21 – 2.07 (m, 3H).

[1299]

실시예 212: 5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민.



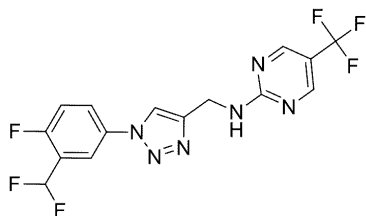
[1300]

[1301]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2,5-다이클로로

피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 354.1; m/z 실측치, 355.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.27 (s, 2H), 7.97 – 7.94 (m, 1H), 7.94 – 7.85 (m, 2H), 7.31 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.73 (s, 1H), 4.79 (d, J = 6.4 Hz, 2H).

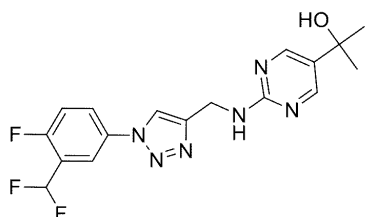
[1302] 실시예 213: N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-아민.



[1303]

[1304] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_6N_6$ 에 대한 질량 계산치, 388.1; m/z 실측치, 389.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (s, 2H), 7.98 (s, 1H), 7.95 – 7.85 (m, 2H), 7.32 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.16 (s, 1H), 4.86 (d, J = 6.5 Hz, 2H).

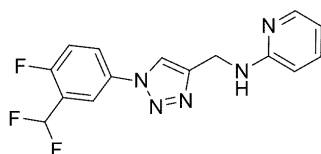
[1305] 실시예 214: 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메틸아미노]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1306]

[1307] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 378.1; m/z 실측치, 379.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.47 (s, 2H), 7.99 – 7.94 (m, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 2H), 7.31 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.94 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.66 (s, 1H), 4.87 – 4.77 (m, 2H), 1.58 (s, 6H).

[1308] 실시예 215. N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민

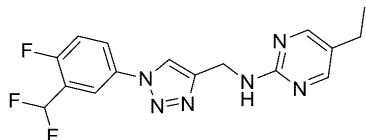


[1309]

[1310] N_2 하에 밀봉관에서, DMF (0.9 mL) 중의 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) (69 mg, 0.29 mmol), 2-요오도피리딘 (0.03 mL, 0.29 mmol), 요오도화구리 (27.1 mg, 0.14 mmol), 1-(5,6,7,8-테트라하이드로퀴놀린-8-일)에탄-1-온 (0.045 mL, 0.29 mmol) 및 Cs_2CO_3 (185.6 mg, 0.57 mmol)의 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 혼합물을 진공 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, EtOAc/헵탄 0 내지 100%) 및 재정제 (HPLC, 고정상: C18 엑스브리지 30 $\times$ 100 mm 5 μ m, 이동상: 수중의 90% 10mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 10% CH_3CN 내지 수중의 0% 10mM NH_4CO_3 pH 9 용액, 100% CH_3CN 의 그래디언트)에 의해,

표제 화합물 (12 mg, 13%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 4.77 (d, J = 5.49 Hz, 2H), 5.06 (br s, 1 H), 6.49 (dt, J = 8.4, 0.9 Hz, 1H), 6.64 (ddd, J = 7.2, 5.0, 0.9 Hz, 1H), 6.77 - 7.09 (m, 1H), 7.31 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.43 (ddd, J = 8.5, 6.9, 1.9 Hz, 1H), 7.82 - 7.91 (m, 1H), 7.93 (dd, J = 5.6, 2.8 Hz, 1H), 7.96 (s, 1 H), 8.08 - 8.26 (m, 1 H).

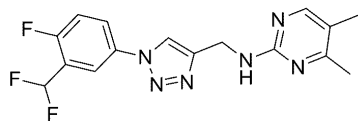
[1311] 실시예 216: N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-에틸피리미딘-2-아민.



[1312]

[1313] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.62 (s, 1H), 8.13 (s, 2H), 8.11 - 7.97 (m, 2H), 7.55 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.45 - 6.88 (m, 2H), 4.53 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.35 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 1.05 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

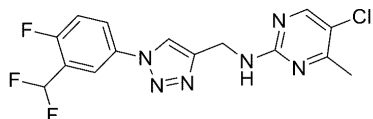
[1314] 실시예 217: N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민.



[1315]

[1316] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.66 (s, 1H), 8.15 (dd, J = 12.0, 4.6 Hz, 2H), 7.99 (s, 1H), 7.62 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 72.0, 1H), 7.24 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 4.59 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.24 (s, 3H), 2.03 (s, 3H).

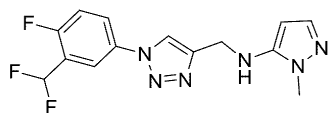
[1317] 실시예 218: 5-클로로-N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4-메틸피리미딘-2-아민.



[1318]

[1319] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_3N_6$ 에 대한 질량 계산치, 368.1; m/z 실측치, 369.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.70 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 8.15 (dd, J = 10.6, 4.7 Hz, 2H), 7.84 (t, J = 5.6 Hz, 1H), 7.63 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 7.29 (t, J = 53.9 Hz, 1H), 4.60 (d, J = 5.9 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H).

[1320] 실시예 219: N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민.



[1321]

[1322]

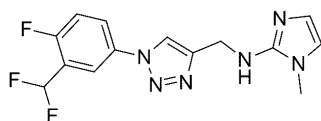
단계 A. 1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) (50 mg, 0.21 mmol) 및 아세트산나트륨 (50.6 mg, 0.62 mmol)의 용액에, 피리디늄 클로로크로메이트 (PCC) (88.6 mg, 0.41 mmol)를 첨가하여, 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 현탁액을 여과하고, 용매를 진공 하에 제거하였다. 조생성물을 정제 없이 사용하였다.

[1323]

단계 B. N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민. MeOH (2.2 mL) 및 AcOH (0.2 mL) 중에 교반하는 1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (42 mg, 0.17 mmol) 및 1-메틸-1H-피라졸-5-아민 (18.9 mg, 0.19 mmol)에, NaBH₃CN을 첨가하고, 혼합물을 실온에서 90분 동안 교반하였다. 현탁액을 여과하고, 용매를 진공 하에 제거하였다. 잔류물을 HPLC ((고정상: C18 엑스브리지 30 × 100 mm 5 μm, 이동상: 수중의 74% 10mM NH₄CO₃H pH 9 용액, 26% CH₃CN 내지 수중의 58% 10mM NH₄CO₃H pH 9 용액, 42% CH₃CN의 그라디언트))에 의해 정제하여, 생성물 (12 mg, 18%)을 얻었다. MS (ESI): C₁₄H₁₃F₃N₆에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, 323.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.20 - 7.75 (m, 3H), 7.45 - 7.29 (m, 1H), 7.58 - 7.29 (m, 1H), 7.17 - 6.77 (m, 1H), 5.59 (s, 1H), 4.49 (s, 2H), 4.03 (br s, 1H), 3.68 (s, 3H).

[1324]

실시예 220: N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-이미다졸-2-아민



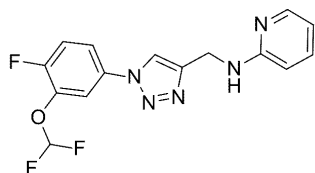
[1325]

[1326]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 21)을 사용하여, 실시예 7과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₁₃F₃N₆에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, 323.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.12 (s, 1H), 7.95 (dd, J = 2.9, 5.8 Hz, 1H), 7.92 - 7.82 (m, 1H), 7.31 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.71 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 6.54 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 4.72 (d, J = 6.4 Hz, 2H), 4.19 (br t, J = 6.1 Hz, 1H), 3.39 (s, 3H).

[1327]

실시예 221: N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민.



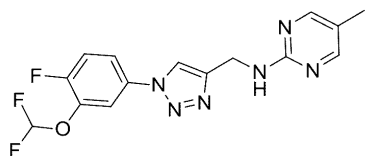
[1328]

[1329]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 18)을 사용하여, 실시예 215와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₂F₃N₅O에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 336.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 4.75 (d, J = 6.1 Hz, 2H) 5.05 (br s, 1H) 6.38 - 6.87 (m, 3H) 7.32 (t, J = 9.3 Hz, 1H) 7.42 (ddd, J = 8.5, 6.9, 1.9 Hz, 1H) 7.50 - 7.61 (m, 1H) 7.67 (dd, J = 6.7, 2.6 Hz, 1H) 7.9 (s, 1H) 8.07 - 8.26 (m, 1H).

[1330]

실시예 222: N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민.



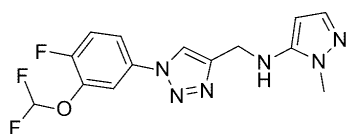
[1331]

[1332]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 18) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 350.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8.63 (s, 1H), 8.17 (s, 2H), 8.04 – 7.90 (m, 1H), 7.91 – 7.77 (m, 1H), 7.64 (t, J = 9.6 Hz, 1H), 7.46 – 7.35 (m, 1H), 7.38 (t, J = 72.5 Hz, 1H), 4.59 (d, J = 6.0 Hz, 2H), 2.06 (s, 3H).

[1333]

실시예 223: N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민.



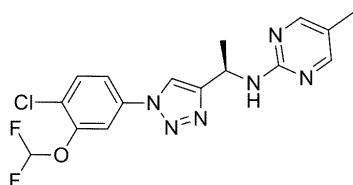
[1334]

[1335]

단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄아민 (중간체 18)을 사용하여, 실시예 219와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 338.1; m/z 실측치, 339.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 7.88 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 2.5, 6.5 Hz, 1H), 7.62 – 7.53 (m, 1H), 7.35 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.30 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 6.65 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.57 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 4.48 (s, 2H), 3.95 (br s, 1H), 3.68 (s, 3H).

[1336]

실시예 224: N-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민.



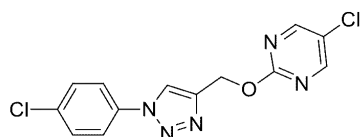
[1337]

[1338]

(R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-아민 (중간체 24) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 154와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.11 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 7.87 – 7.82 (s, 1H), 7.69 – 7.65 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.61 – 7.51 (m, 2H), 6.78 – 6.45 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 5.46 – 5.36 (m, 2H), 2.17 – 2.10 (t, J = 0.7 Hz, 3H), 1.77 – 1.68 (d, J = 6.6 Hz, 3H).

[1339]

실시예 225: 5-클로로-2-[[1-(4-클로로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



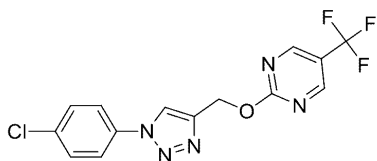
[1340]

[1341]

(1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9Cl_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 321.0; m/z 실측치,

322.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.49 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.71 – 7.63 (m, 2H), 7.53 – 7.45 (m, 2H), 5.62 (d, *J* = 0.7 Hz, 2H).

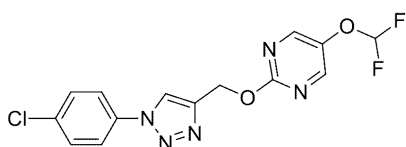
[1342] 실시예 226: 2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[1343]

[1344] (1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₉ClF₃N₅O에 대한 질량 계산치, 355.0; *m/z* 실측치, 356.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.82 (d, *J* = 0.8 Hz, 2H), 8.11 (s, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 2H), 7.54 – 7.49 (m, 2H), 5.73 (d, *J* = 0.7 Hz, 2H).

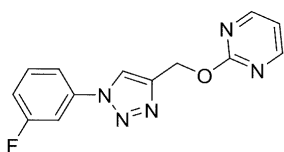
[1345] 실시예 227: 2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘.



[1346]

[1347] (1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₁₀ClF₂N₅O₂에 대한 질량 계산치, 353.0; *m/z* 실측치, 354.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.46 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.73 – 7.68 (m, 2H), 7.55 – 7.50 (m, 2H), 6.55 (t, *J* = 71.9 Hz, 1H), 5.67 (d, *J* = 0.7 Hz, 2H).

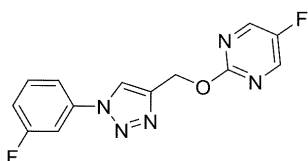
[1348] 실시예 228: 2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1349]

[1350] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₃H₁₀FN₅O에 대한 질량 계산치, 271.1; *m/z* 실측치, 272.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.98 (s, 1H), 8.66 (d, *J* = 4.8 Hz, 2H), 7.87 (dt, *J* = 10.0, 2.3 Hz, 1H), 7.82 (ddd, *J* = 8.0, 2.0, 0.8 Hz, 1H), 7.66 (td, *J* = 8.3, 6.3 Hz, 1H), 7.36 (tdd, *J* = 8.6, 2.6, 0.9 Hz, 1H), 7.20 (t, *J* = 4.8 Hz, 1H), 5.54 (d, *J* = 0.6 Hz, 2H).

[1351] 실시예 229: 5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

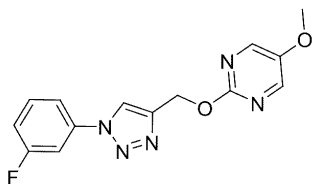


[1352]

[1353] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₃H₉F₂N₅O에 대한 질량 계산치, 289.1; *m/z* 실측치, 290.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8.97 (d, *J* = 0.6 Hz, 1H), 8.75 (d, *J* = 0.7 Hz,

2H), 7.86 (dt, $J = 10.0, 2.3$ Hz, 1H), 7.82 (ddd, $J = 8.1, 2.1, 0.9$ Hz, 1H), 7.66 (td, $J = 8.3, 6.3$ Hz, 1H), 7.36 (tdd, $J = 8.5, 2.5, 0.9$ Hz, 1H), 5.52 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H).

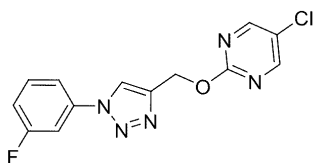
[1354] 실시예 230: 2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1355]

[1356] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실측치, 302.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.96 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.91 - 7.78 (m, 2H), 7.65 (td, $J = 8.2, 6.3$ Hz, 1H), 7.36 (tdd, $J = 8.5, 2.5, 0.9$ Hz, 1H), 5.47 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 3.86 (s, 3H).

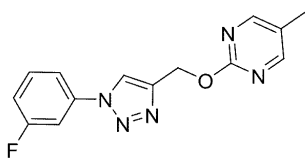
[1357] 실시예 231: 5-클로로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1358]

[1359] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_6Cl_2FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 305.0; m/z 실측치, 306.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.97 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.77 (s, 2H), 7.86 (dt, $J = 10.0, 2.3$ Hz, 1H), 7.82 (ddd, $J = 8.1, 2.1, 0.9$ Hz, 1H), 7.66 (td, $J = 8.3, 6.3$ Hz, 1H), 7.36 (tdd, $J = 8.5, 2.5, 0.9$ Hz, 1H), 5.55 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H).

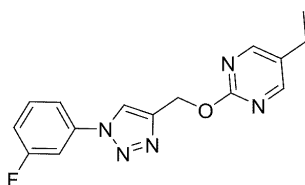
[1360] 실시예 232: 2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1361]

[1362] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실측치, 286.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.97 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 7.87 (dt, $J = 10.0, 2.3$ Hz, 1H), 7.82 (ddd, $J = 8.1, 2.2, 0.9$ Hz, 1H), 7.65 (td, $J = 8.2, 6.2$ Hz, 1H), 7.36 (tdd, $J = 8.5, 2.5, 0.9$ Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.21 (s, 3H).

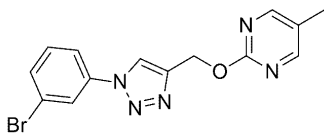
[1363] 실시예 233: 5-에틸-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1364]

[1365] (1-(3-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 41) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.97 (s, 1H), 8.53 (s, 2H), 7.87 (dt, $J = 10.0$, 2.3 Hz, 1H), 7.82 (ddd, $J = 8.1$, 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.65 (td, $J = 8.2$, 6.2 Hz, 1H), 7.36 (tdd, $J = 8.5$, 2.5, 0.9 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.57 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

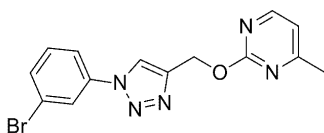
[1366] 실시예 234: 2-[[1-(3-브로모페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1367]

[1368] (1-(3-브로모페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}BrN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.0; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.11 (s, 1H), 7.96 – 7.91 (m, 1H), 7.68 (dd, $J = 8.1$, 1.0 Hz, 1H), 7.57 (dd, $J = 8.0$, 0.5 Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 8.1$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.26 (s, 3H).

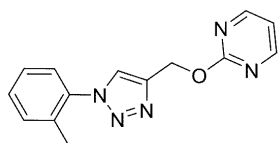
[1369] 실시예 235: 2-[[1-(3-브로모페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1370]

[1371] (1-(3-브로모페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}BrN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.0; m/z 실측치, 347.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.68 (d, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.57 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.40 (t, $J = 8.1$ Hz, 1H), 6.86 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.49 (s, 3H).

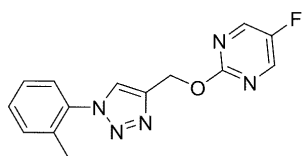
[1372] 실시예 236: 2-[[1-(o-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1373]

[1374] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 267.1; m/z 실측치, 268.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.66 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 8.60 (s, 1H), 7.52 – 7.39 (m, 4H), 7.20 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 2.15 (s, 3H).

[1375] 실시예 237: 5-플루오로-2-[[1-(o-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

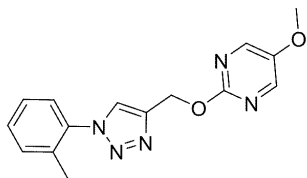


[1376]

[1377] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여,

실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실측치, 286.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.75 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 8.60 (s, 1H), 7.55 - 7.35 (m, 4H), 5.51 (s, 2H), 2.15 (s, 3H).

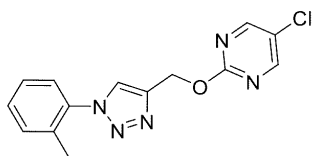
[1378] 실시예 238: 5-메톡시-2-[[1-(*o*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1379]

[1380] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.57 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.59 - 7.37 (m, 4H), 5.46 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.15 (s, 3H).

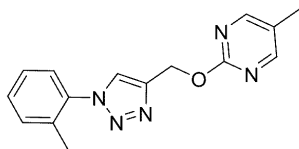
[1381] 실시예 239: 5-클로로-2-[[1-(*o*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1382]

[1383] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실측치, 302.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.76 (s, 2H), 8.61 (s, 1H), 7.56 - 7.36 (m, 4H), 5.54 (s, 2H), 2.15 (s, 3H).

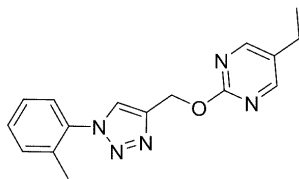
[1384] 실시예 240: 5-메틸-2-[[1-(*o*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1385]

[1386] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, 282.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.58 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.56 - 7.37 (m, 4H), 5.49 (s, 2H), 2.21 (d, $J = 0.8$ Hz, 3H), 2.15 (s, 3H).

[1387] 실시예 241: 5-에틸-2-[[1-(*o*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

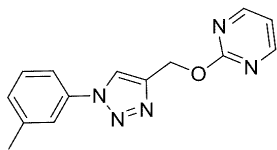


[1388]

[1389] (1-(2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 38) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측

치, $296.1[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.58 (s, 1H), 8.52 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 7.55 - 7.37 (m, 4H), 5.50 (s, 2H), 2.57 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

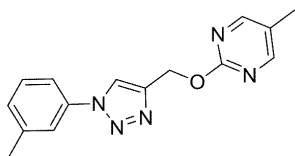
[1390] 실시예 242: 2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1391]

[1392] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 267.1; m/z 실측치, $268.1[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.89 (s, 1H), 8.66 (d, J = 4.7 Hz, 2H), 7.76 (td, J = 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.70 (dt, J = 7.9, 1.6 Hz, 1H), 7.48 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.32 (ddt, J = 7.6, 1.7, 0.9 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.42 (d, J = 0.7 Hz, 3H).

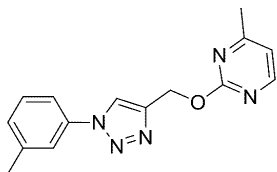
[1393] 실시예 243: 5-메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1394]

[1395] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, $282.2[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.87 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 7.75 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 8.0, 2.2 Hz, 1H), 7.47 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.37 - 7.26 (m, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.21 (s, 3H).

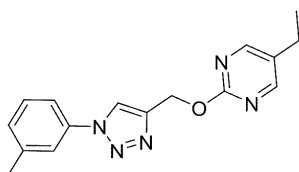
[1396] 실시예 244: 4-메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1397]

[1398] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, $282.2[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.87 (s, 1H), 8.49 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.76 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.70 (dd, J = 8.0, 2.1 Hz, 1H), 7.48 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.42 (d, J = 5.7 Hz, 6H).

[1399] 실시예 245: 5-에틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

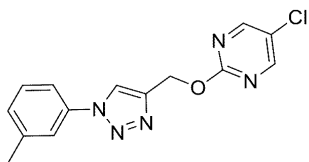


[1400]

[1401] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1

과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측치, 296.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.87 (s, 1H), 8.53 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 7.79 - 7.73 (m, 1H), 7.70 (ddt, $J = 8.2, 1.7, 0.8$ Hz, 1H), 7.47 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.31 (ddt, $J = 7.7, 1.8, 0.9$ Hz, 1H), 5.55 - 5.41 (m, 2H), 2.57 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

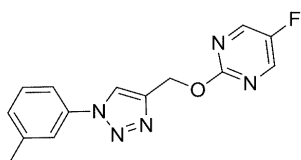
[1402] 실시예 246: 5-클로로-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1403]

[1404] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실측치, 302.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.88 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 7.75 (dq, $J = 2.2, 1.1$ Hz, 1H), 7.72 - 7.66 (m, 1H), 7.48 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.32 (ddt, $J = 7.6, 1.7, 0.8$ Hz, 1H), 5.53 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.42 (d, $J = 0.7$ Hz, 3H).

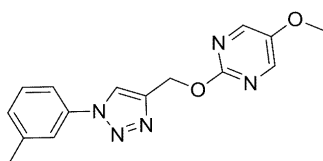
[1405] 실시예 247: 5-플루오로-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1406]

[1407] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실측치, 286.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.88 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 7.75 (tq, $J = 1.5, 0.7$ Hz, 1H), 7.69 (ddt, $J = 8.1, 2.3, 0.9$ Hz, 1H), 7.48 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.32 (ddt, $J = 7.6, 1.8, 0.9$ Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.42 (d, $J = 0.7$ Hz, 3H).

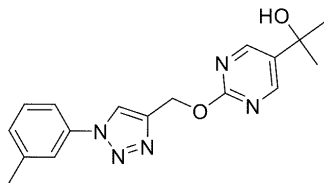
[1408] 실시예 248: 5-메톡시-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1409]

[1410] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.75 (d, $J = 1.9$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 8.1, 2.2$ Hz, 1H), 7.47 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.31 (ddt, $J = 7.6, 1.8, 0.9$ Hz, 1H), 5.46 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.42 (s, 3H).

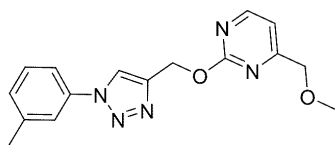
[1411] 실시예 249: 2-[2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1412]

[1413] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{19}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.3 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.72 (d, J = 3.0 Hz, 2H), 8.64 (d, J = 2.9 Hz, 1H), 7.68 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.62 (dd, J = 8.1, 2.2 Hz, 1H), 7.44 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 4.89 (d, J = 2.8 Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 1.58 (d, J = 3.2 Hz, 6H).

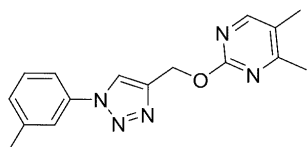
[1414] 실시예 250: 4-(메톡시메틸)-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1415]

[1416] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.62 (s, 1H), 8.56 (dd, J = 5.1, 1.4 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.1, 2.1 Hz, 1H), 7.42 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.29 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 7.20 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 4.50 (s, 2H), 3.48 (m, J = 1.5 Hz, 3H), 2.43 (s, 3H).

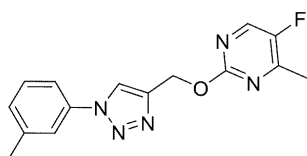
[1417] 실시예 251: 4,5-다이메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1418]

[1419] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측치, 296.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.85 (s, 1H), 8.30 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.75 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.69 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.47 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.35 - 7.28 (m, 1H), 5.46 (s, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

[1420] 실시예 252: 5-플루오로-4-메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

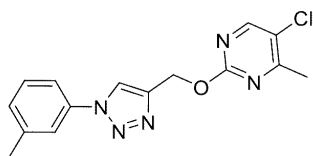


[1421]

[1422] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-4-메틸-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 (s, 1H), 8.56 (d, J = 1.5 Hz, 1H),

7.76 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 7.9, 2.2$ Hz, 1H), 7.48 (td, $J = 7.8, 5.0$ Hz, 1H), 7.32 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.44 (d, $J = 2.6$ Hz, 3H), 2.42 (s, 3H).

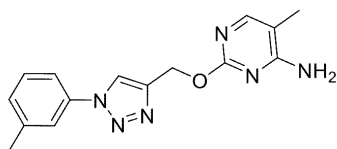
[1423] 실시예 253: 5-클로로-4-메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1424]

[1425] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.88 (s, 1H), 8.63 (d, $J = 1.3$ Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.69 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.48 (t, $J = 7.7$ Hz, 1H), 7.32 (d, $J = 7.8$ Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.43 (d, $J = 8.5$ Hz, 6H).

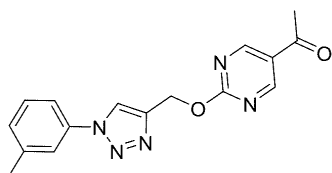
[1426] 실시예 254: 5-메틸-2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1427]

[1428] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{16}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1; m/z 실측치, 297.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.84 (s, 1H), 7.78 - 7.72 (m, 2H), 7.69 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.47 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.37 - 7.25 (m, 1H), 6.76 (s, 2H), 5.33 (s, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.92 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H).

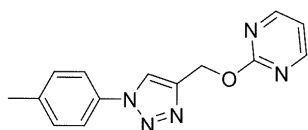
[1429] 실시예 255: 1-[2-[[1-(*m*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄온.



[1430]

[1431] (1-(*m*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 32) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-온을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 309.1; m/z 실측치, 310.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 9.17 (s, 2H), 8.68 (s, 1H), 7.71 (s, 1H), 7.65 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.47 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.35 (d, $J = 7.6$ Hz, 1H), 5.74 (s, 2H), 2.62 (d, $J = 3.2$ Hz, 3H), 2.48 (s, 3H).

[1432] 실시예 256: 2-[[1-(*p*-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

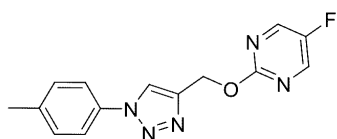


[1433]

[1434] (1-(*p*-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 267.1; m/z 실측치, 268.1

$[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.86 (s, 1H), 8.66 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.85 - 7.73 (m, 2H), 7.47 - 7.35 (m, 2H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.38 (s, 3H).

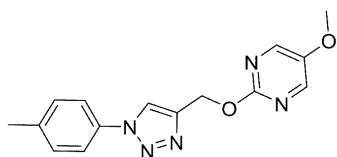
[1435] 실시예 257: 5-플루오로-2-[[1-(p-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1436]

(1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실험치, 286.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.86 (s, 1H), 8.74 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 7.84 - 7.72 (m, 2H), 7.44 - 7.34 (m, 2H), 5.57 - 5.43 (m, 2H), 2.38 (s, 3H).

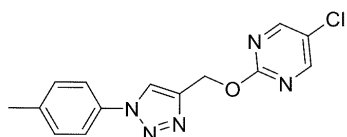
[1438] 실시예 258: 5-메톡시-2-[[1-(p-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1439]

(1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실험치, 298.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.84 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.88 - 7.72 (m, 2H), 7.46 - 7.30 (m, 2H), 5.45 (d, J = 0.5 Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.38 (s, 3H).

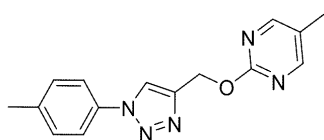
[1441] 실시예 259: 5-클로로-2-[[1-(p-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1442]

(1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 301.1; m/z 실험치, 302.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.86 (s, 1H), 8.76 (s, 2H), 7.84 - 7.69 (m, 2H), 7.44 - 7.29 (m, 2H), 5.53 (d, J = 0.5 Hz, 2H), 2.38 (s, 3H).

[1444] 실시예 260: 5-메틸-2-[[1-(p-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

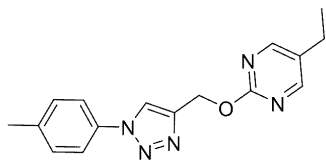


[1445]

(1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{15}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실험치, 282.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.84 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 8.49 (q, J = 0.7 Hz, 2H), 7.84 - 7.70 (m, 2H), 7.45 - 7.36 (m, 2H), 5.48 (d, J = 0.5 Hz, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.21 (d, J = 0.8 Hz, 3H).

[1446]

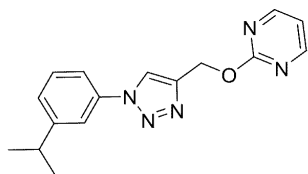
[1447] 실시예 261: 5-에틸-2-[[1-(p-톨릴)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1448]

[1449] (1-(p-톨릴)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 33) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측치, 296.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.85 (s, 1H), 8.52 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 7.85 - 7.73 (m, 2H), 7.44 - 7.33 (m, 2H), 5.54 - 5.29 (m, 2H), 2.63 - 2.53 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

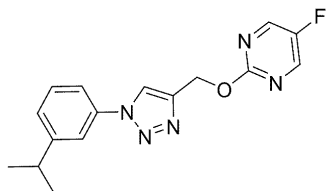
[1450] 실시예 262: 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1451]

[1452] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측치, 296.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.93 (s, 1H), 8.67 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.78 (t, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.71 (ddd, $J = 8.1, 2.4, 1.1$ Hz, 1H), 7.51 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.42 - 7.33 (m, 1H), 7.20 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 3.01 (p, $J = 7.0$ Hz, 1H), 1.26 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

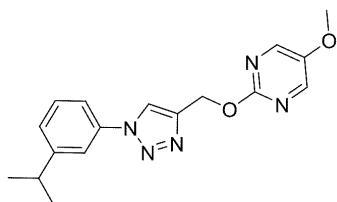
[1453] 실시예 263: 5-플루오로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1454]

[1455] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.65 (s, 1H), 8.57 (s, 2H), 7.72 (t, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.64 (ddd, $J = 8.0, 2.3, 1.1$ Hz, 1H), 7.49 (t, $J = 7.9$ Hz, 1H), 7.44 - 7.34 (m, 1H), 5.59 (s, 2H), 3.03 (p, $J = 6.9$ Hz, 1H), 1.31 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

[1456] 실시예 264: 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.

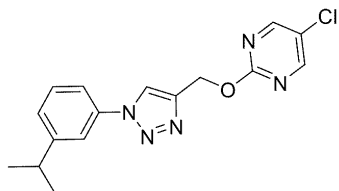


[1457]

[1458] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{19}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치,

325.2; m/z 실측치, 326.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.90 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.78 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.71 (ddd, J = 8.0, 2.3, 1.1 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.42 - 7.35 (m, 1H), 5.46 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 3.01 (p, J = 6.9 Hz, 1H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 6H).

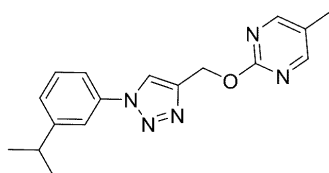
[1459] 실시예 265: 5-클로로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1460]

[1461] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₆ClN₅O에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.92 (s, 1H), 8.77 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 7.77 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.74 - 7.66 (m, 1H), 7.51 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.39 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.54 (s, 2H), 3.00 (h, J = 6.9 Hz, 1H), 1.31 - 1.14 (m, 6H).

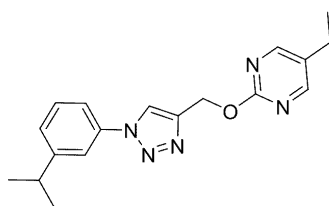
[1462] 실시예 266: 2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1463]

[1464] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₇H₁₉N₅O에 대한 질량 계산치, 309.2; m/z 실측치, 310.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.91 (s, 1H), 8.49 (s, 2H), 7.78 (t, J = 2.0 Hz, 1H), 7.75 - 7.69 (m, 1H), 7.51 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 7.7 Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 3.01 (p, J = 6.7 Hz, 1H), 2.21 (s, 3H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 6H).

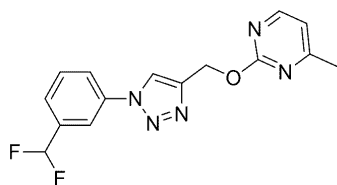
[1465] 실시예 267: 5-에틸-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1466]

[1467] (1-(3-아이소프로필페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 44) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₈H₂₁N₅O에 대한 질량 계산치, 323.2; m/z 실측치, 324.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.92 (s, 1H), 8.53 (s, 2H), 7.78 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 7.75 - 7.69 (m, 1H), 7.51 (t, J = 7.9 Hz, 1H), 7.43 - 7.36 (m, 1H), 5.50 (s, 2H), 3.02 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 2.57 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 1.26 (d, J = 6.9 Hz, 6H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

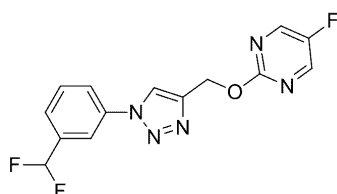
[1468] 실시예 268: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1469]

[1470] 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사하게 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.92 – 7.89 (m, 1H), 7.89 – 7.85 (m, 1H), 7.66 – 7.61 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 6.86 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 6.73 (t, $J = 56.2$ Hz, 1H), 5.67 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.49 (s, 3H).

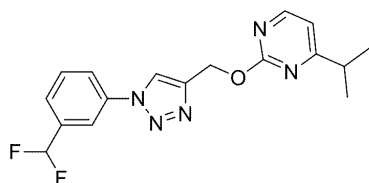
[1471] 실시예 269: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1472]

[1473] 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 321.1; m/z 실측치, 322.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.18 – 8.15 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 2H), 7.67 – 7.57 (m, 2H), 6.73 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

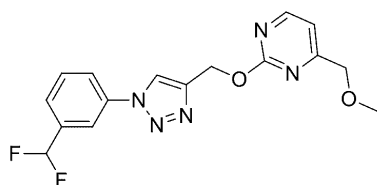
[1474] 실시예 270: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘.



[1475]

[1476] 2-클로로-4-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.92 – 7.89 (m, 1H), 7.88 – 7.84 (m, 1H), 7.65 – 7.60 (m, 1H), 7.59 – 7.55 (m, 1H), 6.86 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.96 (hept, $J = 6.9$ Hz, 1H), 1.29 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

[1477] 실시예 271: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.

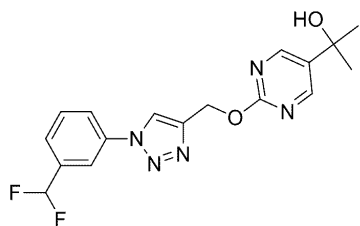


[1478]

[1479] 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.93 – 7.84 (m, 2H), 7.67 – 7.56 (m, 2H), 7.15 (d, $J = 5.1$ Hz,

1H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.50 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.49 (s, 3H).

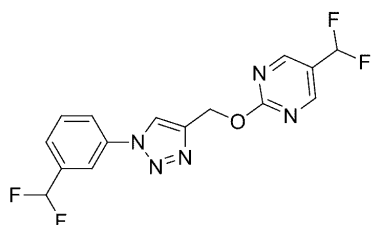
[1480] 실시예 272: 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1481]

[1482] 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 7.94 – 7.84 (m, 2H), 7.68 – 7.56 (m, 2H), 6.73 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.67 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 1.63 (s, 6H).

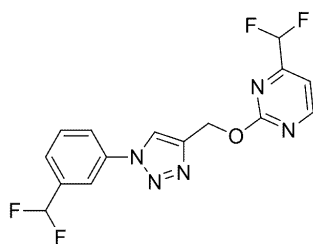
[1483] 실시예 273: 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1484]

[1485] 2-클로로-5-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.72 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 7.94 – 7.85 (m, 2H), 7.69 – 7.57 (m, 2H), 6.89 – 6.57 (m, 2H), 5.73 (s, 2H).

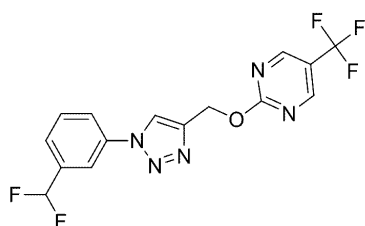
[1486] 실시예 274: 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1487]

[1488] 2-클로로-4-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.94 – 7.84 (m, 2H), 7.63 (dt, $J = 16.0, 7.7$ Hz, 2H), 7.30 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 6.88 – 6.34 (m, 2H), 5.71 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

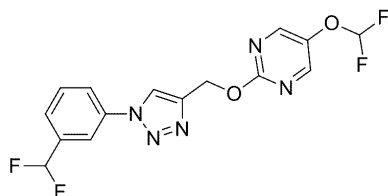
[1489] 실시예 275: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[1490]

[1491] 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.82 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 8.19 (s, 1H), 7.94 – 7.85 (m, 2H), 7.71 – 7.57 (m, 2H), 6.73 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.75 (s, 2H).

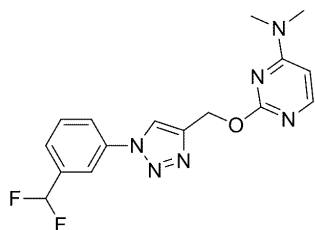
[1492] 실시예 276: 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1493]

[1494] 2-클로로-5-다이플루오로메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.48 – 8.43 (m, 2H), 8.21 – 8.14 (m, 1H), 7.96 – 7.84 (m, 2H), 7.69 – 7.57 (m, 2H), 6.89 – 6.34 (m, 2H), 5.67 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

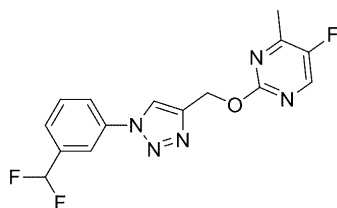
[1495] 실시예 277: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



[1496]

[1497] 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 346.1; m/z 실측치, 347.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 8.03 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 1H), 7.66 – 7.55 (m, 2H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 6.13 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 5.62 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.11 (s, 6H).

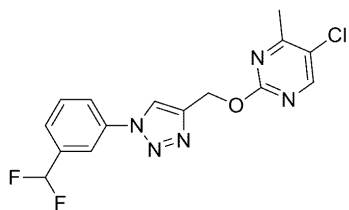
[1498] 실시예 278: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[1499]

[1500] 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 336.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 2H), 7.67 – 7.57 (m, 2H), 6.73 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.62 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.49 (d, $J = 2.5$ Hz, 3H).

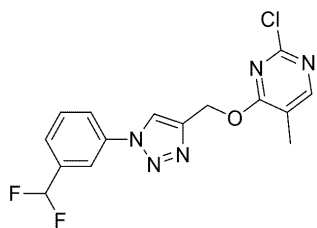
[1501] 실시예 279: 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1502]

[1503] 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.93 – 7.84 (m, 2H), 7.68 – 7.56 (m, 2H), 6.73 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.56 (s, 3H).

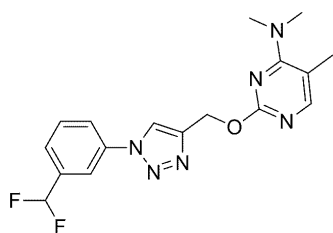
[1504] 실시예 280: 2-클로로-4-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1505]

[1506] 2,4-다이클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 – 8.19 (m, 1H), 8.17 – 8.14 (m, 1H), 7.95 – 7.91 (m, 1H), 7.89 – 7.85 (m, 1H), 7.68 – 7.63 (m, 1H), 7.62 – 7.60 (m, 1H), 6.74 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 0.5 Hz, 2H), 2.14 (d, J = 0.9 Hz, 3H).

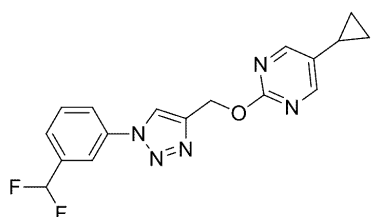
[1507] 실시예 281: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민.



[1508]

[1509] 2-클로로-N,N,5-트라이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{18}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 360.2; m/z 실측치, 361.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.87 – 7.82 (m, 1H), 7.67 – 7.53 (m, 2H), 6.72 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 3.13 (s, 6H), 2.25 (s, 3H).

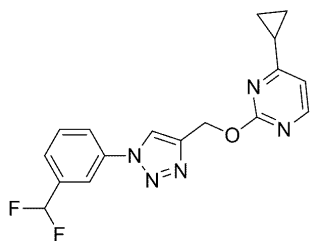
[1510] 실시예 282: 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1511]

[1512] 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.74 (d, $J = 1.4$ Hz, 2H), 8.58 (s, 1H), 8.34 – 8.31 (m, 1H), 8.30 – 8.27 (m, 1H), 8.08 – 8.02 (m, 1H), 8.02 – 7.97 (m, 1H), 7.14 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 6.06 (s, 2H), 2.29 – 2.21 (m, 1H), 1.47 – 1.41 (m, 2H), 1.15 – 1.09 (m, 2H).

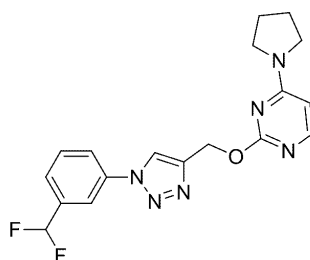
[1513] 실시예 283: 4-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1514]

[1515] 2-클로로-4-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.31 (dd, $J = 5.1, 1.1$ Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.92 – 7.89 (m, 1H), 7.88 – 7.84 (m, 1H), 7.66 – 7.61 (m, 1H), 7.60 – 7.57 (m, 1H), 6.86 (dd, $J = 5.2, 1.0$ Hz, 1H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 5.61 (s, 2H), 1.96 (ttt, $J = 8.0, 4.7, 1.0$ Hz, 1H), 1.22 – 1.17 (m, 2H), 1.10 – 1.06 (m, 2H).

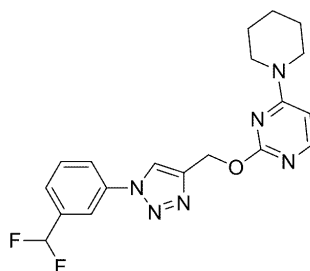
[1516] 실시예 284: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



[1517]

[1518] 2-클로로-4-사이클로프로필피리미딘 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 372.2; m/z 실측치, 373.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 (s, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.88 – 7.83 (m, 1H), 7.66 – 7.56 (m, 2H), 6.72 (t, $J = 56.1$ Hz, 1H), 6.00 (d, $J = 5.9$ Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 3.63 (s, 2H), 3.42 – 3.27 (m, 2H), 2.11 – 1.89 (m, 4H).

[1519] 실시예 285: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘.

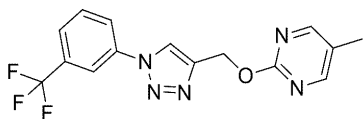


[1520]

[1521] 2-클로로-4-(피페리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{20}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 386.2; m/z 실측치, 387.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 8.01 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 1H), 7.67 – 7.54 (m, 2H), 6.72 (t,

$J = 56.1$ Hz, 1H), 6.19 (d, $J = 6.2$ Hz, 1H), 5.59 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.71 – 3.56 (m, 4H), 1.75 – 1.56 (m, 6H).

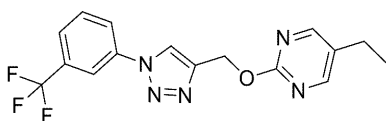
[1522] 실시예 286: 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1523]

[1524] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 335.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.10 (s, 1H), 8.51 – 8.49 (m, 2H), 8.33 – 8.26 (m, 2H), 7.92 – 7.82 (m, 2H), 5.52 (s, 2H), 2.22 (t, $J = 0.8$ Hz, 3H).

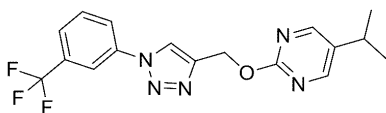
[1525] 실시예 287: 5-에틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1526]

[1527] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 349.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.10 (s, 1H), 8.54 – 8.52 (m, 2H), 8.32 – 8.30 (m, 1H), 8.30 – 8.26 (m, 1H), 7.90 – 7.83 (m, 2H), 5.52 (s, 2H), 2.58 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

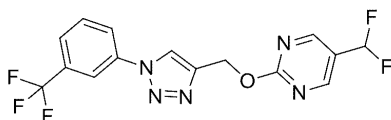
[1528] 실시예 288: 5-아이소프로필-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1529]

[1530] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 363.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.10 (s, 1H), 8.58 – 8.56 (m, 2H), 8.32 – 8.30 (m, 1H), 8.30 – 8.26 (m, 1H), 7.91 – 7.82 (m, 2H), 5.53 (s, 2H), 2.98 – 2.87 (m, 1H), 1.24 (d, $J = 7.0$ Hz, 6H).

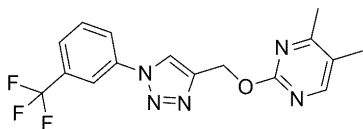
[1531] 실시예 289: 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1532]

[1533] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 371.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.13 (s, 1H), 8.91 – 8.90 (m, 2H), 8.32 – 8.30 (m, 1H), 8.29 – 8.26 (m, 1H), 7.91 – 7.83 (m, 2H), 7.16 (t, $J = 55.0$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H).

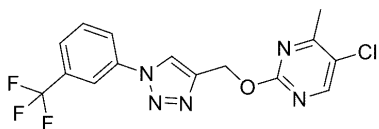
[1534] 실시예 290: 4,5-다이메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1535]

[1536] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 349.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.08 (s, 1H), 8.33 – 8.25 (m, 3H), 7.90 – 7.82 (m, 2H), 5.50 (s, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

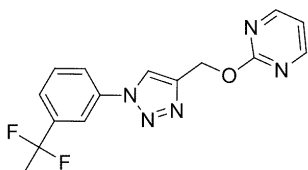
[1537] 실시예 291: 5-클로로-4-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1538]

[1539] (1-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 30) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 369.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.09 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.31 – 8.29 (m, 1H), 8.29 – 8.26 (m, 1H), 7.90 – 7.82 (m, 2H), 5.54 (s, 2H), 2.51 (s, 3H).

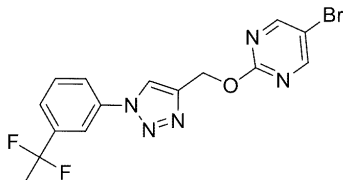
[1540] 실시예 292: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1541]

[1542] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.58 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 8.25 – 8.08 (m, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.74 (m, 1H), 7.70 – 7.51 (m, 2H), 7.01 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.68 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 1.98 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

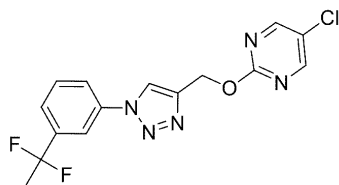
[1543] 실시예 293: 5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1544]

[1545] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 5-브로모-2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}BrF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 395.0; m/z 실측치, 396.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.62 – 8.55 (s, 2H), 8.19 – 8.13 (s, 1H), 7.92 – 7.85 (m, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 2H), 5.69 – 5.61 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.19 – 1.78 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

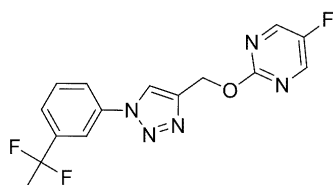
[1546] 실시예 294: 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1547]

[1548] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실험치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (s, 2H), 8.18 – 8.13 (m, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.79 (m, 1H), 7.65 – 7.55 (m, 2H), 5.73 – 5.60 (m, 2H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

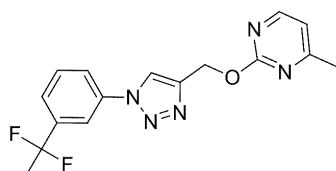
[1549] 실시예 295: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1550]

[1551] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실험치, 336.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (s, 2H), 8.20 – 8.13 (m, 1H), 7.91 – 7.86 (m, 1H), 7.87 – 7.76 (m, 1H), 7.66 – 7.57 (m, 2H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

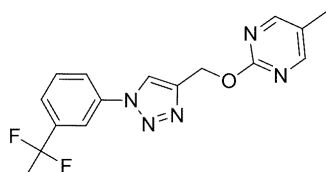
[1552] 실시예 296: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1553]

[1554] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실험치, 332.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.23 – 8.12 (m, 1H), 7.95 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.75 (m, 1H), 7.66 – 7.54 (m, 2H), 6.92 – 6.81 (m, 1H), 5.67 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.50 (s, 3H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

[1555] 실시예 297: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

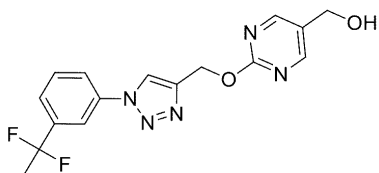


[1556]

[1557] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘

을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실험치, 332.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.48 – 8.30 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.95 – 7.84 (m, 1H), 7.85 – 7.75 (m, 1H), 7.68 – 7.52 (m, 2H), 5.64 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 2.26 (s, 3H), 1.97 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

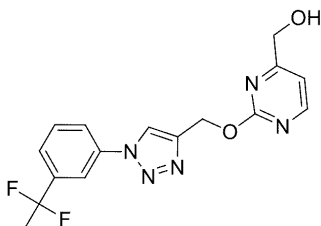
[1558] 실시예 298: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



[1559]

[1560] 단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 5-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 53)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실험치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.60 – 8.52 (s, 2H), 8.22 – 8.15 (s, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.65 – 7.53 (m, 2H), 5.71 – 5.57 (m, 2H), 4.77 – 4.64 (s, 2H), 2.71 – 2.48 (s, 1H), 2.02 – 1.92 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

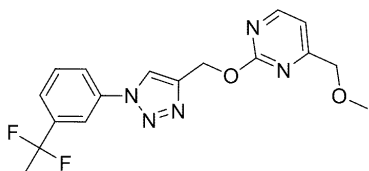
[1561] 실시예 299: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



[1562]

[1563] 단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 54)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실험치, 348.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.56 – 8.48 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.23 – 8.15 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.86 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.54 (m, 2H), 7.07 – 6.96 (m, 1H), 5.71 – 5.64 (m, 2H), 4.78 – 4.68 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.02 – 1.92 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

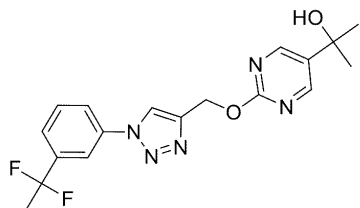
[1564] 실시예 300: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[1565]

[1566] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실험치, 362.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.20 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 2H), 7.16 (dt, J = 5.0, 0.8 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.60 – 4.40 (m, 2H), 3.50 (s, 3H), 1.97 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

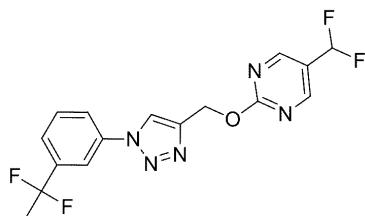
[1567] 실시예 301: 2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1568]

[1569] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 375.2; m/z 실측치, 376.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 2H), 8.21 – 8.15 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 2H), 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.12 – 1.88 (m, 3H), 1.63 (s, 6H).

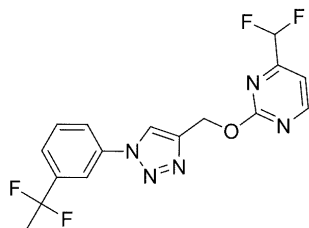
[1570] 실시예 302: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[1571]

[1572] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.77 – 8.66 (m, 2H), 8.25 – 8.11 (m, 1H), 7.96 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.77 (m, 1H), 7.66 – 7.55 (m, 2H), 6.73 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 5.73 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

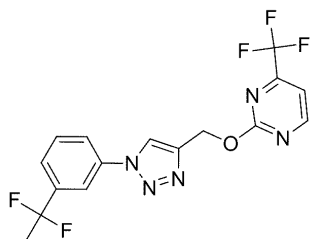
[1573] 실시예 303: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[1574]

[1575] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.25 – 8.16 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.77 (m, 1H), 7.67 – 7.56 (m, 2H), 7.34 – 7.28 (m, 1H), 6.65 – 6.37 (m, 1H), 5.71 (d, J = 1.3 Hz, 2H), 2.09 – 1.85 (m, 3H).

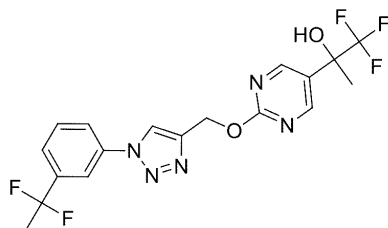
[1576] 실시예 304: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[1577]

[1578] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 385.1; m/z 실측치, 386.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.83 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.22 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.89 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 7.86 – 7.75 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (m, 2H), 7.34 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 5.73 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

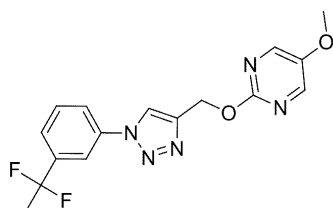
[1579] 실시예 305: (R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올.



[1580]

[1581] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)-1,1,1-트라이플루오로프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 429.1; m/z 실측치, 430.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.78 – 8.72 (s, 2H), 8.21 – 8.16 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (s, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.65 – 7.56 (m, 2H), 5.72 – 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.70 – 2.59 (s, 1H), 2.04 – 1.92 (t, J = 18.2 Hz, 3H), 1.86 – 1.81 (m, 3H).

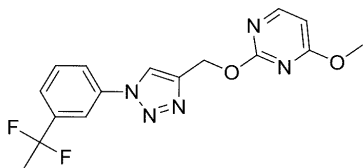
[1582] 실시예 306: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1583]

[1584] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.24 (s, 2H), 8.20 – 8.11 (m, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.67 – 7.53 (m, 2H), 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.88 (s, 3H), 1.97 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

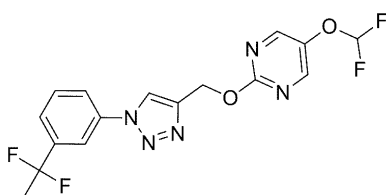
[1585] 실시예 307: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘.



[1586]

[1587] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 8.16 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.77 (m, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 2H), 6.43 (d, $J = 5.8$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.99 (s, 3H), 1.98 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

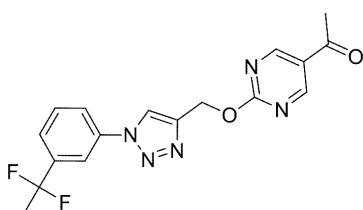
[1588] 실시예 308: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘.



[1589]

[1590] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.76 (m, 1H), 7.68 – 7.55 (m, 2H), 6.53 (t, $J = 71.9$ Hz, 1H), 5.67 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 1.98 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

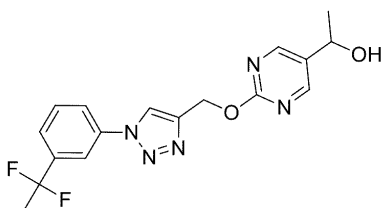
[1591] 실시예 309: 1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[1592]

[1593] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.16 – 9.05 (s, 2H), 8.24 – 8.16 (s, 1H), 7.93 – 7.88 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.66 – 7.57 (m, 2H), 5.83 – 5.73 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 2.67 – 2.55 (s, 3H), 2.06 – 1.90 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

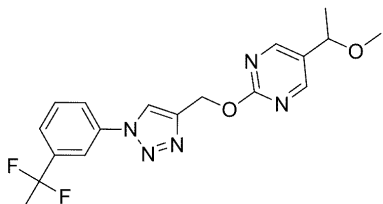
[1594] 실시예 310: (R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[1595]

[1596] 1-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 (실시예 309)을 사용하여, 실시예 157과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.64 – 8.52 (s, 2H), 8.26 – 8.10 (s, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.66 – 7.54 (m, 2H), 5.72 – 5.57 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 5.03 – 4.88 (m, 1H), 2.23 – 2.10 (s, 1H), 2.07 – 1.88 (t, J = 18.3 Hz, 3H), 1.61 – 1.52 (d, J = 6.5 Hz, 3H).

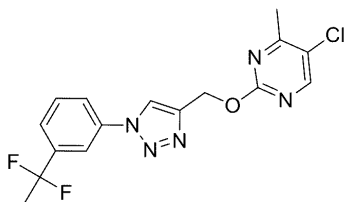
[1597] 실시예 311: (R/S)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시에틸)피리미딘.



[1598]

[1599] ACN 중의 1-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-올 (실시예 310, 21 mg, 0.06 mmol)의 용액에, NaH (7 mg, 0.17 mmol), 이어서 요오도메탄 (82 mg, 0.58 mmol)을 첨가하였다. 생성된 현탁액을 2시간 동안 실온에서 교반하였다. 완료된 반응물을 EtOAc로 희석하고, 물, 염수로 세정하여, 건조시키고 (Na_2SO_4), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM 중의 0 내지 3% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (9.6 mg, 44%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 375.2; m/z 실측치, 376.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 – 8.48 (s, 2H), 8.24 – 8.15 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.67 – 7.53 (m, 2H), 5.72 – 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.40 – 4.29 (m, 1H), 3.35 – 3.21 (s, 3H), 2.08 – 1.88 (t, J = 18.2 Hz, 3H), 1.54 – 1.43 (d, J = 6.5 Hz, 3H).

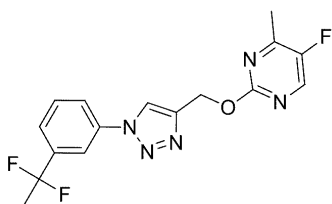
[1600] 실시예 312: 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸피리미딘.



[1601]

[1602] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 1H), 8.17 – 8.14 (m, 1H), 7.90 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.79 (m, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 2H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.57 (s, 3H), 1.98 (t, J = 18.2 Hz, 3H).

[1603] 실시예 313: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸피리미딘.

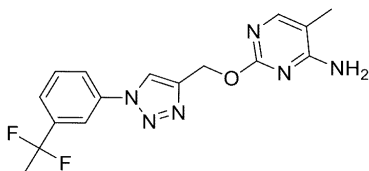


[1604]

[1605] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O$ 에

대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.86 – 7.77 (m, 1H), 7.68 – 7.53 (m, 2H), 5.62 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.50 (d, $J = 2.5$ Hz, 3H), 1.98 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

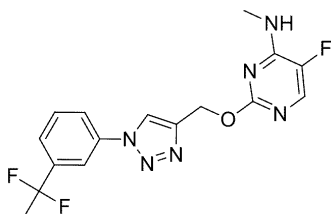
[1606] 실시예 314: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



[1607]

[1608] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 346.1; m/z 실측치, 347.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 – 8.13 (s, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 2H), 7.85 – 7.75 (m, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 2H), 5.62 – 5.51 (s, 2H), 5.08 – 4.91 (s, 2H), 2.05 – 2.02 (s, 3H), 2.02 – 1.93 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

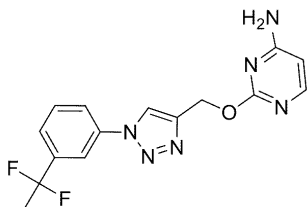
[1609] 실시예 315: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[1610]

[1611] 단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.85 – 7.77 (m, 2H), 7.64 – 7.56 (m, 2H), 5.61 – 5.55 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 5.15 – 5.10 (s, 1H), 3.11 – 3.05 (d, $J = 5.0$ Hz, 3H), 2.00 – 1.90 (m, 3H).

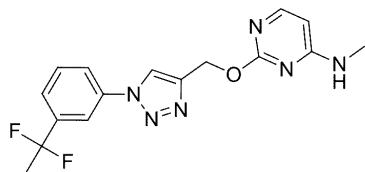
[1612] 실시예 316: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1613]

[1614] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실측치, 333.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.22 – 8.11 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.09 – 7.99 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 7.94 – 7.84 (m, 1H), 7.84 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.52 (m, 2H), 6.22 – 6.07 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 5.65 – 5.50 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 5.29 – 5.12 (s, 2H), 2.04 – 1.88 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

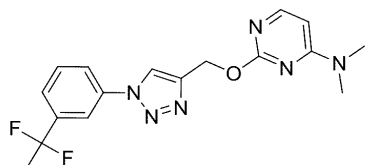
[1615] 실시예 317: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[1616]

[1617] tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 346.1; m/z 실측치, 347.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.18 – 8.13 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.07 – 7.98 (s, 1H), 7.92 – 7.86 (dt, $J = 3.0$, 1.1 Hz, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 2H), 6.07 – 6.02 (d, $J = 5.9$ Hz, 1H), 5.64 – 5.58 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 5.09 – 4.83 (s, 1H), 3.08 – 2.85 (m, 3H), 2.12 – 1.82 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

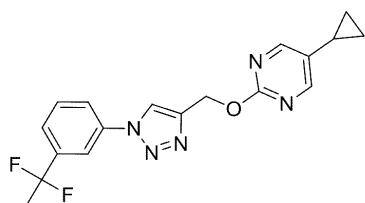
[1618] 실시예 318: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



[1619]

[1620] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{18}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 360.2; m/z 실측치, 361.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 – 8.12 (t, $J = 0.8$ Hz, 1H), 8.06 – 8.00 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 7.94 – 7.87 (t, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 2H), 6.16 – 6.09 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 5.64 – 5.59 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.25 – 2.97 (s, 6H), 2.08 – 1.90 (m, 3H).

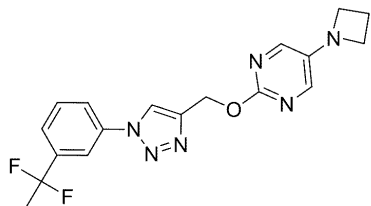
[1621] 실시예 319: 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1622]

[1623] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 8.17 – 8.15 (m, 1H), 7.90 – 7.87 (m, 1H), 7.81 (d, $J = 6.4$ Hz, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 2H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 1.97 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H), 1.89 – 1.77 (m, 1H), 1.07 – 0.98 (m, 2H), 0.75 – 0.64 (m, 2H).

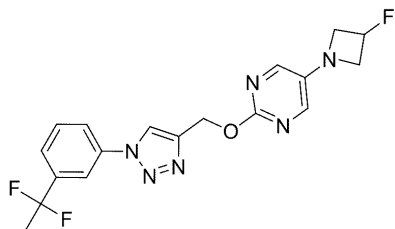
[1624] 실시예 320: 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1625]

[1626] 단계 A에서, 5-브로모-2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 293) 및 아제티딘을 사용하여, 실시예 165, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 372.2; m/z 실측치, 373.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 – 8.13 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.79 (s, 3H), 7.64 – 7.54 (m, 2H), 5.62 – 5.55 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.97 – 3.86 (t, $J = 7.2$ Hz, 4H), 2.50 – 2.39 (m, 2H), 2.04 – 1.88 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

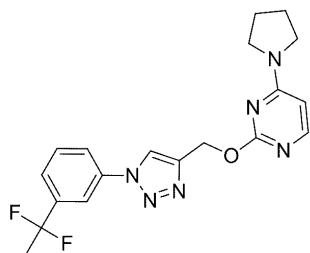
[1627] 실시예 321: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



[1628]

[1629] 단계 A에서, 5-브로모-2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 293) 및 3-플루오로아제티딘을 사용하여, 실시예 165, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 390.1; m/z 실측치, 391.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.91 – 7.86 (m, 3H), 7.85 – 7.77 (m, 1H), 7.64 – 7.55 (m, 2H), 5.62 – 5.56 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 5.56 – 5.34 (m, 1H), 4.29 – 4.18 (m, 2H), 4.06 – 3.94 (m, 2H), 2.04 – 1.91 (t, $J = 18.2$ Hz, 3H).

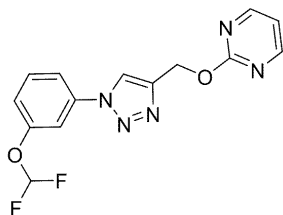
[1630] 실시예 322: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



[1631]

[1632] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 64) 및 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{20}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 386.2; m/z 실측치, 387.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.14 (s, 1H), 8.02 – 7.98 (d, $J = 5.9$ Hz, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 2H), 6.06 – 5.95 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 5.68 – 5.55 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.76 – 3.54 (m, 2H), 3.47 – 3.27 (m, 2H), 2.10 – 1.88 (m, 7H).

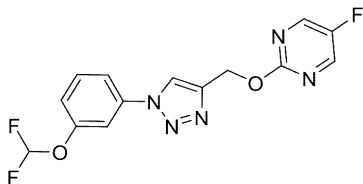
[1633] 실시예 323: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1634]

[1635] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $DMSO-d_6$) δ 8.99 (s, 1H), 8.66 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.86 - 7.76 (m, 2H), 7.66 (t, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.48 (d, $J = 73.5$ Hz, 1H), 7.31 (dd, $J = 7.9, 2.4$ Hz, 1H), 7.24 - 7.14 (m, 1H), 5.54 (s, 2H).

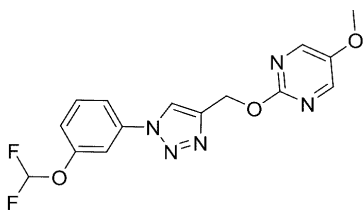
[1636] 실시예 324: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1637]

[1638] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $DMSO-d_6$) δ 8.98 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 7.82 (ddd, $J = 8.1, 2.1, 0.9$ Hz, 1H), 7.79 (t, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.66 (t, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.60 - 7.17 (m, 2H), 5.52 (s, 2H).

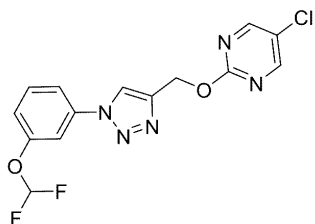
[1639] 실시예 325: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1640]

[1641] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $DMSO-d_6$) δ 8.96 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.83 (dd, $J = 8.1, 2.2$ Hz, 1H), 7.79 (t, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.66 (t, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.59 - 7.16 (m, 2H), 5.47 (s, 2H), 3.86 (s, 3H).

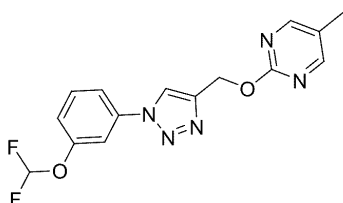
[1642] 실시예 326: 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1643]

[1644] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실험치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 7.82 (ddd, J = 8.1, 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.79 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 - 7.23 (m, 2H), 5.79 - 5.32 (m, 2H).

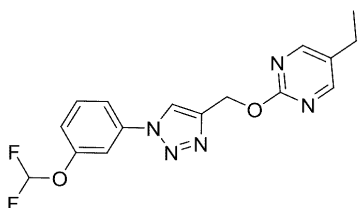
[1645] 실시예 327: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1646]

[1647] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실험치, 334.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.97 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 7.83 (ddd, J = 8.1, 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.79 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.56 - 7.22 (m, 2H), 5.62 - 5.21 (m, 2H), 2.21 (d, J = 0.8 Hz, 3H).

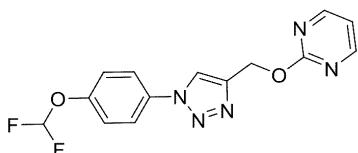
[1648] 실시예 328: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[1649]

[1650] (1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 42) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실험치, 348.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.53 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 7.83 (ddd, J = 8.1, 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.79 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.66 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.55 - 7.19 (m, 2H), 5.67 - 5.35 (m, 2H), 2.62 - 2.54 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

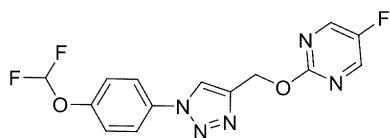
[1651] 실시예 329: 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1652]

[1653] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.92 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.66 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.05 - 7.91 (m, 2H), 7.52 - 7.16 (m, 4H), 5.53 (d, J = 0.5 Hz, 2H).

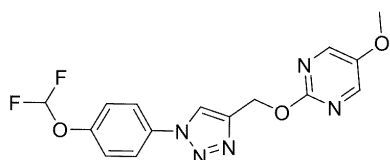
[1654] 실시예 330: 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1655]

[1656] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.75 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 8.01 - 7.92 (m, 2H), 7.52 - 7.17 (m, 3H), 5.52 (s, 2H).

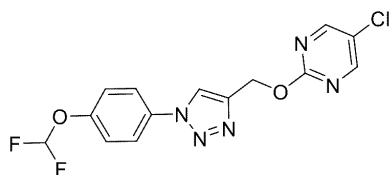
[1657] 실시예 331: 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1658]

[1659] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.89 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 8.02 - 7.94 (m, 2H), 7.53 - 7.16 (m, 3H), 5.46 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 3.86 (s, 3H).

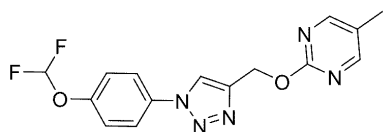
[1660] 실시예 332: 5-클로로-2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1661]

[1662] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.01 - 7.93 (m, 2H), 7.53 - 7.16 (m, 3H), 5.59 - 5.49 (m, 2H).

[1663] 실시예 333: 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

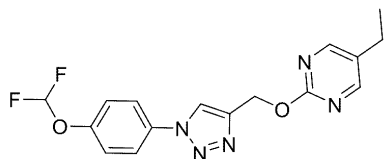


[1664]

[1665] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.90 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 8.04 - 7.90 (m, 2H), 7.55 - 7.16 (m, 3H), 5.49 (s, 2H), 2.21 (d, J =

0.8 Hz, 3H).

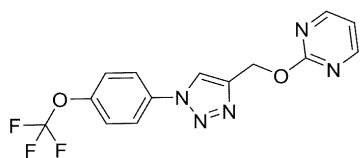
[1666] 실시예 334: 2-[[1-[4-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[1667]

[1668] (1-(4-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 43) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.90 (s, 1H), 8.53 (t, J = 0.6 Hz, 2H), 8.01 - 7.88 (m, 2H), 7.54 - 7.16 (m, 3H), 5.50 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 2.57 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

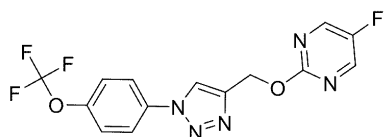
[1669] 실시예 335: 2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1670]

[1671] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{14}\text{H}_{10}\text{F}_3\text{N}_5\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.97 (s, 1H), 8.66 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.12 - 7.99 (m, 2H), 7.69 - 7.58 (m, 2H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.61 - 5.39 (m, 2H).

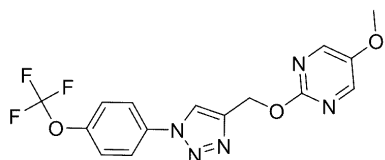
[1672] 실시예 336: 5-플루오로-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1673]

[1674] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{14}\text{H}_9\text{F}_4\text{N}_5\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.74 (s, 1H), 8.57 (s, 2H), 8.03 - 7.94 (m, 2H), 7.57 - 7.44 (m, 2H), 5.44 (s, 2H).

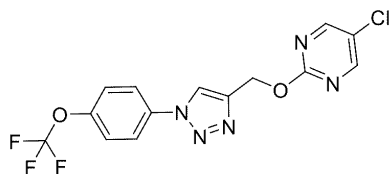
[1675] 실시예 337: 5-메톡시-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1676]

[1677] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $\text{C}_{15}\text{H}_{12}\text{F}_3\text{N}_5\text{O}_3$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.94 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 8.11 - 8.00 (m, 2H), 7.68 - 7.54 (m, 2H), 5.51 - 5.43 (m, 2H), 3.86 (s, 3H).

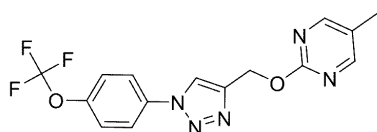
[1678] 실시예 338: 5-클로로-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1679]

[1680] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.10 - 8.01 (m, 2H), 7.67 - 7.55 (m, 2H), 5.55 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

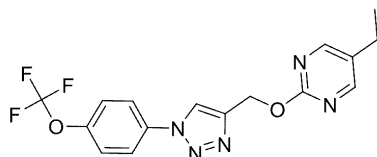
[1681] 실시예 339: 5-메틸-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1682]

[1683] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.95 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 8.12 - 8.02 (m, 2H), 7.70 - 7.56 (m, 2H), 5.50 (s, 2H), 2.21 (t, J = 0.8 Hz, 3H).

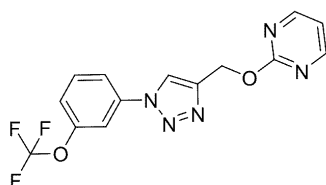
[1684] 실시예 340: 5-에틸-2-[[1-[4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1685]

[1686] (1-(4-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 34) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (s, 1H), 8.53 (s, 2H), 8.16 - 7.97 (m, 2H), 7.70 - 7.51 (m, 2H), 5.58 - 5.41 (m, 2H), 2.57 (q, 2H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

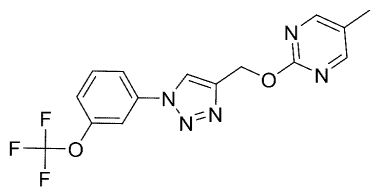
[1687] 실시예 341: 2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1688]

[1689] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.03 (s, 1H), 8.67 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.05 - 7.92 (m, 2H), 7.75 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.52 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.54 (s, 2H).

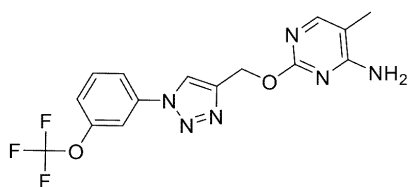
[1690] 실시예 342: 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1691]

[1692] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.02 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 8.04 - 7.96 (m, 2H), 7.78 - 7.68 (m, 1H), 7.52 (ddt, $J = 8.3, 2.3, 1.2$ Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.21 (d, $J = 0.8$ Hz, 3H).

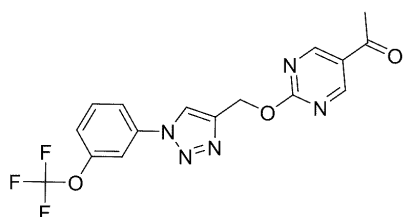
[1693] 실시예 343: 5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1694]

[1695] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 367.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.99 (s, 1H), 8.04 - 7.95 (m, 2H), 7.79 - 7.70 (m, 2H), 7.54 - 7.49 (m, 1H), 6.76 (s, 2H), 5.35 (s, 2H), 1.92 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H).

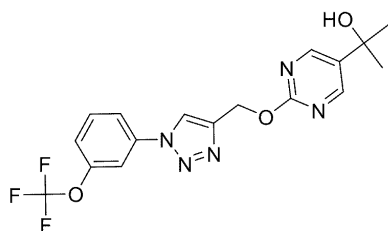
[1696] 실시예 344: 1-[2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄온.



[1697]

[1698] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-온을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.16 (s, 2H), 9.06 (s, 1H), 8.04 - 7.99 (m, 2H), 7.80 - 7.71 (m, 1H), 7.57 - 7.47 (m, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.60 (s, 3H).

[1699] 실시예 345: 2-[2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.

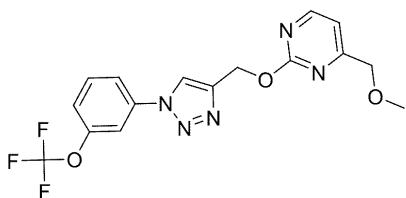


[1700]

[1701] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-(2-클로로피리미딘-

5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.76 (s, 1H), 8.72 (s, 2H), 7.94 - 7.85 (m, 2H), 7.69 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.43 (ddt, J = 8.3, 2.3, 1.1 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 1.57 (s, 6H).

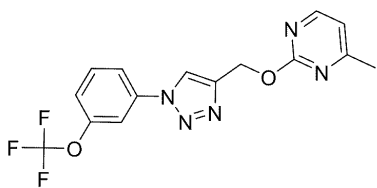
[1702] 실시예 346: 4-(메톡시메틸)-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1703]

[1704] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.84 - 8.72 (m, 1H), 8.59 (s, 1H), 7.90 (d, J = 9.3 Hz, 2H), 7.71 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.23 (s, 1H), 5.63 (d, J = 5.4 Hz, 2H), 4.68 - 4.42 (m, 2H), 3.62 - 3.44 (m, 3H).

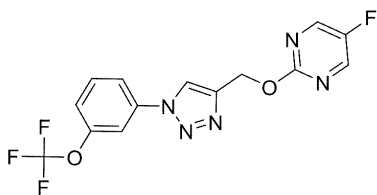
[1705] 실시예 347: 4-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1706]

[1707] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.02 (s, 1H), 8.49 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.07 - 7.98 (m, 2H), 7.75 (t, J = 8.2 Hz, 1H), 7.58 - 7.51 (m, 1H), 7.08 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.43 (s, 3H).

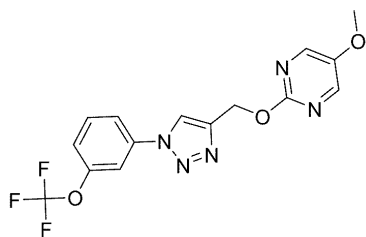
[1708] 실시예 348: 5-플루오로-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1709]

[1710] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 256.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.03 (s, 1H), 8.75 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 8.05 - 7.96 (m, 2H), 7.80 - 7.71 (m, 1H), 7.53 (ddq, J = 8.3, 2.2, 1.1 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

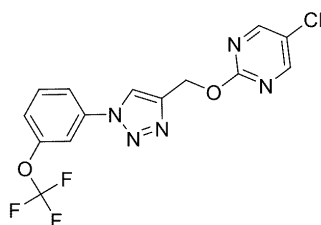
[1711] 실시예 349: 5-메톡시-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1712]

[1713] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실험치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.01 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 8.05 - 7.96 (m, 2H), 7.75 (t, $J = 8.2$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J = 8.2$ Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 3.86 (s, 3H).

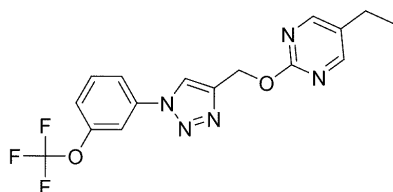
[1714] 실시예 350: 5-클로로-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1715]

[1716] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.0; m/z 실험치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.02 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.05 - 7.95 (m, 2H), 7.81 - 7.70 (m, 1H), 7.53 (ddt, $J = 8.3, 2.2, 1.1$ Hz, 1H), 5.55 (s, 2H).

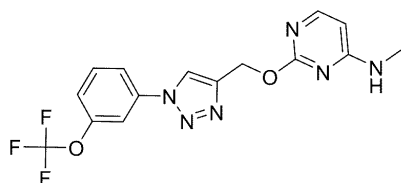
[1717] 실시예 351: 5-에틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1718]

[1719] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실험치, 366.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.03 (s, 1H), 8.53 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 8.08 - 7.91 (m, 2H), 7.80 - 7.69 (m, 1H), 7.52 (ddt, $J = 8.3, 2.2, 1.1$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.58 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

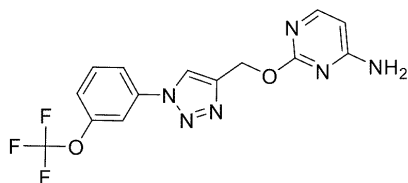
[1720] 실시예 352: N-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1721]

[1722] tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 367.4 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.69 (s, 1H), 7.97 - 7.84 (m, 2H), 7.80 (s, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 6.3 Hz, 1H), 7.51 - 7.37 (m, 2H), 6.20 - 6.05 (m, 1H), 5.53 (s, 2H), 2.92 (s, 3H).

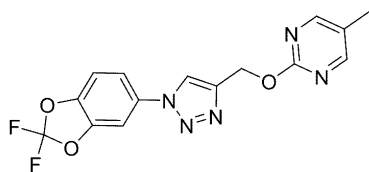
[1723] 실시예 353: 2-[[1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1724]

[1725] (1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 35) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.3 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.72 (s, 1H), 7.95 - 7.82 (m, 3H), 7.69 (dd, J = 9.7, 6.9 Hz, 1H), 7.48 - 7.34 (m, 1H), 6.17 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.48 (d, J = 3.7 Hz, 2H).

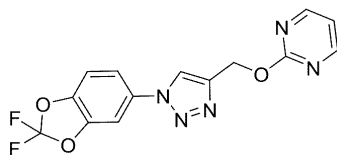
[1726] 실시예 354: 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1727]

[1728] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.88 (s, 1H), 8.49 (d, J = 0.9 Hz, 2H), 8.08 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 8.8, 2.2 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.21 (d, J = 0.7 Hz, 3H).

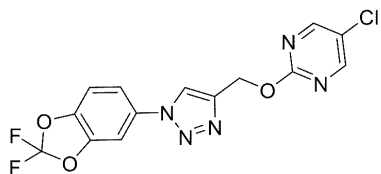
[1729] 실시예 355: 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1730]

[1731] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.91 (s, 1H), 8.67 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 8.09 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.80 (dd, J = 8.7, 2.2 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 5.54 (s, 2H).

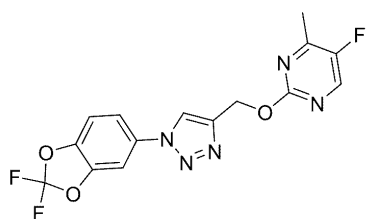
[1732] 실시예 356: 5-클로로-2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1733]

[1734] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 367.0; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.89 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.08 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.8, 2.2$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 5.54 (s, 2H).

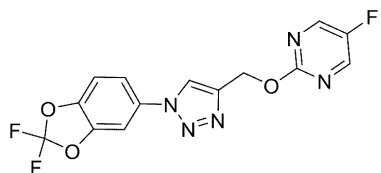
[1735] 실시예 357: 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[1736]

[1737] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.88 (s, 1H), 8.56 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 8.08 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.7, 2.2$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.44 (d, $J = 2.6$ Hz, 3H).

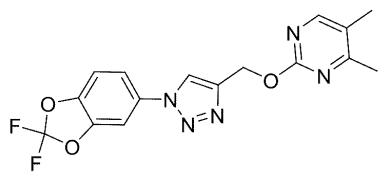
[1738] 실시예 358: 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1739]

[1740] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.89 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 8.08 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.8, 2.2$ Hz, 1H), 7.65 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H).

[1741] 실시예 359: 2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.

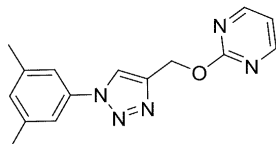


[1742]

[1743] (1-(2,2-다이플루오로벤조[d][1,3]다이옥솔-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 45) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI):

C₁₆H₁₃F₂N₅O₃에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.87 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.08 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 8.8, 2.2 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 5.47 (s, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

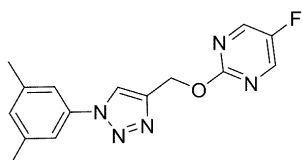
[1744] 실시예 360: 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1745]

[1746] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₅N₅O에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, 282.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.85 (s, 1H), 8.66 (d, J = 4.8 Hz, 2H), 7.59 - 7.44 (m, 2H), 7.20 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 7.13 (td, J = 1.5, 0.8 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.37 (d, J = 0.8 Hz, 6H).

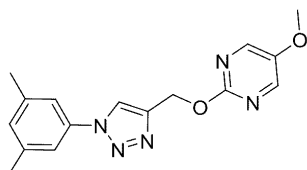
[1747] 실시예 361: 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[1748]

[1749] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₄FN₅O에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.84 (s, 1H), 8.75 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 7.54 (dt, J = 1.4, 0.7 Hz, 2H), 7.14 (dq, J = 1.8, 0.8 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.37 (d, J = 0.7 Hz, 6H).

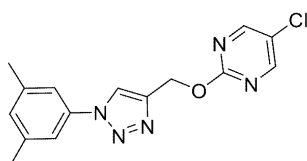
[1750] 실시예 362: 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1751]

[1752] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₇N₅O₂에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.2 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.82 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.54 (dt, J = 1.5, 0.7 Hz, 2H), 7.13 (tt, J = 1.7, 0.8 Hz, 1H), 5.45 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.37 (d, J = 0.7 Hz, 6H).

[1753] 실시예 363: 5-클로로-2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

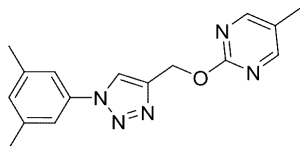


[1754]

[1755] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여,

실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.85 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 7.54 (dd, $J = 1.4$, 0.8 Hz, 2H), 7.14 (tt, $J = 1.6$, 0.8 Hz, 1H), 5.53 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 2.37 (q, $J = 0.7$ Hz, 6H).

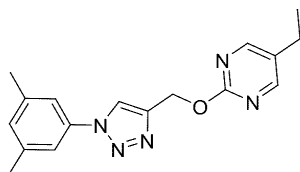
[1756] 실시예 364: 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1757]

[1758] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 295.1; m/z 실측치, 296.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.83 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.54 (dd, $J = 1.5$, 0.8 Hz, 2H), 7.18 - 7.06 (m, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.37 (d, $J = 0.7$ Hz, 6H), 2.21 (t, $J = 0.7$ Hz, 3H).

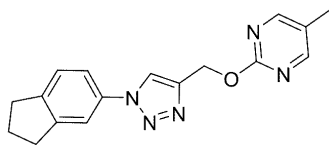
[1759] 실시예 365: 2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[1760]

[1761] (1-(3,5-다이메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 36) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{19}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 309.2; m/z 실측치, 310.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.84 (s, 1H), 8.53 (s, 2H), 7.54 (dt, $J = 1.5$, 0.7 Hz, 2H), 7.13 (tt, $J = 1.6$, 0.8 Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.57 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

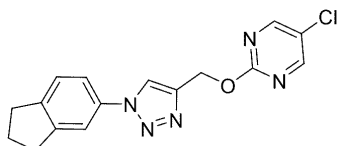
[1762] 실시예 366: 2-[(1-인단-5-일트리아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1763]

[1764] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 307.1; m/z 실측치, 308.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.82 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 7.74 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.63 (dd, $J = 8.1$, 2.2 Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 5.47 (s, 2H), 2.94 (dt, $J = 12.9$, 7.4 Hz, 4H), 2.21 (s, 3H), 2.14 - 2.00 (m, 2H).

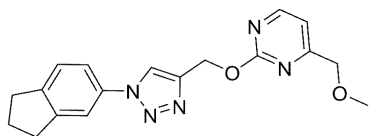
[1765] 실시예 367: 5-클로로-2-[(1-인단-5-일트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘.



[1766]

[1767] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.83 (s, 1H), 8.76 (s, 2H), 7.74 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.63 (dd, $J = 8.1, 2.2$ Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.94 (dt, $J = 12.6, 7.4$ Hz, 4H), 2.08 (p, $J = 7.5$ Hz, 2H).

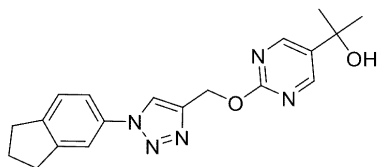
[1768] 실시예 368: 2-[(1-인단-5-일트리아졸-4-일)메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[1769]

[1770] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.82 (s, 1H), 8.64 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 7.74 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.63 (dd, $J = 8.1, 2.2$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.20 - 7.16 (m, 1H), 5.50 (s, 2H), 4.47 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.94 (dt, $J = 14.1, 7.3$ Hz, 4H), 2.14 - 2.03 (m, 2H).

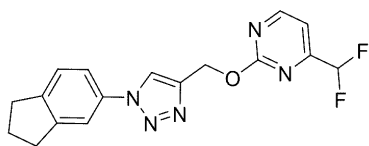
[1771] 실시예 369: 2-[2-[(1-인단-5-일트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1772]

[1773] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{21}N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.2; m/z 실측치, 352.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.83 (s, 1H), 8.69 (s, 2H), 7.75 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.64 (dd, $J = 8.1, 2.3$ Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 5.30 (s, 1H), 2.94 (dt, $J = 13.9, 7.5$ Hz, 4H), 2.14 - 2.04 (m, 2H), 1.46 (s, 6H).

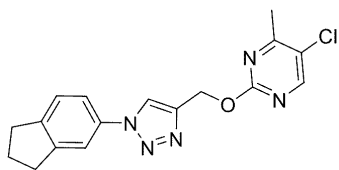
[1774] 실시예 370: 4-(다이플루오로메틸)-2-[(1-인단-5-일트리아졸-4-일)메톡시]피리미딘.



[1775]

[1776] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.90 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 7.74 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.63 (dt, $J = 8.1, 1.3$ Hz, 1H), 7.46 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 7.42 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 6.96 (t, $J = 54.1$ Hz, 1H), 5.57 (s, 2H), 2.94 (dt, $J = 15.3, 7.4$ Hz, 4H), 2.08 (p, $J = 7.5$ Hz, 2H).

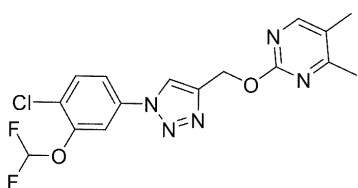
[1777] 실시예 371: 5-클로로-2-[(1-인덴-5-일트리아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1778]

[1779] (1-(2,3-다이하이드로-1H-인덴-5-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 51) 및 2,5-다이클로로-4-메틸 피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.82 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.74 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 7.63 (dd, $J = 8.1, 2.1$ Hz, 1H), 7.41 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.94 (dt, $J = 15.4, 7.4$ Hz, 4H), 2.51 (s, 5H), 2.08 (p, $J = 7.5$ Hz, 2H).

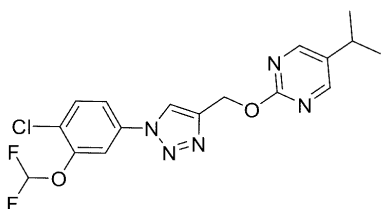
[1780] 실시예 372: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[1781]

[1782] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 (s, 1H), 8.30 (d, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.99 (dd, $J = 2.2, 0.7$ Hz, 1H), 7.91 - 7.82 (m, 2H), 7.45 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.54 - 5.37 (m, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.16 (s, 3H).

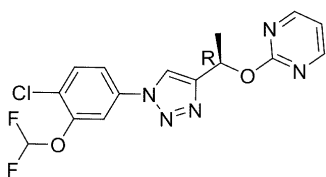
[1783] 실시예 373: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.



[1784]

[1785] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9.01 (s, 1H), 8.56 (s, 2H), 7.99 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.95 - 7.81 (m, 2H), 7.45 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.93 (p, $J = 7.0$ Hz, 1H), 1.24 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

[1786] 실시예 374: 2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.

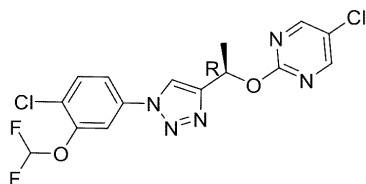


[1787]

[1788] (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 22) 및 2-클로

로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실험치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.66 (d, $J = 3.4$ Hz, 1H), 8.58 (d, $J = 4.7$ Hz, 2H), 7.86 (d, $J = 4.1$ Hz, 1H), 7.81 - 7.61 (m, 2H), 7.29 - 6.75 (m, 1H), 6.48 (dt, $J = 9.5, 4.6$ Hz, 1H), 1.82 (dd, $J = 6.7, 3.4$ Hz, 3H).

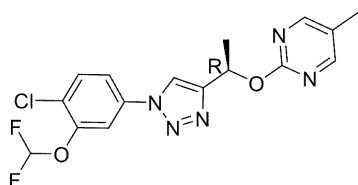
[1789] 실시예 375: 5-클로로-2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[1790]

[1791] (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 22) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}Cl_2F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 401.0; m/z 실험치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.67 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.58 (d, $J = 1.2$ Hz, 2H), 7.86 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.82 - 7.66 (m, 2H), 7.02 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.41 (dt, $J = 7.1, 6.3$ Hz, 1H), 1.83 (d, $J = 6.7$ Hz, 3H).

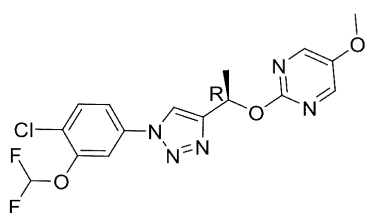
[1792] 실시예 376: 2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1793]

[1794] (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 22) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실험치, 382.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.96 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.46 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.97 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.91 - 7.80 (m, 2H), 7.43 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.34 (q, $J = 6.6$ Hz, 1H), 2.19 (d, $J = 0.8$ Hz, 3H), 1.73 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

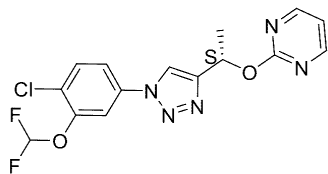
[1795] 실시예 377: 2-[(1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[1796]

[1797] (R)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 22) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실험치, 398.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.64 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.30 (s, 2H), 7.86 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.80 - 7.65 (m, 2H), 7.02 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.36 (dt, $J = 6.8, 6.3$ Hz, 1H), 3.88 (s, 3H), 1.80 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

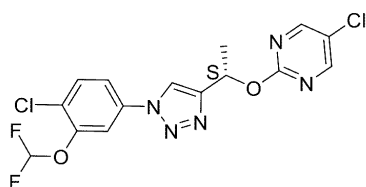
[1799] 실시예 378: 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[1799]

[1800] (S)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 23) (중간체 23) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.99 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.63 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.98 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.92 - 7.80 (m, 2H), 7.43 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 7.16 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 6.39 (q, $J = 6.5$ Hz, 1H), 1.75 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

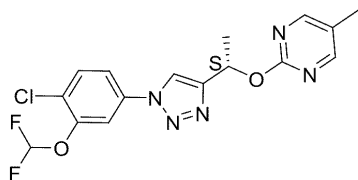
[1801] 실시예 379: 5-클로로-2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]피리미딘.



[1802]

[1803] (S)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 23) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}Cl_2F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 401.0; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.67 (s, 1H), 8.59 (s, 2H), 7.87 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 7.80 - 7.65 (m, 2H), 7.02 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.41 (q, $J = 6.5$ Hz, 1H), 1.90 - 1.72 (m, 3H).

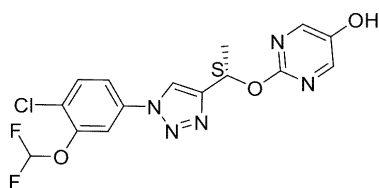
[1804] 실시예 380: 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘.



[1805]

[1806] (S)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 23) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (s, 1H), 8.46 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.97 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 7.93 - 7.78 (m, 2H), 7.43 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.34 (q, $J = 6.6$ Hz, 1H), 2.19 (d, $J = 0.7$ Hz, 3H), 1.73 (d, $J = 6.6$ Hz, 3H).

[1807] 실시예 381: 2-[(1S)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘.

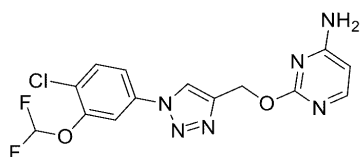


[1808]

[1809] (S)-1-(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)에탄-1-올 (중간체 23) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI):

C₁₆H₁₄ClF₂N₅O₃에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실측치, 398.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CD₃OD) δ 8.64 (s, 1H), 8.30 (s, 2H), 7.80 (d, J = 48.2 Hz, 3H), 7.02 (t, J = 72.2 Hz, 1H), 6.36 (s, 1H), 3.88 (s, 3H), 1.81 (s, 3H).

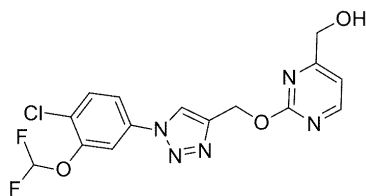
[1810] 실시예 382: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[1811]

[1812] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₄H₁₁ClF₂N₆O₂에 대한 질량 계산치, 368.1; m/z 실측치, 369.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.97 – 8.95 (m, 1H), 7.99 – 7.97 (m, 1H), 7.90 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.88 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.90 (s, 2H), 6.11 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 5.38 (s, 2H).

[1813] 실시예 383: [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.

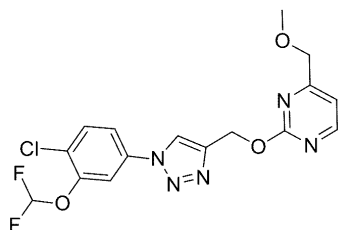


[1814]

[1815] 단계 A. 2-클로로-4-(((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메톡시)메틸)피리미딘. (2-클로로피리미딘-4-일)메탄올 및 (2-(클로로메톡시)에틸)트라이메틸실란을 사용하여, 중간체 59와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.77 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.60 – 7.55 (m, 1H), 4.77 (s, 2H), 4.65 – 4.62 (m, 2H), 3.64 – 3.56 (m, 2H), 0.87 – 0.80 (m, 2H), 0.00 – -0.03 (s, 9H).

[1816] 단계 B. [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올. 단계 B에서 DMF 대신에 THF를 사용하고, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-4-(((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메톡시)메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₂ClF₂N₅O₃에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 9.00 (s, 1H), 8.62 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 7.25 – 7.23 (m, 1H), 5.63 (t, J = 5.7 Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 4.51 (d, J = 5.3 Hz, 2H).

[1817] 실시예 384: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.

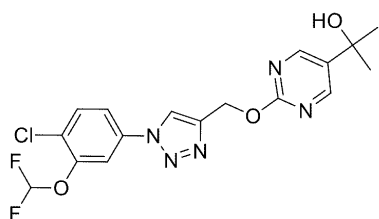


[1818]

[1819] 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘 및 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₄ClF₂N₅O₃에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실측치, 398.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 9.00 –

8.99 (m, 1H), 8.64 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 7.99 – 7.97 (m, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 7.18 (dt, $J = 5.0, 0.7$ Hz, 1H), 5.54 (s, 2H), 4.49 – 4.46 (m, 2H), 3.40 (s, 3H).

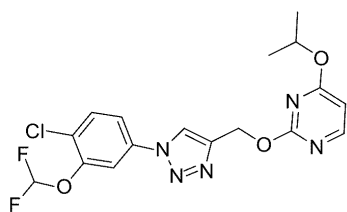
[1820] 실시예 385: 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1821]

[1822] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.79 – 8.61 (s, 2H), 8.16 – 8.10 (s, 1H), 7.74 – 7.68 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 7.66 – 7.54 (m, 2H), 6.80 – 6.46 (t, $J = 72.5$ Hz, 2H), 5.71 – 5.61 (s, 2H), 1.65 – 1.59 (s, 6H).

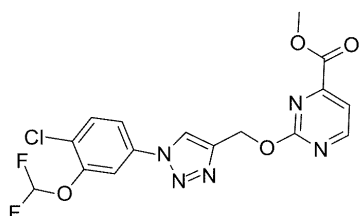
[1823] 실시예 386: 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-아이소프로폭시피리미딘.



[1824]

[1825] 2-클로로-4-아이소프로폭시피리미딘 및 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.00 (s, 1H), 8.31 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 8.01 – 7.97 (m, 1H), 7.90 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.53 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 5.33 – 5.25 (m, 1H), 1.29 (d, $J = 6.2$ Hz, 6H).

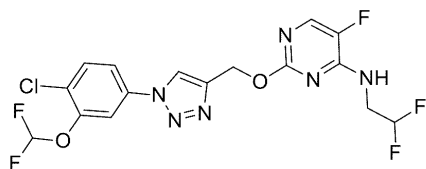
[1826] 실시예 387: 메틸 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-카르복실레이트.



[1827]

[1828] 메틸 2-클로로피리미딘-4-카르복실레이트 및 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}ClF_2N_5O_4$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.1 $[M+H]^+$.

[1829] 실시예 388: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-(2,2-다이플루오로에틸)-5-플루오로-피리미딘-4-아민.



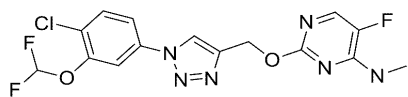
[1830]

[1831]

tert-부틸 (2-클로로-5-플루오로피리미딘-4-일)(2,2-다이플루오로에틸)카르바메이트 (중간체 57) 및 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}ClF_5N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 450.1; m/z 실측치, 451.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.97 (s, 1H), 8.19 – 8.12 (m, 1H), 8.07 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.90 – 7.82 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.33 – 5.99 (m, 1H), 5.42 (s, 2H).

[1832]

실시예 389: 트라이플루오로아세트산 염으로서의
2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.



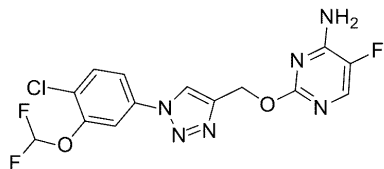
[1833]

[1834]

단계 A에서, (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 400.1; m/z 실측치, 401.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 (s, 1H), 8.01 – 7.84 (m, 5H), 7.46 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 2.87 (d, J = 4.6 Hz, 3H).

[1835]

실시예 390: 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[1836]

[1837]

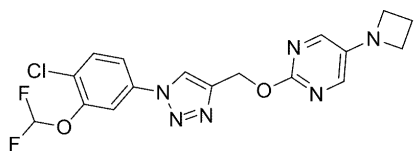
단계 A. 4-클로로-2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘. 단계 B에서, 4-클로로-5-플루오로-2-(메틸설포닐)피리미딘 및 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 167과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8Cl_2F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 405.0; m/z 실측치, 406.0 $[M+H]^+$.

[1838]

단계 B. 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민. 실시예 167, 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 386.1; m/z 실측치, 387.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.96 (s, 1H), 8.00 – 7.96 (m, 2H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 7.34 (s, 2H), 5.36 (s, 2H).

[1839]

실시예 391: 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



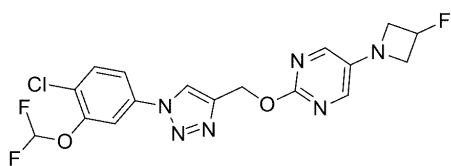
[1840]

[1841]

단계 C에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 165, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}ClF_2N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 408.1; m/z 실측치, 409.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 – 8.96 (m, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.92 (s, 2H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.45 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.45 – 5.41 (m, 2H), 3.84 (t, J = 7.2 Hz, 4H), 2.39 – 2.29 (m, 2H).

[1842]

실시예 392: 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



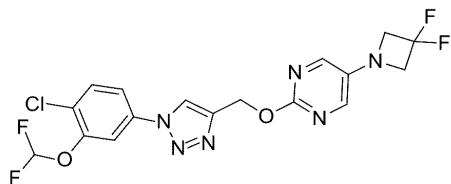
[1843]

[1844]

단계 A에서 3-플루오로아제티딘 및 단계 C에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 165, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}ClF_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 426.1; m/z 실측치, 427.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.97 (s, 1H), 8.03 – 7.96 (m, 3H), 7.90 – 7.82 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.60 – 5.38 (m, 3H), 4.25 – 4.14 (m, 2H), 4.00 – 3.88 (m, 2H).

[1845]

실시예 393: 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



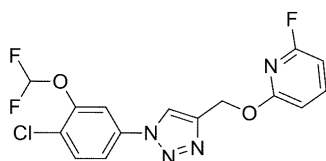
[1846]

[1847]

단계 A에서 3,3-다이플루오로아제티딘 및 단계 C에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1)을 사용하여, 실시예 165, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}ClF_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 444.1; m/z 실측치, 445.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.98 (s, 1H), 8.09 (s, 2H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.90 – 7.83 (m, 2H), 7.44 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.46 (s, 2H), 4.34 (t, J = 12.3 Hz, 4H).

[1848]

실시예 394: 2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-플루오로-피리딘.



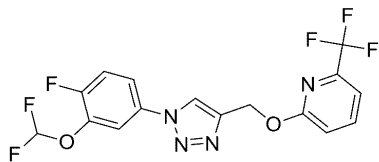
[1849]

[1850]

(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 1) 및 2,6-다이플루오로피리딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_3N_4O_2$ 에 대한

질량 계산치, 370.0; m/z 실측치, 371.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CD₃CN) δ 8.42 (s, 1H), 7.84 (q, J = 8.1 Hz, 1H), 7.80 – 7.76 (m, 1H), 7.76 – 7.67 (m, 2H), 6.93 (t, J = 73.0 Hz, 1H), 6.70 (ddd, J = 53.8, 7.9, 2.0 Hz, 2H), 5.50 (s, 2H).

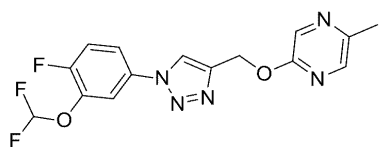
[1851] 실시예 395: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-(트라이플루오로메틸)피리딘.



[1852]

[1853] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-플루오로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₀F₆N₄O₂에 대한 질량 계산치, 404.1; m/z 실측치, 404.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.92 (s, 1H), 8.04 – 8.00 (m, 1H), 7.98 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.85 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.56 – 7.24 (m, 2H), 7.23 – 7.20 (m, 1H), 5.53 (s, 2H).

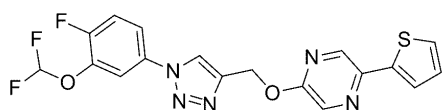
[1854] 실시예 396: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진.



[1855]

[1856] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-메틸피라진을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₂F₃N₃O₂에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 351.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.95 (s, 1H), 8.25 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.14 – 8.12 (m, 1H), 7.99 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.6 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.42 (s, 3H).

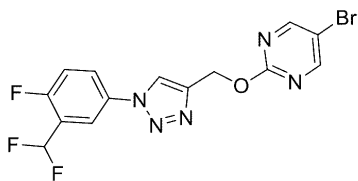
[1857] 실시예 397: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-티에닐)피라진.



[1858]

[1859] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-(티오펜-2-일)피라진을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₈H₁₂F₃N₃O₂S에 대한 질량 계산치, 419.1; m/z 실측치, 419.9 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.97 (s, 1H), 8.83 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.34 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.6 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 3.6, 1.1 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 5.1, 1.1 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.7 Hz, 1H), 7.19 (dd, J = 5.1, 3.6 Hz, 1H), 5.58 (s, 2H).

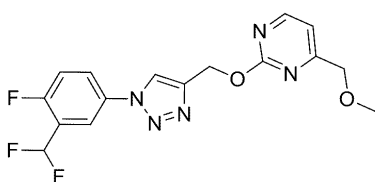
[1860] 실시예 398: 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1861]

[1862] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 5-브로모-2-클로로 피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_6BrF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 399.0; m/z 실험치, 399.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9.00 (s, 1H), 8.82 (s, 2H), 8.18 (dd, $J = 12.7, 4.6$ Hz, 2H), 7.66 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 7.31 (t, $J = 53.9$ Hz, 1H), 5.54 (s, 2H).

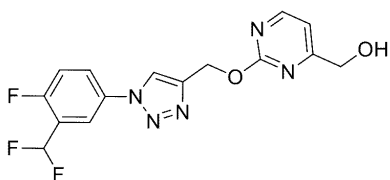
[1863] 실시예 399: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[1864]

[1865] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실험치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.98 – 7.85 (m, 2H), 7.33 (s, 1H), 7.16 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 7.10 – 6.79 (m, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.50 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 3.50 (s, 3H).

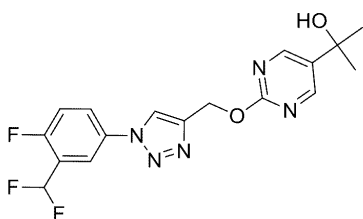
[1866] 실시예 400: [2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



[1867]

[1868] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 54)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실험치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.56 – 8.45 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.20 – 8.11 (s, 1H), 7.99 – 7.93 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (ddd, $J = 8.1, 4.2, 2.9$ Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (tt, $J = 9.0, 1.1$ Hz, 1H), 7.10 – 6.79 (m, 2H), 5.74 – 5.63 (m, 2H), 4.81 – 4.66 (m, 2H).

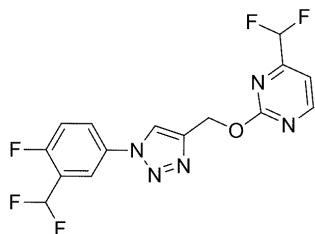
[1869] 실시예 401: 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1870]

[1871] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 2H), 8.17 – 8.13 (m, 1H), 7.98 – 7.88 (m, 2H), 7.37 – 7.29 (m, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 1.63 (s, 6H).

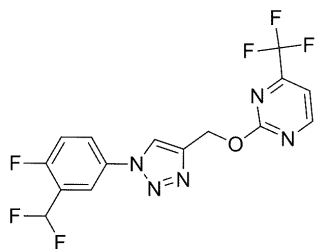
[1872] 실시예 402: 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1873]

[1874] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.79 – 8.74 (m, 1H), 8.20 – 8.15 (m, 1H), 7.97 – 7.93 (m, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.38 – 7.28 (m, 2H), 7.09 – 6.83 (m, 1H), 6.63 – 6.37 (m, 1H), 5.75 – 5.68 (m, 2H).

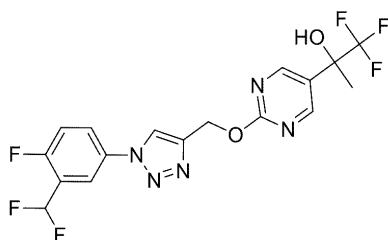
[1875] 실시예 403: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[1876]

[1877] (1-(3-(1,1-다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-4-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 389.1; m/z 실측치, 390.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.83 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 8.19 (t, J = 0.6 Hz, 1H), 7.98 – 7.85 (m, 2H), 7.39 – 7.30 (m, 2H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.72 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

[1878] 실시예 404: (R/S)-2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올.

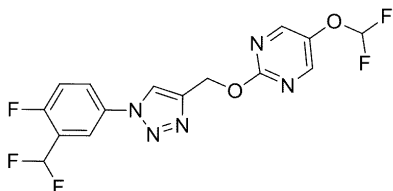


[1879]

[1880] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)-1,1,1-트라이플루오로프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방

식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_6N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 433.1; m/z 실측치, 434.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.78 – 8.71 (s, 2H), 8.16 – 8.12 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.98 – 7.93 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.38 – 7.29 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.08 – 6.79 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.73 – 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.59 – 2.51 (s, 1H), 1.87 – 1.80 (m, 3H).

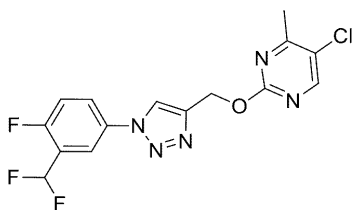
[1881] 실시예 405: 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1882]

[1883] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 387.1; m/z 실측치, 388.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (t, J = 0.8 Hz, 2H), 8.14 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.01 – 7.86 (m, 2H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.53 (t, J = 71.9 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

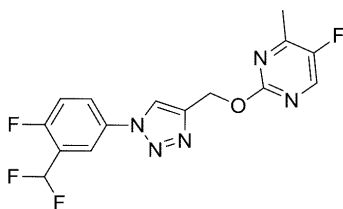
[1884] 실시예 406: 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1885]

[1886] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.99 – 7.86 (m, 2H), 7.39 – 7.29 (m, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.57 (s, 3H).

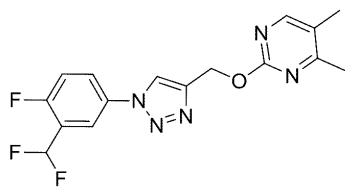
[1887] 실시예 407: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[1888]

[1889] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.12 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.97 – 7.87 (m, 2H), 7.33 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 6.95 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.50 (d, J = 2.5 Hz, 3H).

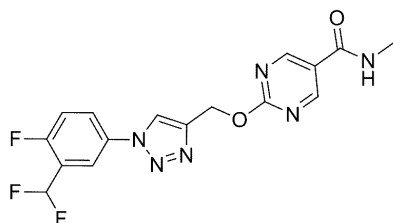
[1890] 실시예 408: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[1891]

[1892] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.21 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.13 (t, $J = 0.8$ Hz, 1H), 7.98 – 7.85 (m, 2H), 7.32 (s, 1H), 6.95 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.66 – 5.59 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.20 (s, 3H).

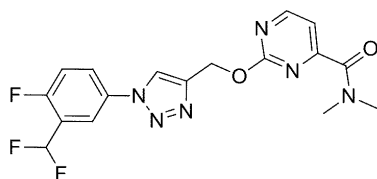
[1893] 실시예 409: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복스아미드.



[1894]

[1895] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-N-메틸피리미딘-5-카르복스아미드를 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 378.1; m/z 실측치, 379.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 9.05 – 8.95 (m, 2H), 8.42 – 8.34 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.05 – 8.00 (m, 1H), 8.00 – 7.91 (m, 1H), 7.40 – 7.35 (m, 1H), 7.12 – 6.85 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 5.76 – 5.66 (s, 2H), 3.03 – 2.87 (m, 3H).

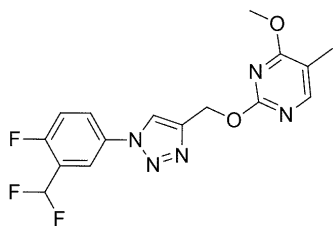
[1896] 실시예 410: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-카르복스아미드.



[1897]

[1898] 단계 B에서 다이메틸아민을 사용하여, 실시예 162, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 392.1; m/z 실측치, 393.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.69 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 1H), 7.22 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 6.95 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.72 – 5.62 (m, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.09 (s, 3H).

[1899] 실시예 411: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-5-메틸-피리미딘.



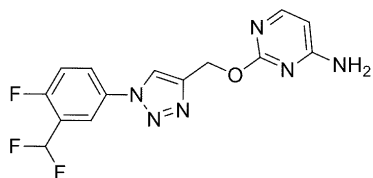
[1900]

[1901]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4-메톡시-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실험치, 366.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.14 – 8.10 (s, 1H), 8.05 – 8.00 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 7.97 – 7.92 (dd, J = 5.8, 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 1H), 7.08 – 6.82 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.64 – 5.60 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 4.07 – 3.90 (s, 3H), 2.12 – 2.02 (m, 3H).

[1902]

실시예 412: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



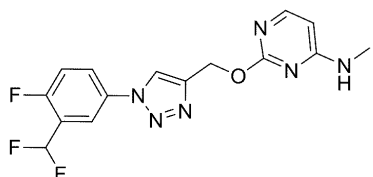
[1903]

[1904]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실험치, 337.0, $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.09 (s, 1H), 8.09 – 8.01 (m, 1H), 7.99 – 7.84 (m, 2H), 7.38 – 7.28 (m, 1H), 7.10 – 6.76 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.19 – 6.09 (m, 1H), 5.63 – 5.54 (m, 2H), 5.08 – 4.89 (s, 2H).

[1905]

실시예 413: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



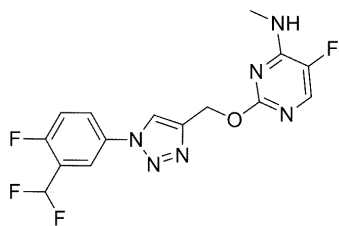
[1906]

[1907]

tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실험치, 351.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.14 – 8.10 (s, 1H), 8.07 – 7.98 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 1H), 7.07 – 6.81 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.08 – 6.02 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.64 – 5.55 (s, 2H), 5.14 – 4.91 (m, 1H), 3.04 – 2.86 (d, J = 4.8 Hz, 3H).

[1908]

실시예 414: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.



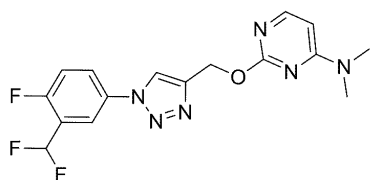
[1909]

[1910]

단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 368.1; m/z 실측치, 369.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 – 8.09 (d, J = 0.8 Hz, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.37 – 7.28 (m, 1H), 7.11 – 6.77 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.64 – 5.50 (m, 2H), 5.26 – 5.01 (s, 1H), 3.14 – 2.98 (m, 3H).

[1911]

실시예 415: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



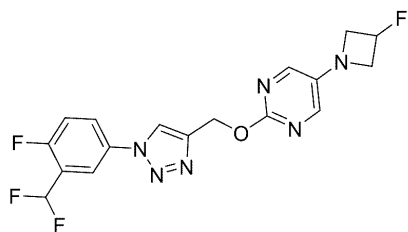
[1912]

[1913]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.14 – 8.09 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.06 – 8.01 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.97 – 7.92 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.35 – 7.28 (m, 1H), 7.08 – 6.81 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.16 – 6.08 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.64 – 5.58 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.21 – 3.04 (s, 6H).

[1914]

실시예 416: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



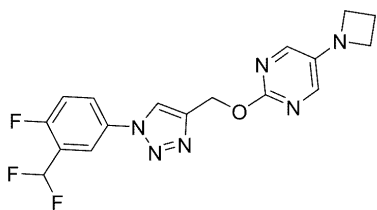
[1915]

[1916]

5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 398) 및 3-플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 394.3; m/z 실측치, 395.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.18 – 8.15 (s, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.97 – 7.92 (m, 1H), 7.92 – 7.89 (s, 2H), 7.40 – 7.33 (m, 1H), 7.14 – 6.84 (m, 1H), 5.67 – 5.61 (s, 2H), 5.60 – 5.39 (m, 1H), 4.34 – 4.22 (m, 2H), 4.11 – 3.98 (m, 2H).

[1917]

실시예 417: 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



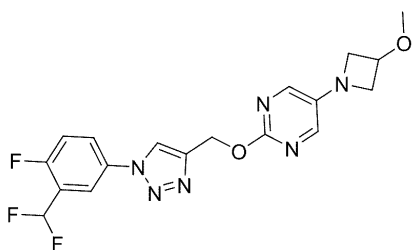
[1918]

[1919]

5-프로모-2-((1-(4-플루오로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 398) 및 아제티딘을 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 376.3; m/z 실측치, 377.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.18 – 8.12 (s, 1H), 8.01 – 7.97 (m, 1H), 7.96 – 7.91 (m, 1H), 7.88 – 7.83 (s, 2H), 7.40 – 7.32 (m, 1H), 7.14 – 6.83 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.66 – 5.58 (s, 2H), 4.02 – 3.87 (m, 4H), 2.55 – 2.43 (m, 2H).

[1920]

실시예 418: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘.



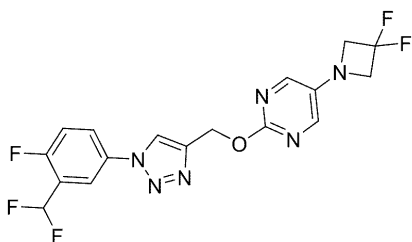
[1921]

[1922]

5-프로모-2-((1-(4-플루오로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 398) 및 3-메톡시아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 406.3; m/z 실측치, 407.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.12 – 8.09 (s, 1H), 7.97 – 7.92 (m, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.81 (s, 2H), 7.35 – 7.29 (m, 1H), 7.07 – 6.81 (m, 1H), 5.62 – 5.56 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.43 – 4.36 (m, 1H), 4.19 – 4.11 (m, 2H), 3.79 – 3.68 (m, 2H), 3.37 – 3.31 (s, 3H).

[1923]

실시예 419: 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[1924]

[1925]

5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 398) 및 3,3-다이플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_5N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 412.3; m/z 실측치, 413.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.13 – 8.11 (s, 1H), 7.96 – 7.93 (m, 1H), 7.93 – 7.88 (s, 3H), 7.36 – 7.30 (m, 1H), 7.07 – 6.82 (m, 1H), 5.62 – 5.57 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 4.33 – 4.22 (m, 4H).

[1926]

실시예 420: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로-3-메틸아제티딘-1-일)피리미딘.

[1928]

[1929]

Fc1ccc(cc1N2C=CN=C2COc3ncnc4c3N(C4)C5CC(C5)C(F)F)C(F)(F)F

[1931]

[1932]

Fc1cc(ccc1N2C=CN=C2COc3ncnc3N4CC(F)(F)CC4)c5c(F)c(F)c(F)c5

[1934]

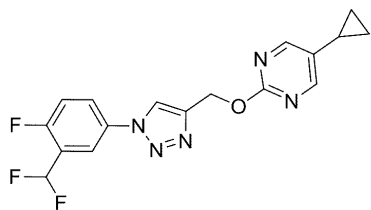
– 238 –

[1935]

실시예

423:

5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

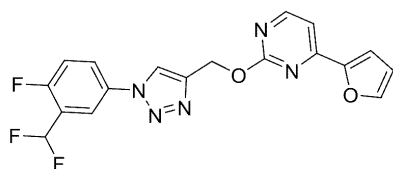


[1936]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실험치, 362.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.96 – 7.87 (m, 2H), 7.32 (t, $J = 9.0$ Hz, 1H), 6.95 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 1.88 – 1.78 (m, 1H), 1.07 – 0.99 (m, 2H), 0.75 – 0.64 (m, 2H).

[1938]

실시예 424: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(2-푸릴)피리미딘.

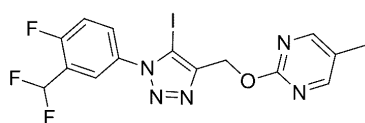


[1939]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4-(푸란-2-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{12}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 387.1; m/z 실험치, 388.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.62 – 8.52 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.25 – 8.15 (s, 1H), 7.98 – 7.93 (m, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 1H), 7.39 – 7.28 (m, 3H), 7.08 – 6.80 (t, $J = 54.6$ Hz, 1H), 6.64 – 6.56 (m, 1H), 5.76 – 5.67 (s, 2H).

[1941]

실시예 425: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]-5-요오도-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

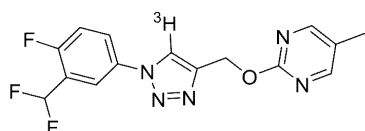


[1942]

(1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-5-요오도-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 27) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_3IN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 461.0; m/z 실험치, 461.8 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.51 – 8.49 (m, 2H), 7.99 – 7.91 (m, 2H), 7.75 – 7.67 (m, 1H), 7.33 (t, $J = 53.9$ Hz, 1H), 5.44 (s, 2H), 2.22 (s, 3H).

[1944]

실시예 426: [3H]-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일-5-t)메톡시)-5-메틸피리미딘.

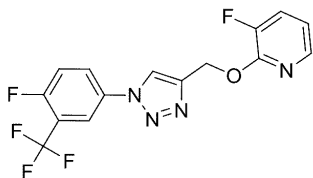


[1945]

2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-5-요오도-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘 (실

시에 425, 5 mg, 0.01 mmol), Pd/C 10% (9 mg, 0.008 mmol), DMF (1 ml), DIPEA (0.018 mL, 0.1 mmol) 및 삼중수소 가스 (760 mm Hg)의 용액을 30분 동안 교반하였다. 생성된 생성물을 에탄올에 용해시키고, 여과하였다. 불안정한 삼중수소를 회전증발기로 3번 제거하였다. 정제 (A: 0.1% TFA, B: 100% CH₃CN, A 내지 100% B (60분 내)의 그라디언트를 사용하는 HPLC-C-18 컬럼, U.V. 250 nm, 유량 6 ml/min)에 의해, 표제 화합물을 얻었다.

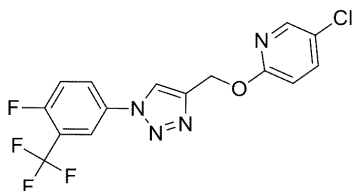
[1947] 실시예 427: 3-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[1948]

[1949] 2-클로로-3-플루오로피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₉F₅N₄O에 대한 질량 계산치, 356.1; m/z 실측치, 357.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.11 (s, 1H), 8.04 – 7.92 (m, 3H), 7.44 – 7.33 (m, 2H), 6.95 – 6.88 (m, 1H), 5.69 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

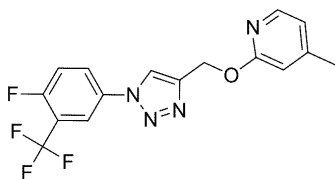
[1950] 실시예 428: 5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



[1951]

[1952] 2, 5-다이클로로피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₉ClF₄N₄O에 대한 질량 계산치, 372.0; m/z 실측치, 373.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.16 – 8.12 (m, 1H), 8.10 – 8.04 (m, 1H), 8.03 – 7.91 (m, 2H), 7.60 – 7.53 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.81 – 6.72 (m, 1H), 5.57 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

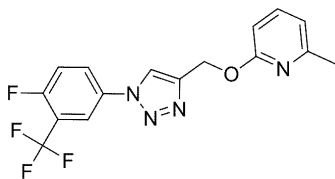
[1953] 실시예 429: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘.



[1954]

[1955] 2-클로로-4-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₂F₄N₄O에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, CDCl₃) δ 8.08 – 8.03 (m, 2H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.97 – 7.92 (m, 1H), 7.39 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.75 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 6.62 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 5.59 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.31 (s, 3H).

[1956] 실시예 430: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘.

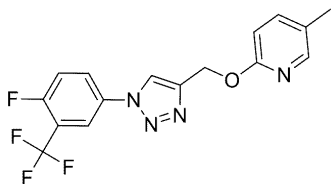


[1957]

[1958] 2-클로로-6-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI):

$C_{16}H_{12}F_4N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.07 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.97 – 7.92 (m, 1H), 7.52 – 7.46 (m, 1H), 7.39 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.88 – 6.70 (m, 1H), 6.68 – 6.54 (m, 1H), 5.60 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.48 (t, J = 0.7 Hz, 3H).

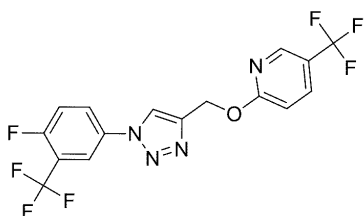
[1959] 실시예 431: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘.



[1960]

[1961] 2-클로로-5-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_4N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 – 8.05 (m, 1H), 8.03 – 7.97 (m, 2H), 7.98 – 7.93 (m, 1H), 7.45 – 7.36 (m, 2H), 6.72 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 5.69 – 5.48 (m, 2H), 2.26 (s, 3H).

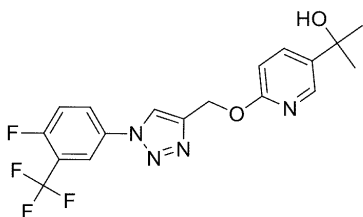
[1962] 실시예 432: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘.



[1963]

[1964] 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_9F_7N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 406.1; m/z 실측치, 407.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.50 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 8.09 (t, J = 0.6 Hz, 1H), 8.03 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.93 (m, 1H), 7.85 – 7.78 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.91 – 6.88 (m, 1H), 5.66 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

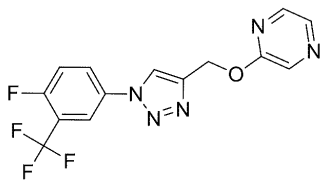
[1965] 실시예 433: 2-[6-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-피리딜]프로판-2-올.



[1966]

[1967] 2-(6-클로로피리딘-3-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_4N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 396.1; m/z 실측치, 397.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.34 – 8.27 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 8.03 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.93 (m, 1H), 7.80 – 7.72 (m, 1H), 7.39 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 8.6, 0.8 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 1.60 (s, 6H).

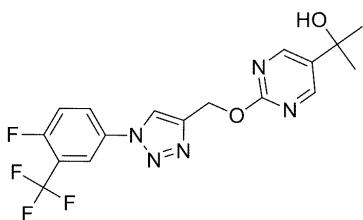
[1968] 실시예 434: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피라진.



[1969]

[1970] (1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로피라진을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 – 8.27 (m, 1H), 8.30 – 8.07 (m, 2H), 8.07 – 7.93 (m, 2H), 7.41 (t, $J = 9.6$ Hz, 1H), 7.26 (s, 1H), 5.62 (s, 2H).

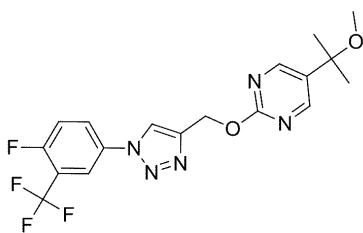
[1971] 실시예 435: 2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[1972]

[1973] (1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실측치, 398.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 2H), 8.15 (s, 1H), 7.99 (d, $J = 20.7$ Hz, 2H), 7.50 – 7.28 (m, 1H), 5.82 – 5.58 (m, 2H), 1.78 – 1.44 (m, 6H).

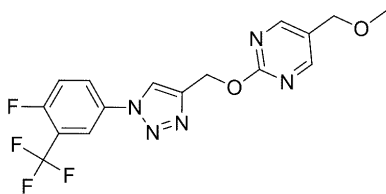
[1974] 실시예 436: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘.



[1975]

[1976] 2-(2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 435)을 사용하여, 실시예 311과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.64 – 8.53 (s, 2H), 8.20 – 8.13 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.03 – 7.99 (m, 1H), 7.98 – 7.94 (m, 1H), 7.46 – 7.36 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.72 – 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.16 – 3.08 (s, 3H), 1.59 – 1.51 (s, 6H).

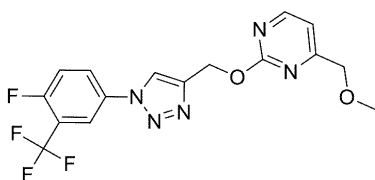
[1977] 실시예 437: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘.



[1978]

[1979] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.60 – 8.48 (s, 2H), 8.21 – 8.10 (m, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.46 – 7.35 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.74 – 5.61 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 4.50 – 4.33 (s, 2H), 3.49 – 3.36 (s, 3H).

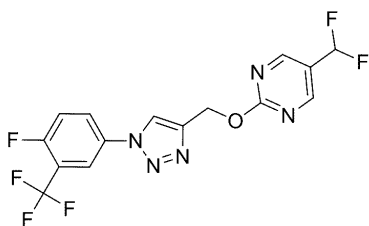
[1980] 실시예 438: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[1981]

[1982] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.17 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.03 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 7.16 (dt, J = 5.0, 0.7 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.50 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.50 (s, 3H).

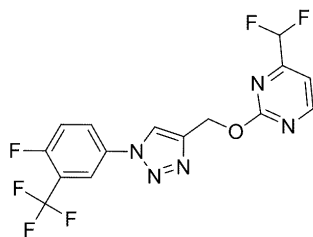
[1983] 실시예 439: 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1984]

[1985] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5)을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 389.1; m/z 실측치, 390.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.72 (t, J = 1.3 Hz, 2H), 8.15 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.04 – 7.98 (m, 1H), 7.99 – 7.92 (m, 1H), 7.41 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.73 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 5.72 (d, J = 0.7 Hz, 2H).

[1986] 실시예 440: 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



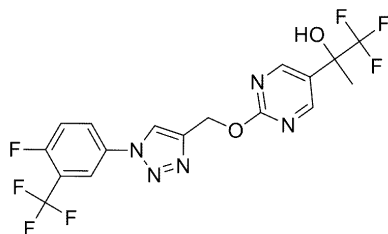
[1987]

[1988]

(1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_9F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 389.1; m/z 실측치, 390.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.77 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.05 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.41 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.51 (t, J = 54.7 Hz, 1H), 5.71 (d, J = 0.9 Hz, 2H).

[1989]

실시예 441: (R/S)-1,1,1-트라이플루오로-2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



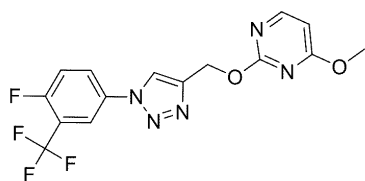
[1990]

[1991]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)-1,1,1-트라이플루오로프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_7N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 451.1; m/z 실측치, 452.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.78 – 8.73 (s, 2H), 8.18 – 8.11 (s, 1H), 8.05 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (d, J = 9.0 Hz, 1H), 7.45 – 7.37 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.73 – 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.68 – 2.60 (d, J = 17.8 Hz, 1H), 1.85 – 1.81 (d, J = 1.1 Hz, 3H).

[1992]

실시예 442: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘.

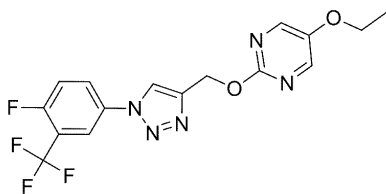


[1993]

[1994]

(1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-4-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 8.08 – 7.87 (m, 2H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.44 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.66 (s, 2H), 3.99 (s, 3H).

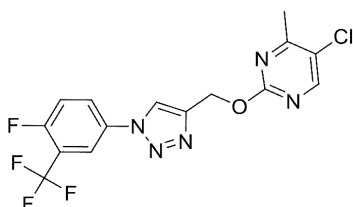
[1995] 실시예 443: 5-에톡시-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[1996]

[1997] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-에톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 8.06 – 7.91 (m, 2H), 7.40 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.09 (q, J = 7.0 Hz, 2H), 1.44 (t, J = 6.9 Hz, 3H).

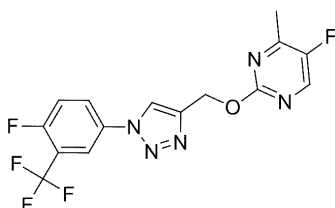
[1998] 실시예 444: 5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[1999]

[2000] (1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 387.1; m/z 실측치, 388.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 1H), 8.13 (s, 1H), 8.11 – 7.90 (m, 2H), 7.41 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 3.5 Hz, 2H), 2.68 – 2.50 (m, 3H).

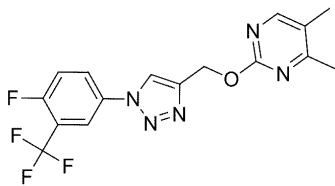
[2001] 실시예 445: 5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2002]

[2003] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.12 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.06 – 7.90 (m, 2H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.50 (d, J = 2.5 Hz, 3H).

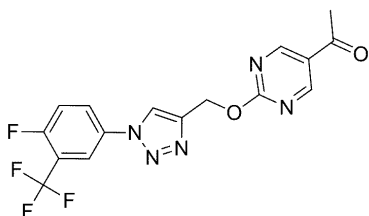
[2004] 실시예 446: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[2005]

[2006] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1*H*-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 – 8.10 (m, 1H), 8.06 – 7.89 (m, 2H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.74 (s, 1H), 5.65 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.44 (d, J = 0.5 Hz, 6H).

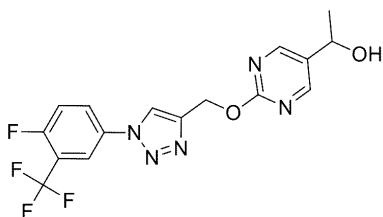
[2007] 실시예 447: 1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[2008]

[2009] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1*H*-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-온을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.19 – 9.07 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 8.22 – 8.11 (s, 1H), 8.07 – 7.91 (m, 2H), 7.47 – 7.37 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.82 – 5.71 (s, 2H), 2.73 – 2.52 (s, 3H).

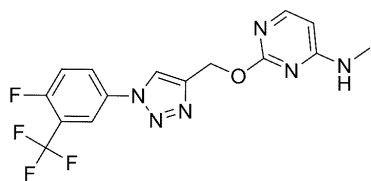
[2010] 실시예 448: (R/S)-1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[2011]

[2012] 1-(2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1*H*-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 (실시예 447)을 사용하여, 실시예 157과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.62 – 8.53 (s, 2H), 8.19 – 8.13 (s, 1H), 8.04 – 7.99 (m, 1H), 7.99 – 7.92 (m, 1H), 7.44 – 7.35 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.69 – 5.59 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 5.02 – 4.88 (m, 1H), 2.41 – 2.17 (s, 1H), 1.62 – 1.49 (d, J = 6.5 Hz, 3H).

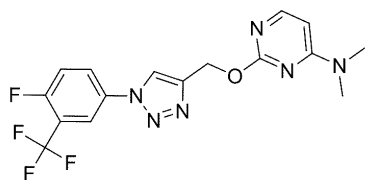
[2013] 실시예 449: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[2014]

[2015] tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 368.1; m/z 실측치, 369.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 – 8.09 (s, 1H), 8.09 – 7.99 (m, 2H), 7.98 – 7.89 (dt, J = 8.8, 3.4 Hz, 1H), 7.46 – 7.34 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.17 – 5.99 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.69 – 5.54 (s, 2H), 5.34 – 5.08 (s, 1H), 3.05 – 2.91 (d, J = 4.4 Hz, 3H).

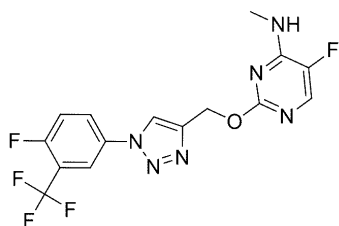
[2016] 실시예 450: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



[2017]

[2018] (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 382.1; m/z 실측치, 383.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.12 (s, 1H), 8.08 – 7.98 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 7.98 – 7.90 (m, 1H), 7.44 – 7.33 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 6.17 – 6.10 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.64 – 5.58 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.19 – 3.06 (s, 6H).

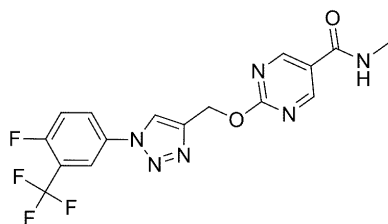
[2019] 실시예 451: 5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[2020]

[2021] 단계 A에서 (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_5N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 386.1; m/z 실측치, 387.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.10 (s, 1H), 8.06 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.89 (m, 1H), 7.85 – 7.78 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 7.46 – 7.34 (t, J = 9.0 Hz, 1H), 5.62 – 5.54 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 5.20 – 5.04 (s, 1H), 3.20 – 2.96 (m, 3H).

[2022] 실시예 452: 2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카복사미드.



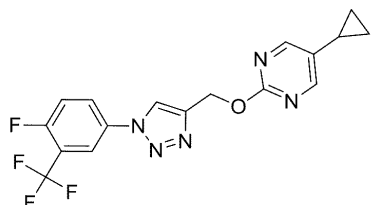
[2023]

[2024]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-N-메틸피리미딘-5-카르복사미드를 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 396.1; m/z 실측치, 397.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.00 – 8.98 (s, 2H), 8.44 – 8.38 (s, 1H), 8.12 – 8.07 (m, 1H), 8.07 – 8.00 (m, 1H), 7.49 – 7.41 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 5.77 – 5.67 (s, 2H), 3.03 – 2.90 (s, 3H).

[2025]

실시예 453: 5-사이클로프로필-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



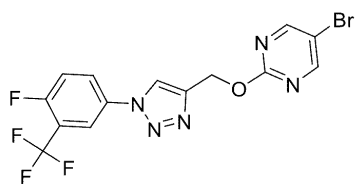
[2026]

[2027]

(1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 8.14 – 8.12 (m, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.98 – 7.92 (m, 1H), 7.40 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 1.90 – 1.76 (m, 1H), 1.09 – 0.97 (m, 2H), 0.75 – 0.65 (m, 2H).

[2028]

실시예 454: 5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



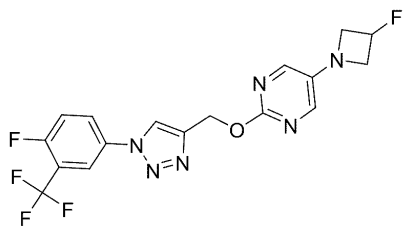
[2029]

[2030]

(1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 5) 및 2,5-다이브로모피리미딘을 사용하여, 실시예 156과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8BrF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 418.3; m/z 실측치, 419.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 – 8.61 (s, 2H), 8.20 – 8.15 (s, 1H), 8.07 – 8.02 (m, 1H), 8.02 – 7.96 (m, 1H), 7.48 – 7.40 (m, 1H), 5.72 – 5.65 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

[2031]

실시예 455: 2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



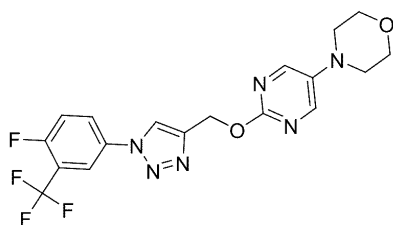
[2032]

[2033]

5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 454) 및 3-플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_5N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 412.3; m/z 실측치, 413.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.08 – 8.02 (s, 1H), 7.96 – 7.90 (m, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.82 – 7.76 (s, 2H), 7.37 – 7.27 (m, 1H), 5.54 – 5.49 (m, 2H), 5.48 – 5.26 (m, 1H), 4.23 – 4.11 (m, 2H), 3.99 – 3.84 (m, 2H).

[2034]

실시예 456: 4-(2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린.



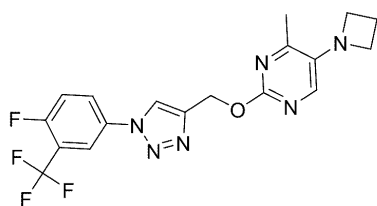
[2035]

[2036]

5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘 (실시예 454)을 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 424.3; m/z 실측치, 425.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 – 8.13 (s, 2H), 8.07 – 8.04 (s, 1H), 7.95 – 7.91 (m, 1H), 7.91 – 7.85 (m, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 1H), 5.57 – 5.51 (s, 2H), 3.85 – 3.76 (m, 4H), 3.08 – 3.00 (m, 4H).

[2037]

실시예 457: 5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메틸피리미딘.



[2038]

[2039]

5-클로로-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메틸피리미딘 (실시예 444) 및 아제티딘을 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 408.3; m/z 실측치, 409.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.18 – 8.15 (s, 1H), 8.06 – 8.02 (m, 1H), 8.01 – 7.96 (m, 1H), 7.76 – 7.72 (s, 1H), 7.47 – 7.40 (m, 1H), 5.66 – 5.59 (s, 2H), 3.96 – 3.88 (m, 4H), 2.44 – 2.42 (s, 3H), 2.42 – 2.36 (m, 2H).

[2040]

실시예 458: 2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-4-메틸피리미딘-5-아민.

[2042]

[2043]

CCNc1ccnc(OCc2nnn(c2)c3ccc(cc3F)C(F)(F)F)c1

[2045]

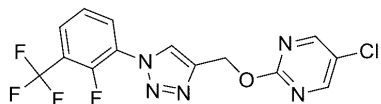
[2046]

COC1CCN1c2ncnc3cc(OCc4cnnn4-c5ccc(cc5F)C(F)(F)F)nc23

[2048]

– 250 –

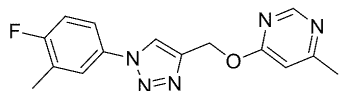
[2049] 실시예 461: 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2050]

[2051] 2,5-다이클로로피리미딘 및 (1-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 28)을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_8ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 373.0; m/z 실측치, 373.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.82 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.25 – 8.17 (m, 1H), 8.05 – 7.99 (m, 1H), 7.70 – 7.64 (m, 1H), 5.57 (s, 2H).

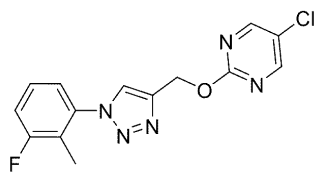
[2052] 실시예 462: 4-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘.



[2053]

[2054] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 4-클로로-6-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.85 (s, 1H), 8.72 (d, $J = 1.1$ Hz, 1H), 7.90 – 7.86 (m, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 6.88 – 6.86 (m, 1H), 5.55 (s, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.34 (d, $J = 2.1$ Hz, 3H).

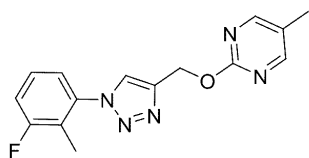
[2055] 실시예 463: 5-클로로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2056]

[2057] (1-(3-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 49) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.77 (s, 2H), 8.65 (s, 1H), 7.52 – 7.41 (m, 2H), 7.38 – 7.33 (m, 1H), 5.54 (s, 2H), 2.25 – 1.93 (m, 3H).

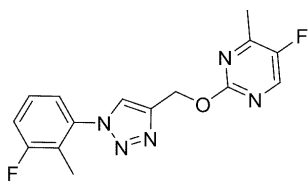
[2058] 실시예 464: 2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2059]

[2060] (1-(3-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 49) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.63 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.51 – 7.41 (m, 2H), 7.35 (dd, $J = 6.8, 1.9$ Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.21 (d, $J = 0.8$ Hz, 3H), 2.05 (d, $J = 2.2$ Hz, 3H).

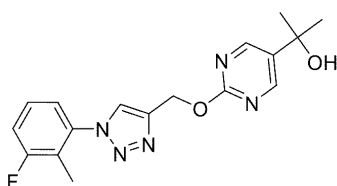
[2061] 실시예 465: 5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2062]

[2063] (1-(3-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 49) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.41 - 8.35 (m, 2H), 7.42 (td, J = 8.2, 5.9 Hz, 1H), 7.32 (td, J = 8.9, 8.3, 1.3 Hz, 1H), 7.26 (dd, J = 7.9, 1.3 Hz, 1H), 5.58 (d, J = 1.8 Hz, 2H), 2.48 (d, J = 2.6 Hz, 3H), 2.09 (d, J = 2.2 Hz, 3H).

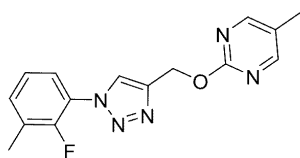
[2064] 실시예 466: 2-[2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2065]

[2066] (1-(3-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 49) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{18}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.69 (s, 2H), 8.65 (d, J = 4.5 Hz, 1H), 7.53 - 7.42 (m, 2H), 7.36 (d, J = 7.4 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 5.32 (s, 1H), 2.07 (s, 3H), 1.47 (d, J = 6.6 Hz, 6H).

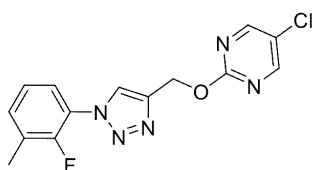
[2067] 실시예 467: 2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2068]

[2069] (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 50) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.49 (t, J = 0.7 Hz, 2H), 7.68 - 7.60 (m, 1H), 7.55 - 7.45 (m, 1H), 7.33 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.36 (d, J = 2.3 Hz, 3H), 2.21 (t, J = 0.7 Hz, 3H).

[2070] 실시예 468: 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

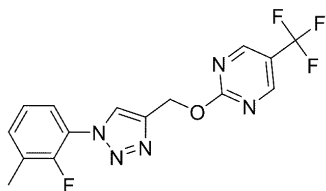


[2071]

[2072] (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 50) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}Cl_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치,

319.1; m/z 실측치, 320.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.77 (s, 2H), 8.69 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.63 (td, J = 7.6, 1.8 Hz, 1H), 7.57 - 7.46 (m, 1H), 7.33 (td, J = 7.8, 1.0 Hz, 1H), 5.55 (s, 2H), 2.36 (d, J = 2.2 Hz, 3H).

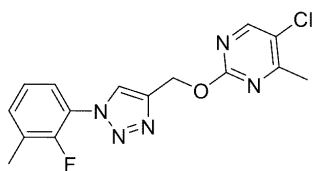
[2073] 실시예 469: 2-[[1-(2-플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[2074]

[2075] (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 50) 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₁F₄N₅O에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 9.12 (q, J = 0.8 Hz, 2H), 8.73 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.68 - 7.60 (m, 1H), 7.51 (tdd, J = 7.0, 1.8, 0.9 Hz, 1H), 7.33 (td, J = 7.8, 1.0 Hz, 1H), 5.66 (s, 2H), 2.36 (d, J = 2.1 Hz, 3H).

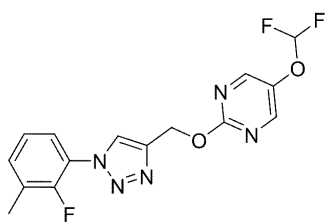
[2076] 실시예 470: 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸피리미딘.



[2077]

[2078] (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 50) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₃ClF₂N₅O에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8.68 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.62 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.63 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.51 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 7.33 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 5.53 (d, J = 1.5 Hz, 2H), 2.50 (m, 3H), 2.36 (d, J = 2.1 Hz, 3H).

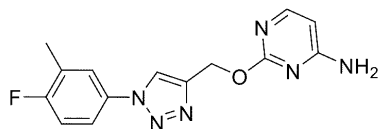
[2079] 실시예 471: 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2080]

[2081] (1-(2-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 50) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₂F₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.70 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 8.65 (s, 2H), 7.68 - 7.59 (m, 1H), 7.55 - 7.47 (m, 1H), 7.45 - 7.03 (m, 2H), 5.54 (s, 2H), 2.36 (d, J = 2.2 Hz, 3H).

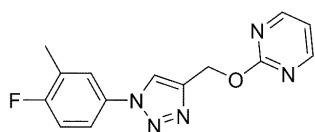
[2082] 실시예 472: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[2083]

[2084] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}FN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 300.1; m/z 실측치, 301.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.82 (s, 1H), 7.89 (t, $J = 6.4$ Hz, 2H), 7.75 (dt, $J = 7.6, 3.4$ Hz, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 6.92 (s, 2H), 6.11 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 2.33 (d, $J = 2.0$ Hz, 3H).

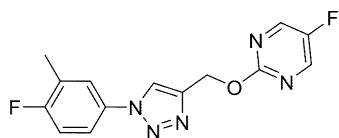
[2085] 실시예 473: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2086]

[2087] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{12}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실측치, 286.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.87 (s, 1H), 8.67 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.90 (ddd, $J = 6.7, 2.8, 0.9$ Hz, 1H), 7.81 - 7.71 (m, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 7.20 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.33 (d, $J = 2.0$ Hz, 3H).

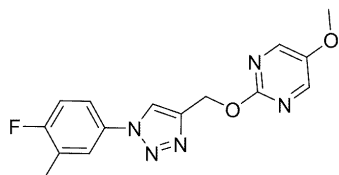
[2088] 실시예 474: 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2089]

[2090] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 7.93 - 7.85 (m, 1H), 7.76 (dt, $J = 7.9, 3.6$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.33 (d, $J = 2.1$ Hz, 3H).

[2091] 실시예 475: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.

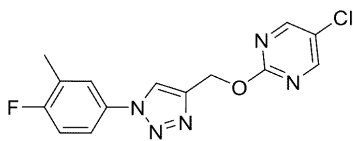


[2092]

[2093] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.84 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.89 (dd, $J = 6.6, 2.7$ Hz, 1H), 7.76 (dt, $J = 8.4, 3.6$ Hz, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.45 (s, 2H), 3.86 (s,

3H), 2.33 (d, $J = 2.1$ Hz, 3H).

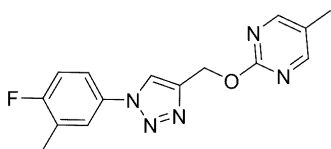
[2094] 실시예 476: 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2095]

[2096] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 7.95 - 7.86 (m, 1H), 7.76 (dt, $J = 7.5, 3.6$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 2.33 (d, $J = 2.0$ Hz, 3H).

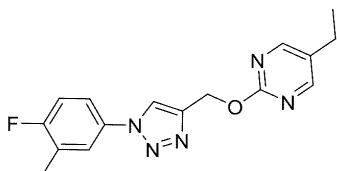
[2097] 실시예 477: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2098]

[2099] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.85 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.89 (ddd, $J = 6.6, 2.8, 0.9$ Hz, 1H), 7.83 - 7.71 (m, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.33 (d, $J = 2.0$ Hz, 3H), 2.21 (t, $J = 0.8$ Hz, 3H).

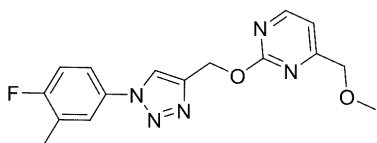
[2100] 실시예 478: 5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2101]

[2102] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 (s, 1H), 8.53 (s, 2H), 7.90 (dd, $J = 6.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.76 (dt, $J = 8.2, 3.6$ Hz, 1H), 7.38 (t, $J = 9.1$ Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.57 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.33 (d, $J = 2.0$ Hz, 3H), 1.19 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

[2103] 실시예 479: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.

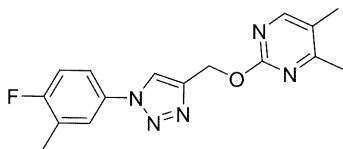


[2104]

[2105] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계

산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0[M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.85 (s, 1H), 8.64 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 7.88 (ddd, J = 6.5, 2.7, 0.9 Hz, 1H), 7.75 (ddd, J = 8.9, 4.3, 3.0 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.24 - 7.12 (m, 1H), 5.51 (s, 2H), 4.47 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.40 (s, 3H), 2.33 (d, J = 2.1 Hz, 3H).

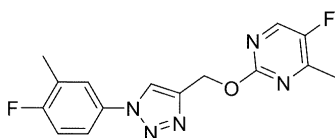
[2106] 실시예 480: 2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[2107]

[2108] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₆FN₅O에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.82 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 7.89 (dd, J = 6.7, 2.9 Hz, 1H), 7.75 (dt, J = 7.5, 3.5 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.46 (s, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.33 (d, J = 2.0 Hz, 3H), 2.16 (s, 3H).

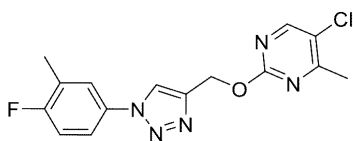
[2109] 실시예 481: 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2110]

[2111] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₃F₂N₅O에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.84 (s, 1H), 8.56 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 6.8, 2.9 Hz, 1H), 7.75 (dt, J = 8.1, 3.8 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.44 (d, J = 2.5 Hz, 3H), 2.33 (d, J = 2.0 Hz, 3H).

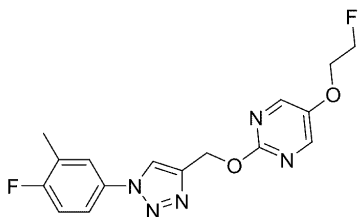
[2112] 실시예 482: 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2113]

[2114] (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 40) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₅H₁₃Cl₂N₅O에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8.84 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.88 (dd, J = 6.8, 2.8 Hz, 1H), 7.75 (dt, J = 8.9, 3.6 Hz, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.51 (m, J = 1.3 Hz, 3H), 2.33 (d, J = 2.2 Hz, 3H).

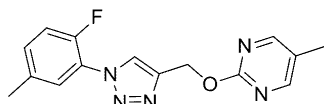
[2115] 실시예 483: 5-(2-플루오로에톡시)-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2116]

[2117] 단계 B에서 (1-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 40)을 사용하여, 실시예 192, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실험치, 348.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.29 (s, 2H), 8.05 (s, 1H), 7.64 – 7.53 (m, 1H), 7.51 – 7.42 (m, 1H), 7.14 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 5.60 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 4.88 – 4.76 (m, 1H), 4.76 – 4.65 (m, 1H), 4.36 – 4.27 (m, 1H), 4.27 – 4.18 (m, 1H), 2.36 (d, J = 2.0 Hz, 3H).

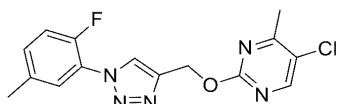
[2118] 실시예 484: 2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2119]

[2120] (1-(2-플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 29) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실험치, 300.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.67 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.51 – 8.47 (m, 2H), 7.68 – 7.64 (m, 1H), 7.48 – 7.38 (m, 2H), 5.49 (s, 2H), 2.38 (s, 3H), 2.21 (t, J = 0.8 Hz, 3H).

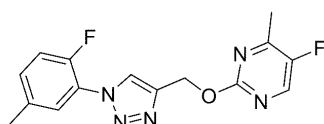
[2121] 실시예 485: 5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2122]

[2123] (1-(2-플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 29) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}Cl_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실험치, 333.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.69 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.62 (s, 1H), 7.68 – 7.64 (m, 1H), 7.48 – 7.39 (m, 2H), 5.52 (s, 2H), 2.38 (s, 3H).

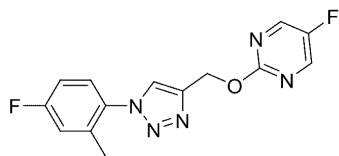
[2124] 실시예 486: 5-플루오로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2125]

[2126] (1-(2-플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 29) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실험치, 317.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.68 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.57 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 7.68 – 7.64 (m, 1H), 7.48 – 7.38 (m, 2H), 5.49 (s, 2H), 2.44 (d, J = 2.5 Hz, 3H), 2.38 (s, 3H).

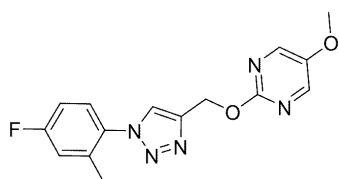
[2127] 실시예 487: 5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2128]

[2129] (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 37) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.56 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 8.35 (d, $J = 0.5$ Hz, 1H), 7.42 (dd, $J = 8.7, 5.2$ Hz, 1H), 7.22 (ddd, $J = 9.3, 2.9, 0.9$ Hz, 1H), 7.14 (dddd, $J = 8.7, 8.0, 2.9, 0.7$ Hz, 1H), 5.60 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 2.16 (s, 3H).

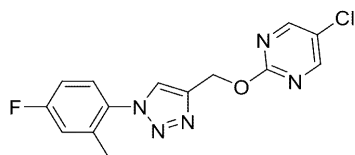
[2130] 실시예 488: 2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



[2131]

[2132] (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 37) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.56 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 7.51 (dd, $J = 8.7, 5.4$ Hz, 1H), 7.39 (dd, $J = 9.6, 2.9$ Hz, 1H), 7.26 (td, $J = 8.5, 2.9$ Hz, 1H), 5.46 (s, 2H), 3.86 (s, 3H), 2.13 (s, 3H).

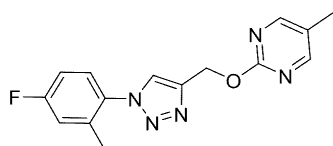
[2133] 실시예 489: 5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2134]

[2135] (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 37) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0 $[M+H]^+$.

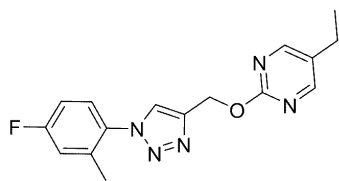
[2136] 실시예 490: 2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2137]

[2138] (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 37) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 299.1; m/z 실측치, 300.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.43 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 8.34 (s, 1H), 7.41 (dd, $J = 8.7, 5.2$ Hz, 1H), 7.20 (dd, $J = 9.5, 3.1$ Hz, 1H), 7.12 (td, $J = 8.4, 2.9$ Hz, 1H), 5.58 (s, 2H), 2.25 (d, $J = 0.8$ Hz, 3H), 2.15 (s, 3H).

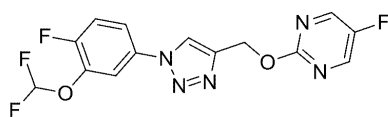
[2139] 실시예 491: 5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2140]

[2141] (1-(4-플루오로-2-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 37) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.45 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 8.35 (s, 1H), 7.41 (dd, $J = 8.7, 5.2$ Hz, 1H), 7.20 (ddd, $J = 9.3, 2.9, 0.8$ Hz, 1H), 7.12 (dddd, $J = 8.8, 8.0, 2.9, 0.7$ Hz, 1H), 5.68 – 5.47 (m, 2H), 2.62 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.15 (s, 3H), 1.24 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

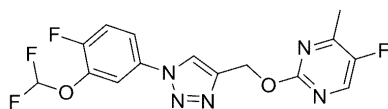
[2142] 실시예 492: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[2143]

[2144] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 355.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.96 (s, 1H), 8.76 – 8.74 (m, 2H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H).

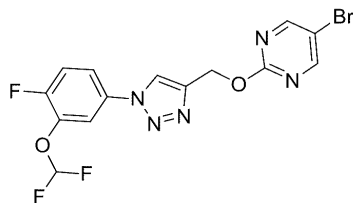
[2145] 실시예 493: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[2146]

[2147] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 369.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.94 (s, 1H), 8.57 (d, $J = 1.5$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 3.9, 2.7$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.44 (d, $J = 2.6$ Hz, 3H).

[2148] 실시예 494: 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

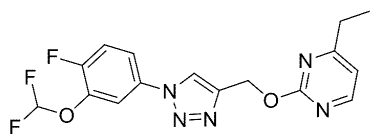


[2149]

[2150] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 5-브로모-2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_9BrF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 415.0; m/z 실측치, 416 $[M+H]^+$. ^1H NMR (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.95 (s, 1H), 8.81 (s, 2H),

7.99 (dd, $J = 6.8, 2.1$ Hz, 1H), 7.92 – 7.82 (m, 1H), 7.68 (t, $J = 9.6$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.54 (s, 2H).

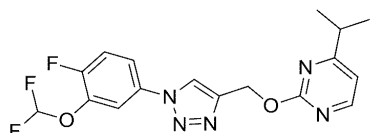
[2151] 실시예 495: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-에틸-피리미딘.



[2152]

[2153] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-에틸 피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실험치, 365.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.95 (s, 1H), 8.51 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.88 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 7.08 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.71 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.22 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

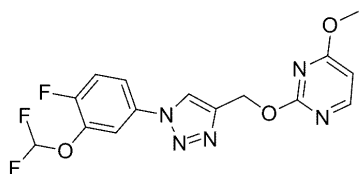
[2154] 실시예 496: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘.



[2155]

[2156] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실험치, 379.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.95 (s, 1H), 8.53 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.88 (ddd, $J = 9.0, 3.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 7.10 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.95 (hept, $J = 7.0$ Hz, 1H), 1.22 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

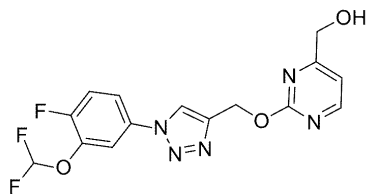
[2157] 실시예 497: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘.



[2158]

[2159] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-메톡시 피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실험치, 368.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.96 (s, 1H), 8.34 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 8.01 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.88 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.69 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.40 (t, $J = 72.7$ Hz, 1H), 6.62 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 3.91 (s, 3H).

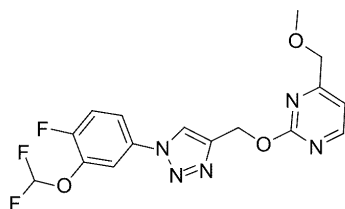
[2160] 실시예 498: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



[2161]

[2162] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-(((2-(트리메틸실릴)에톡시)메톡시)메틸)피리미딘 (실시예 383, 단계 A로부터의 생성물)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.94 (s, 1H), 8.62 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 7.0, 2.6 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 7.26 – 7.22 (m, 1H), 5.63 (t, J = 5.8 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 4.51 (d, J = 5.7 Hz, 2H).

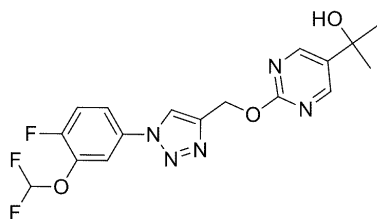
[2163] 실시예 499: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[2164]

[2165] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 381.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.95 (s, 1H), 8.64 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 7.20 – 7.17 (m, 1H), 5.53 (s, 2H), 4.48 (s, 2H), 3.41 (s, 3H).

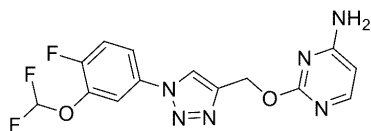
[2166] 실시예 500: 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2167]

[2168] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.70 – 8.65 (s, 2H), 8.12 – 8.08 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.71 – 7.67 (dd, J = 6.6, 2.6 Hz, 1H), 7.61 – 7.55 (m, 1H), 7.38 – 7.30 (t, J = 9.2 Hz, 1H), 6.80 – 6.48 (t, J = 72.6 Hz, 1H), 5.72 – 5.61 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 1.70 – 1.60 (s, 6H).

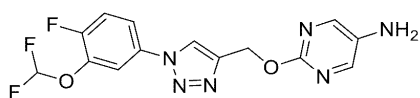
[2169] 실시예 501: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[2170]

[2171] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실험치, 352.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.91 (s, 1H), 7.99 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.91 – 7.83 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.92 (s, 2H), 6.11 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 5.37 (s, 2H).

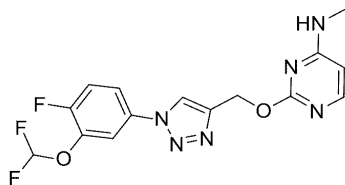
[2172] 실시예 502: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-아민.



[2173]

[2174] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로피리미딘-5-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실험치, 352.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_2Cl_2) δ 8.17 – 8.01 (m, 3H), 7.73 – 7.67 (m, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 1H), 7.40 – 7.32 (m, 1H), 6.68 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H).

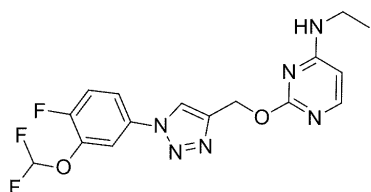
[2175] 실시예 503: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[2176]

[2177] 단계 A에서 tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실험치, 366.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.90 (s, 1H), 8.00 (dd, J = 7.0, 2.6 Hz, 1H), 7.89 – 7.79 (m, 2H), 7.67 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.55 – 7.22 (m, 2H), 6.14 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 2.81 – 2.74 (m, 3H).

[2178] 실시예 504: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-4-아민.

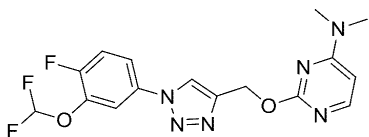


[2179]

[2180] 단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-N-에틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 60)을 사용하여, 실시예 163 단계 B

및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.90 – 7.80 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.59 – 7.20 (m, 2H), 6.13 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 1.11 (t, J = 7.2 Hz, 3H).

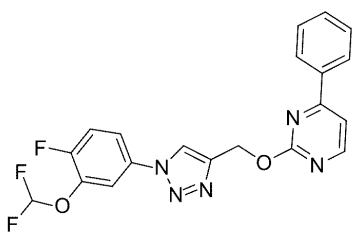
[2181] 실시예 505: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



[2182]

[2183] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 380.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.03 – 7.98 (m, 2H), 7.88 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.36 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 3.05 (s, 6H).

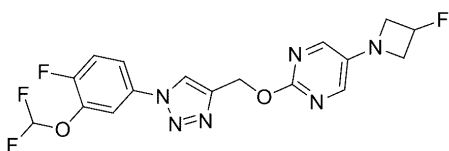
[2184] 실시예 506: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-페닐-피리미딘.



[2185]

[2186] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-4-페닐피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{20}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 413.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 Mhz, DMSO- d_6) δ 9.00 (s, 1H), 8.72 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 8.25 – 8.21 (m, 2H), 8.01 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.88 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.78 (d, J = 5.2 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.61 – 7.23 (m, 4H), 5.65 (s, 2H).

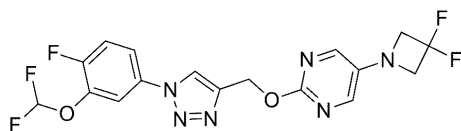
[2187] 실시예 507: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



[2188]

[2189] 단계 A에서 3-플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 165와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 410.1; m/z 실측치, 411.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, DMSO- d_6) δ 8.92 (s, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 3H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.59 – 5.38 (m, 3H), 4.26 – 4.14 (m, 2H), 4.00 – 3.88 (m, 2H).

[2190] 실시예 508: 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



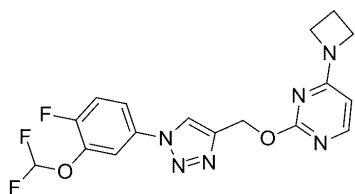
[2191]

[2192]

단계 A에서 3,3-다이플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 165와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_5N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 428.1; m/z 실측치, 429.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.93 (s, 1H), 8.08 (s, 2H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 5.45 (s, 2H), 4.34 (t, $J = 12.3$ Hz, 4H).

[2193]

실시예 509: 4-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



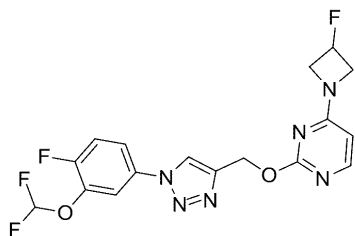
[2194]

[2195]

단계 A에서 아제티딘을 사용하여, 실시예 166과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 392.1; m/z 실측치, 392.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.89 (s, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 2H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 3.9, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.04 (d, $J = 5.8$ Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 4.02 (t, $J = 7.6$ Hz, 4H), 2.39 – 2.31 (m, 2H).

[2196]

실시예 510: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



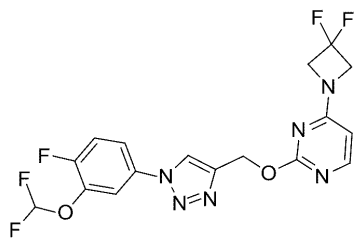
[2197]

[2198]

단계 A에서 3-플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 166과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 410.1; m/z 실측치, 410.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.90 (s, 1H), 8.06 (d, $J = 5.8$ Hz, 1H), 8.00 (dd, $J = 6.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.87 (ddd, $J = 9.0, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.67 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.39 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.16 (d, $J = 5.8$ Hz, 1H), 5.60 – 5.41 (m, 3H), 4.41 – 4.31 (m, 2H), 4.14 – 4.04 (m, 2H).

[2199]

실시예 511: 4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



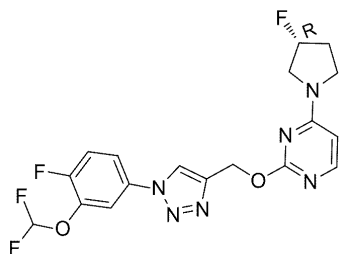
[2200]

[2201]

단계 A에서 3,3-다이플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 166과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다 MS (ESI): $C_{17}H_{13}F_5N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 428.1; m/z 실측치, 428.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.92 (s, 1H), 8.15 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.90 – 7.85 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.28 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 5.45 (s, 2H), 4.49 (t, J = 12.4 Hz, 4H).

[2202]

실시예 512: (R)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-[(3R)-3-플루오로 피롤리딘-1-일]피리미딘.



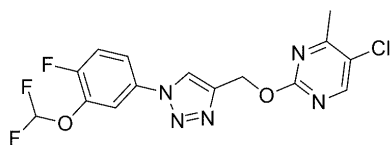
[2203]

[2204]

단계 A에서 (R)-3-플루오로피롤리딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 166과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 424.1; m/z 실측치, 424.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.04 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.7 Hz, 1H), 7.67 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.30 – 6.19 (m, 1H), 5.55 – 5.34 (m, 3H), 3.95 – 3.36 (m, 4H), 2.35 – 2.02 (m, 2H).

[2205]

실시예 513: 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



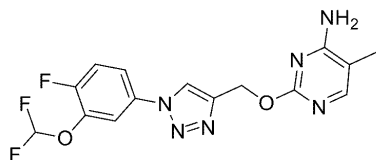
[2206]

[2207]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 385.1; m/z 실측치, 385.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.94 (s, 1H), 8.62 (s, 1H), 8.01 – 7.97 (m, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.72 – 7.64 (m, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.53 (s, 2H).

[2208]

실시예 514: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



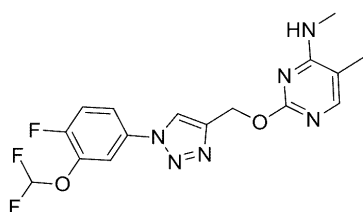
[2209]

[2210]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-메틸 피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 366.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.03 (s, 1H), 7.99 – 7.95 (m, 1H), 7.95 – 7.92 (m, 1H), 7.88 – 7.82 (m, 1H), 7.72 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.7 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 2.02 – 1.97 (m, 3H).

[2211]

실시예 515: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민.



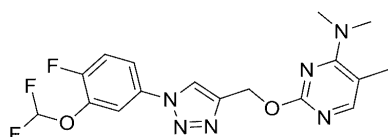
[2212]

[2213]

단계 A에서 tert-부틸 (2-클로로-5-메틸피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 56) 및 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.95 (s, 1H), 7.99 (dd, J = 6.9, 2.7 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.6 Hz, 1H), 7.84 – 7.82 (m, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.7 Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 3.01 (d, J = 4.5 Hz, 3H), 2.00 – 1.97 (m, 3H).

[2214]

실시예 516: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민.



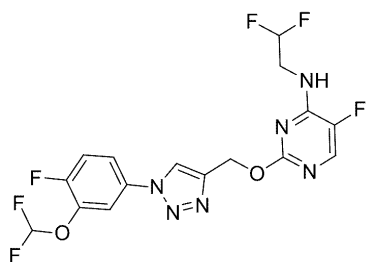
[2215]

[2216]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-N,N,5-트라이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 394.1; m/z 실측치, 395.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.90 (s, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.7 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.84 – 7.82 (m, 1H), 7.67 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 3.07 (s, 6H), 2.22 (d, J = 0.9 Hz, 3H).

[2217]

실시예 517: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 N-(2,2-다이플루오로에틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘-4-아민.



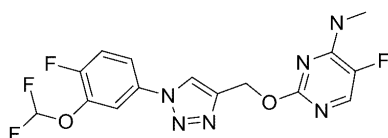
[2218]

[2219]

단계 A에서 tert-부틸 (2-클로로-5-플루오로피리미딘-4-일)(2,2-다이플루오로에틸)카르바메이트 (중간체 57) 및 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_6N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 434.1; m/z 실측치, 435.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.92 (s, 1H), 8.19 – 8.12 (m, 1H), 8.07 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.88 (ddd, J = 9.0, 3.9, 2.6 Hz, 1H), 7.69 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.40 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 6.34 – 6.00 (m, 1H), 5.42 (s, 2H).

[2220]

실시예 518: 트라이플루오로아세트산 염으로서의 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.



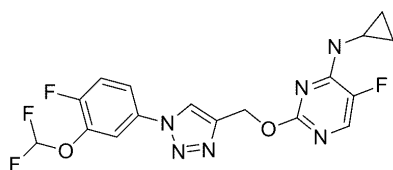
[2221]

[2222]

단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 384.1; m/z 실측치, 385.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.01 – 7.97 (m, 2H), 7.94 – 7.85 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 2.87 (d, J = 4.6 Hz, 3H).

[2223]

실시예 519: N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



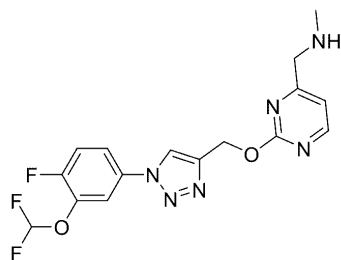
[2224]

[2225]

단계 C에서 4-클로로-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘 및 사이클로프로필아민을 사용하여, 실시예 167과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 410.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.91 (s, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.95 (d, J = 3.5 Hz, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 2H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 5.40 (s, 2H), 2.85 – 2.75 (m, 1H), 0.74 – 0.67 (m, 2H), 0.60 – 0.53 (m, 2H).

[2226]

실시예 520: 1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)-N-메틸메탄아민.



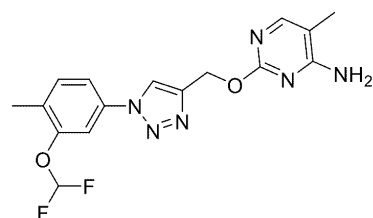
[2227]

[2228]

tert-부틸 메틸((2-(메틸설포닐)피리미딘-4-일)메틸)카르바메이트 (중간체 61) 및 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 6)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.97 (s, 1H), 8.57 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.00 (dd, J = 6.9, 2.6 Hz, 1H), 7.87 (ddd, J = 9.0, 4.0, 2.6 Hz, 1H), 7.68 (dd, J = 10.2, 9.0 Hz, 1H), 7.39 (t, J = 72.8 Hz, 1H), 7.21 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 3.69 (s, 2H), 2.29 (s, 3H).

[2229]

실시예 521: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



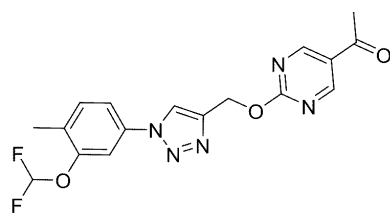
[2230]

[2231]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-클로로-4-아미노-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{16}F_2N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 362.1; m/z 실측치, 363.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.88 (s, 1H), 7.93 - 7.66 (m, 2H), 7.61 - 7.10 (m, 3H), 6.76 (s, 2H), 5.35 (s, 2H), 2.29 (s, 3H), 1.92 (s, 3H).

[2232]

실시예 522: 1-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



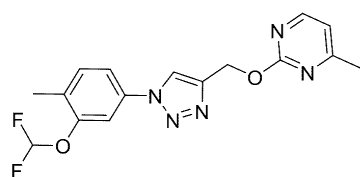
[2233]

[2234]

(1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9.15 (s, 2H), 8.97 (s, 1H), 7.79 - 7.67 (m, 2H), 7.60 - 7.13 (m, 2H), 5.65 (s, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

[2235]

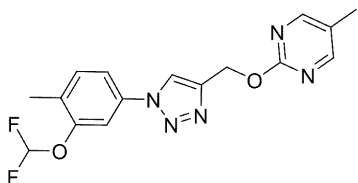
실시예 523: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2236]

[2237] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.92 (s, 1H), 8.49 (d, J = 4.8 Hz, 1H), 7.80 - 7.67 (m, 2H), 7.57 - 7.14 (m, 2H), 7.07 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

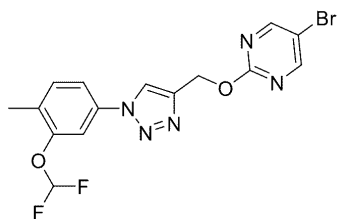
[2238] 실시예 524: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2239]

[2240] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8.93 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 8.50 (d, J = 7.9 Hz, 2H), 7.84 - 7.68 (m, 2H), 7.61 - 7.10 (m, 2H), 5.50 (d, J = 2.5 Hz, 2H), 2.30 (s, 2H), 2.21 (s, 2H).

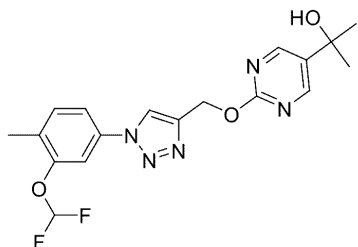
[2241] 실시예 525: 5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2242]

[2243] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-클로로-5-브로모피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}BrF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 411.0; m/z 실측치, 412.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.71 (s, 2H), 8.68 (s, 1H), 7.69 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.65 (dd, J = 8.2, 2.2 Hz, 1H), 7.50 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 6.97 (t, J = 73.6 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 2.37 (s, 3H).

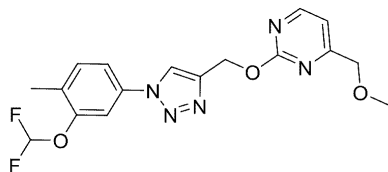
[2244] 실시예 526: 2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2245]

[2246] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 391.1; m/z 실측치, 392.1 $[M+H]^+$.

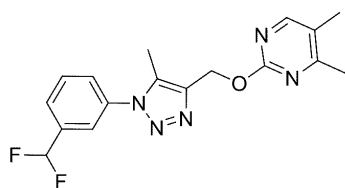
[2247] 실시예 527: 2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[2248]

[2249] (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 52) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.67 (s, 1H), 8.59 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 7.71 – 7.57 (m, 2H), 7.49 (d, J = 8.3 Hz, 1H), 7.23 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 6.98 (t, J = 73.7 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.50 (s, 3H), 2.37 (s, 3H).

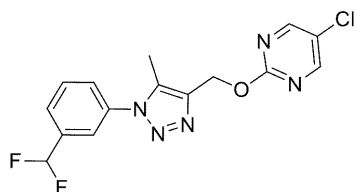
[2250] 실시예 528: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



[2251]

[2252] 단계 D에서 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 172, 단계 A 내지 단계 D와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.71 – 7.56 (m, 4H), 6.73 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.57 (s, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.43 (s, 3H), 2.19 (s, 3H).

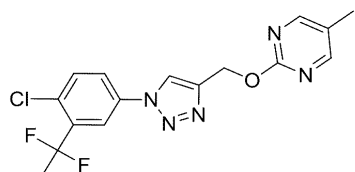
[2253] 실시예 529: 5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2254]

[2255] 단계 D에서 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 172, 단계 A 내지 단계 D와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.50 (s, 2H), 7.72 – 7.54 (m, 4H), 6.73 (t, J = 56.1 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 2.45 (s, 3H).

[2256] 실시예 530: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]-1,2,3-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

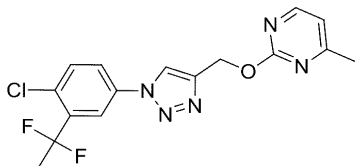


[2257]

[2258] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (d, J = 0.8 Hz, 2H),

8.20 – 8.09 (m, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.84 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.58 (m, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.26 (t, $J = 0.7$ Hz, 3H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

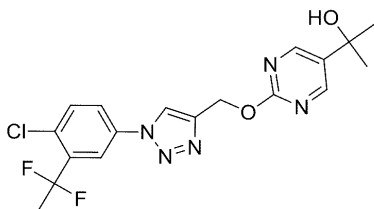
[2259] 실시예 531: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2260]

[2261] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.40 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.85 – 7.74 (m, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 6.92 – 6.80 (m, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.56 – 2.43 (m, 3H), 2.18 – 1.97 (m, 3H).

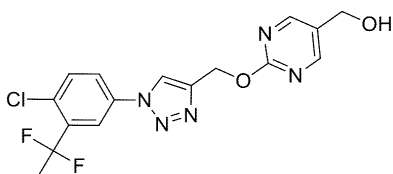
[2262] 실시예 532: 2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2263]

[2264] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 409.1; m/z 실측치, 410.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (d, $J = 1.4$ Hz, 2H), 8.20 – 8.13 (m, 1H), 7.98 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 7.84 – 7.74 (m, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.67 (t, $J = 0.9$ Hz, 2H), 2.20 – 1.99 (m, 3H), 1.70 – 1.59 (m, 6H).

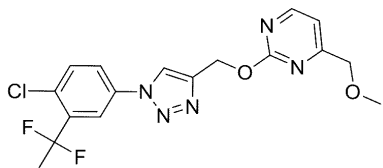
[2265] 실시예 533: [2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



[2266]

[2267] 단계 A에서 (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 5-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 53)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.60 – 8.54 (s, 2H), 8.18 – 8.12 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.00 – 7.94 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.83 – 7.75 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (m, 1H), 5.70 – 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.75 – 4.66 (m, 2H), 2.16 – 2.03 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H), 1.90 – 1.57 (s, 1H).

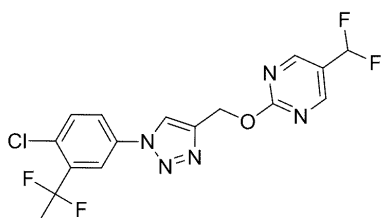
[2268] 실시예 534: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[2269]

[2270] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.18 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.82 – 7.76 (m, 1H), 7.61 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.50 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.50 (s, 3H), 2.29 – 1.90 (m, 3H).

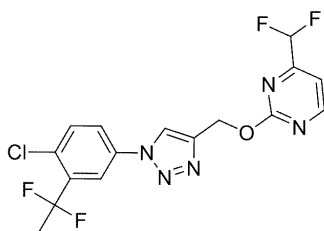
[2271] 실시예 535: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[2272]

[2273] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.75 – 8.68 (m, 2H), 8.16 (s, 1H), 7.97 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.84 – 7.76 (m, 1H), 7.62 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.73 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 5.72 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.09 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

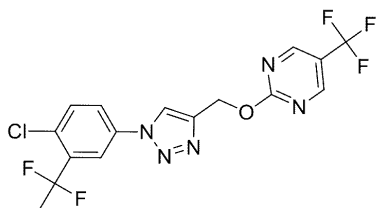
[2274] 실시예 536: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[2275]

[2276] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.07 – 7.93 (m, 1H), 7.87 – 7.74 (m, 1H), 7.62 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 7.31 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.51 (t, J = 54.7 Hz, 1H), 5.71 (s, 2H), 2.20 – 1.99 (m, 3H).

[2277] 실시예 537: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



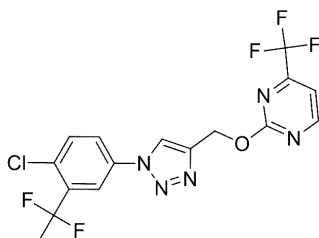
[2278]

[2279]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}ClF_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 419.1; m/z 실측치, 420.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.89 – 8.76 (m, 2H), 8.23 – 8.08 (m, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.85 – 7.75 (m, 1H), 7.70 – 7.57 (m, 1H), 5.74 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

[2280]

실시예 538: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



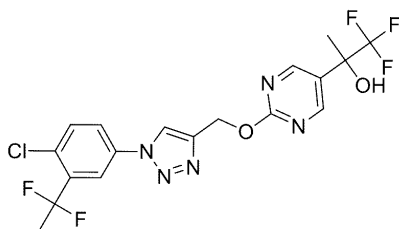
[2281]

[2282]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}ClF_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 419.1; m/z 실측치, 420.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.83 (d, $J = 4.8$ Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.62 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.34 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 5.72 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

[2283]

실시예 539: (R/S)-2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올.

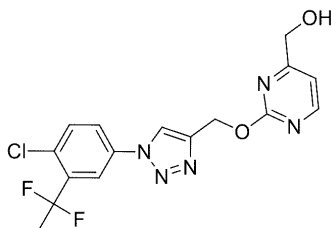


[2284]

[2285]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)-1,1,1-트라이플루오로프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{15}ClF_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 463.1; m/z 실측치, 464.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.77 – 8.71 (s, 2H), 8.20 – 8.13 (s, 1H), 8.01 – 7.95 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.83 – 7.75 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.72 – 5.65 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.16 – 2.03 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H), 1.87 – 1.78 (m, 3H).

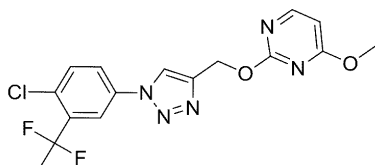
[2286] 실시예 540: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



[2287]

[2288] 단계 A에서 (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 54)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 – 8.48 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.21 – 8.12 (s, 1H), 8.00 – 7.95 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.84 – 7.75 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 7.07 – 6.98 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.73 – 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.80 – 4.68 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.18 – 1.99 (m, 3H).

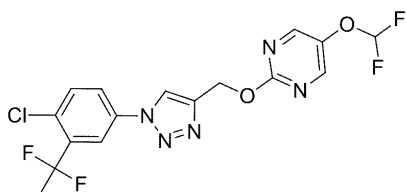
[2289] 실시예 541: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘.



[2290]

[2291] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.23 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.97 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.86 – 7.73 (m, 1H), 7.61 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.43 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.99 (s, 3H), 2.20 – 1.99 (m, 3H).

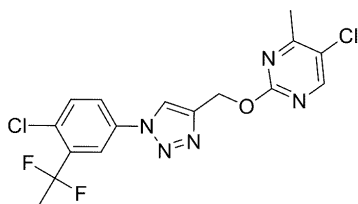
[2292] 실시예 542: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘.



[2293]

[2294] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-다이플루오로메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}ClF_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 417.1; m/z 실측치, 418.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.53 – 8.41 (m, 2H), 8.15 (s, 1H), 7.98 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.80 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.62 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.53 (t, J = 71.9 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.09 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

[2295] 실시예 543: 5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



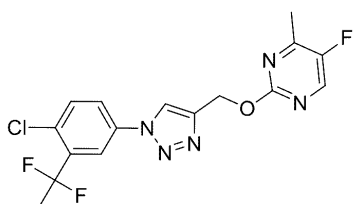
[2296]

[2297]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}Cl_2F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 399.0; m/z 실측치, 400.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.69 – 5.57 (m, 2H), 2.57 (s, 3H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

[2298]

실시예 544: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



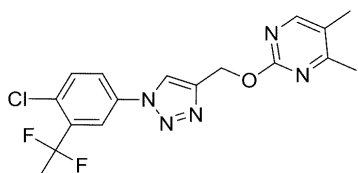
[2299]

[2300]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, $J = 1.2$ Hz, 1H), 8.14 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.86 – 7.75 (m, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.62 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.50 (d, $J = 2.5$ Hz, 3H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

[2301]

실시예 545: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



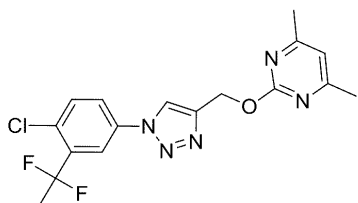
[2302]

[2303]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 (d, $J = 0.9$ Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.79 (dd, $J = 8.6, 2.6$ Hz, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H).

[2304]

실시예 546: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘.



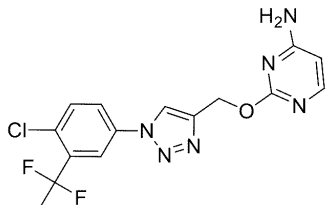
[2305]

[2306]

(1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4,6-

다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.97 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.79 (dd, J = 8.6, 2.6 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 5.65 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.52 – 2.31 (m, 6H), 2.09 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

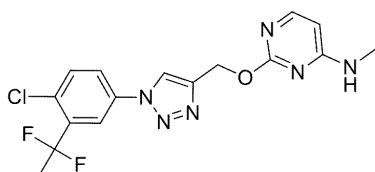
[2307] 실시예 547: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



[2308]

[2309] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 367.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.21 – 8.11 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.11 – 8.02 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 8.00 – 7.95 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.86 – 7.72 (m, 1H), 7.66 – 7.54 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.25 – 6.00 (d, J = 5.7 Hz, 1H), 5.70 – 5.44 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 5.20 – 4.99 (s, 2H), 2.21 – 1.96 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

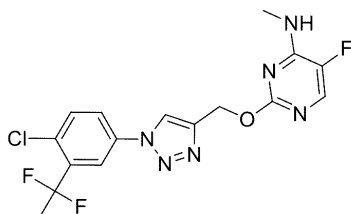
[2310] 실시예 548: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



[2311]

[2312] tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 – 8.16 (s, 1H), 8.07 – 7.96 (m, 2H), 7.82 – 7.76 (m, 1H), 7.64 – 7.57 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.10 – 6.07 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.67 – 5.57 (s, 2H), 5.40 – 5.26 (s, 1H), 3.05 – 2.91 (s, 3H), 2.18 – 2.00 (t, J = 18.5 Hz, 3H).

[2313] 실시예 549: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.

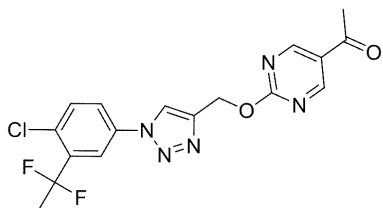


[2314]

[2315] 단계 A에서 (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 398.1; m/z 실측치, 399.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 – 8.11 (s, 1H), 8.01 – 7.94 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.86 – 7.73 (m, 2H), 7.66 – 7.56 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 5.63 – 5.51 (s, 2H),

5.19 – 5.03 (s, 1H), 3.15 – 3.04 (d, $J = 5.0$ Hz, 3H), 2.21 – 1.97 (m, 3H).

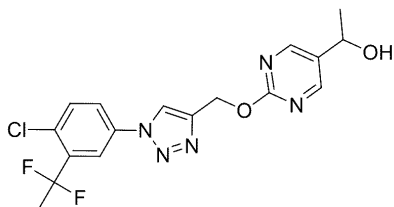
[2316] 실시예 550: 1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[2317]

[2318] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 1-(2-클로로피리미딘-5-일)에탄-1-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 393.1; m/z 실측치, 394.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9.18 – 9.05 (m, 2H), 8.25 – 8.14 (s, 1H), 8.04 – 7.92 (m, 1H), 7.88 – 7.75 (m, 1H), 7.70 – 7.58 (m, 1H), 5.83 – 5.70 (m, 2H), 2.69 – 2.57 (m, 3H), 2.23 – 2.00 (m, 3H).

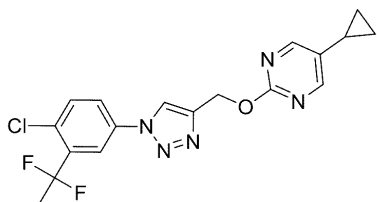
[2319] 실시예 551: (R/S)-1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



[2320]

[2321] 1-(2-((1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-올 (실시예 550)을 사용하여, 실시예 157과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.62 – 8.55 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 8.18 – 8.14 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 8.00 – 7.96 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.83 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.57 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.71 – 5.62 (d, $J = 0.8$ Hz, 2H), 5.03 – 4.92 (q, $J = 6.5$ Hz, 1H), 2.20 – 2.01 (t, $J = 18.4$ Hz, 3H), 1.62 – 1.50 (d, $J = 6.5$ Hz, 3H).

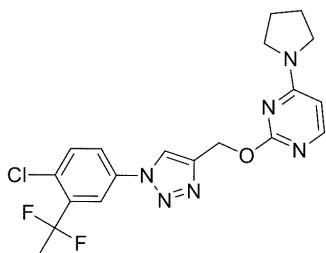
[2322] 실시예 552: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘.



[2323]

[2324] (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 391.1; m/z 실측치, 392.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 (d, $J = 0.5$ Hz, 2H), 8.14 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.97 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.83 – 7.77 (m, 1H), 7.61 (d, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.09 (t, $J = 18.5$ Hz, 3H), 1.88 – 1.78 (m, 1H), 1.07 – 0.98 (m, 2H), 0.74 – 0.67 (m, 2H).

[2325] 실시예 553: 2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



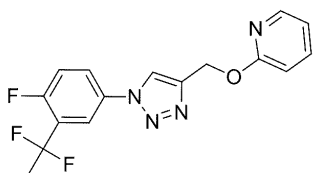
[2326]

[2327]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 63) 및 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{19}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 420.1; m/z 실측치, 421.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 – 8.11 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.02 – 7.98 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.98 – 7.96 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.82 – 7.74 (dd, J = 8.6, 2.7 Hz, 1H), 7.64 – 7.55 (d, J = 8.6 Hz, 1H), 6.03 – 5.97 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 5.63 – 5.57 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.72 – 3.53 (m, 2H), 3.43 – 3.26 (m, 2H), 2.17 – 1.92 (m, 7H).

[2328]

실시예 554: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리딘.



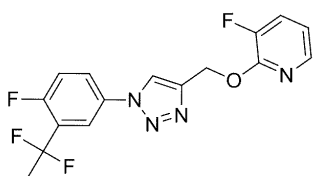
[2329]

[2330]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 334.1; m/z 실측치, 335.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.29 – 8.12 (m, 1H), 8.13 – 7.99 (m, 1H), 7.96 – 7.80 (m, 2H), 7.68 – 7.53 (m, 1H), 7.42 – 7.22 (m, 1H), 7.05 – 6.70 (m, 2H), 5.72 – 5.50 (m, 2H), 2.23 – 1.82 (m, 3H).

[2331]

실시예 555: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘.



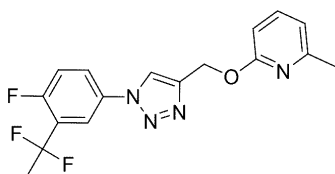
[2332]

[2333]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-3-플루오로피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_4N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.11 (s, 1H), 8.02 – 7.96 (m, 1H), 7.95 – 7.87 (m, 1H), 7.88 – 7.81 (m, 1H), 7.43 – 7.26 (m, 2H), 6.98 – 6.87 (m, 1H), 5.68 (d, J = 2.0 Hz, 2H), 2.05 (t, J = 18.4, 1.6 Hz, 3H).

[2334]

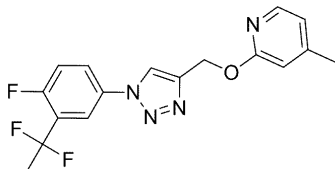
실시예 556: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘.



[2335]

[2336] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-6-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 – 8.03 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.54 – 7.41 (m, 1H), 7.36 – 7.26 (m, 1H), 6.81 – 6.73 (m, 1H), 6.64 – 6.51 (m, 1H), 5.59 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.48 (t, J = 0.6 Hz, 3H), 2.05 (td, J = 18.6, 1.2 Hz, 3H).

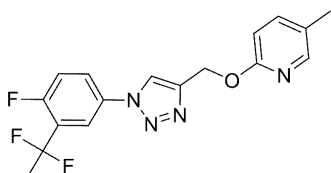
[2337] 실시예 557: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘.



[2338]

[2339] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 – 8.01 (m, 1H), 7.97 – 7.76 (m, 2H), 7.39 – 7.22 (m, 2H), 6.83 – 6.58 (m, 2H), 5.68 – 5.49 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.20 – 1.90 (m, 3H).

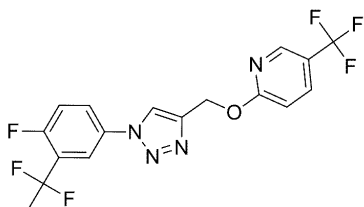
[2340] 실시예 558: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘.



[2341]

[2342] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.13 – 8.04 (m, 1H), 8.05 – 7.96 (m, 1H), 7.96 – 7.75 (m, 2H), 7.49 – 7.35 (m, 1H), 7.36 – 7.21 (m, 1H), 6.81 – 6.63 (m, 1H), 5.57 (d, J = 4.0 Hz, 2H), 2.27 (d, J = 3.6 Hz, 3H), 2.05 (t, 3H).

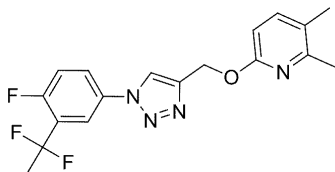
[2343] 실시예 559: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘.



[2344]

[2345] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_6N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 402.1; m/z 실측치, 403.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.60 – 8.39 (m, 1H), 8.23 – 8.02 (m, 1H), 8.01 – 7.74 (m, 2H), 7.43 – 7.22 (m, 2H), 7.03 – 6.84 (m, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.05 (t, J = 18.4 Hz, 3H).

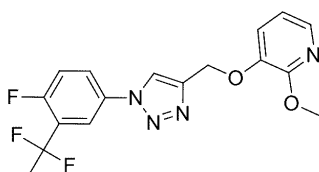
[2346] 실시예 560: 6-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-2,3-다이메틸-피리딘.



[2347]

[2348] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5,6-다이메틸피리딘을 사용하여, 실시예 158과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 362.1; m/z 실측치, 363.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.06 (s, 1H), 7.98 – 7.76 (m, 2H), 7.42 – 7.26 (m, 2H), 6.64 – 6.51 (m, 1H), 5.57 (d, J = 2.5 Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.03 (t, 3H).

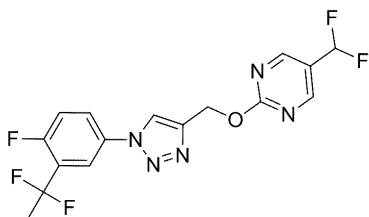
[2349] 실시예 561: 3-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘.



[2350]

[2351] 4-(클로로메틸)-1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸 (중간체 20, 단계 A로부터의 생성물) 및 2-메톡시피리딘-3-올 (24 mg, 0.189 mmol)을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하고, 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_4O_2$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.09 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.86 – 7.80 (m, 1H), 7.81 – 7.77 (m, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 2H), 6.91 – 6.78 (m, 1H), 5.46 – 5.28 (m, 2H), 4.03 (s, 3H), 2.05 (t, J = 18.6, 1.2 Hz, 3H).

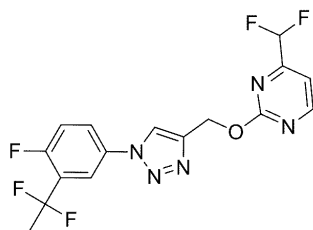
[2352] 실시예 562: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘.



[2353]

[2354] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 385.1; m/z 실측치, 386.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 – 8.67 (m, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.94 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.81 (m, 1H), 7.32 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.73 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 5.78 – 5.68 (m, 2H), 2.12 – 1.96 (m, 3H).

[2355] 실시예 563: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘.



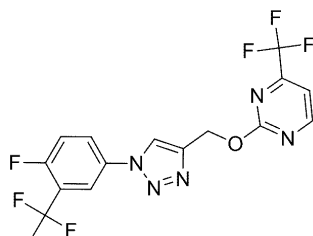
[2356]

[2357]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-(다이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 385.1; m/z 실측치, 386.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.16 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.79 (m, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 2H), 6.50 (t, $J = 54.7$ Hz, 1H), 5.70 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.05 (td, $J = 18.6, 1.1$ Hz, 3H).

[2358]

실시예 564: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



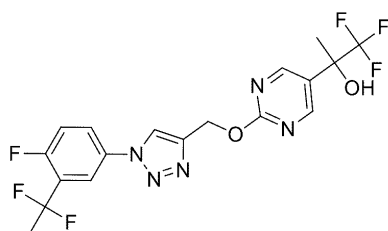
[2359]

[2360]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-3-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_6N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 403.1; m/z 실측치, 404.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.83 (d, $J = 4.8$ Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.95 – 7.86 (m, 1H), 7.87 – 7.78 (m, 1H), 7.38 – 7.28 (m, 2H), 5.78 – 5.66 (m, 2H), 2.05 (t, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

[2361]

실시예 565: (R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올.



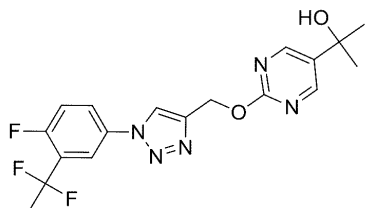
[2362]

[2363]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)-1,1,1-트라이플루오로프로판-2-올을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{15}F_6N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 447.1; m/z 실측치, 448.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.79 – 8.70 (s, 2H), 8.17 – 8.08 (t, $J = 0.7$ Hz, 1H), 7.94 – 7.88 (m, 1H), 7.88 – 7.78 (m, 1H), 7.35 – 7.27 (m, 1H), 5.74 – 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.77 – 2.56 (s, 1H), 2.11 – 1.99 (m, 3H), 1.86 – 1.79 (m, 3H).

[2364]

실시예 566: 2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



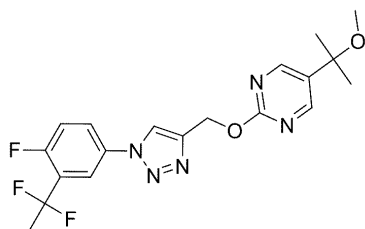
[2365]

[2366]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 393.1; m/z 실측치, 394.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.68 (s, 2H), 8.13 (s, 1H), 7.95 – 7.79 (m, 2H), 7.37 – 7.27 (m, 1H), 5.67 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.15 – 1.97 (m, 3H), 1.63 (s, 6H).

[2367]

실시예 567: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘.



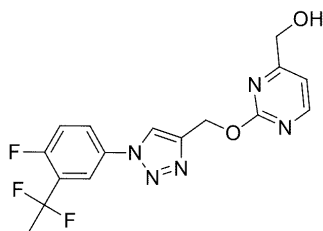
[2368]

[2369]

2-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)프로판-2-올 (실시예 566)을 사용하여, 실시예 311과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{20}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 407.2; m/z 실측치, 408.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.62 – 8.56 (s, 2H), 8.16 – 8.09 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.80 (m, 1H), 7.35 – 7.28 (m, 1H), 5.72 – 5.63 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.18 – 3.09 (s, 3H), 2.14 – 1.97 (m, 3H), 1.56 – 1.55 (s, 6H).

[2370]

실시예 568: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



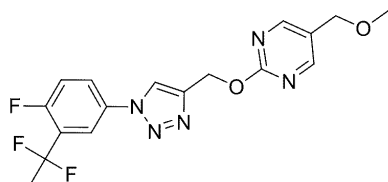
[2371]

[2372]

단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 4-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 54)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.60 – 8.43 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.19 – 8.11 (s, 1H), 7.95 – 7.87 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.87 – 7.76 (m, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 1H), 7.07 – 6.94 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 5.74 – 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.84 – 4.67 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.15 – 1.92 (m, 3H).

[2373]

실시예 569: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘.



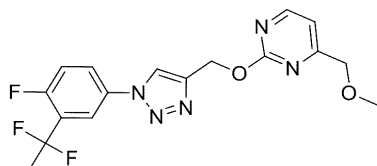
[2374]

[2375]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.56 – 8.52 (s, 2H), 8.14 – 8.09 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.78 (m, 1H), 7.35 – 7.27 (m, 1H), 5.70 – 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.45 – 4.37 (s, 2H), 3.45 – 3.39 (s, 3H), 2.12 – 1.97 (m, 3H).

[2376]

실시예 570: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



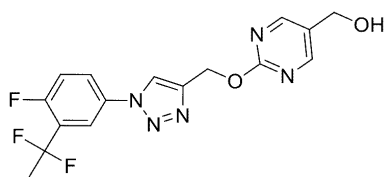
[2377]

[2378]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.15 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.80 (m, 1H), 7.31 (t, J = 10.0, 8.8 Hz, 1H), 7.16 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.50 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.50 (s, 3H), 2.05 (t, J = 18.6, 1.2 Hz, 3H).

[2379]

실시예 571: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



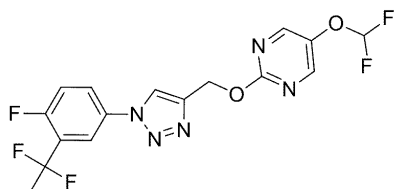
[2380]

[2381]

단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 5-(((tert-부틸다이메틸실릴)옥시)메틸)-2-클로로피리미딘 (중간체 53)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.61 – 8.56 (s, 2H), 8.15 – 8.10 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.93 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.81 (m, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 1H), 5.70 – 5.65 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.75 – 4.67 (m, 2H), 2.16 – 1.95 (m, 3H).

[2382]

실시예 572: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘.



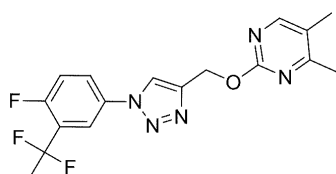
[2383]

[2384]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.45 (s, 2H), 8.12 (s, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.87 – 7.80 (m, 1H), 7.31 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 6.53 (t, J = 71.9 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.05 (t, J = 18.6, 1.2 Hz, 3H).

[2385]

실시예 573: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



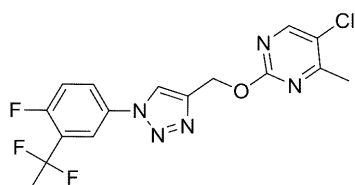
[2386]

[2387]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.20 (d, J = 1.0 Hz, 1H), 8.12 (d, J = 0.7 Hz, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.80 (m, 1H), 7.30 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.73 – 5.55 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.20 (s, 3H), 2.05 (td, J = 18.5, 1.2 Hz, 3H).

[2388]

실시예 574: 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



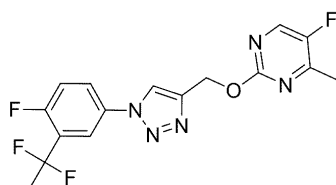
[2389]

[2390]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 1H), 8.15 – 8.07 (m, 1H), 7.89 (dd, J = 6.2, 2.7 Hz, 1H), 7.87 – 7.80 (m, 1H), 7.31 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.73 – 5.56 (m, 2H), 2.68 – 2.52 (m, 3H), 2.15 – 1.91 (m, 3H).

[2391]

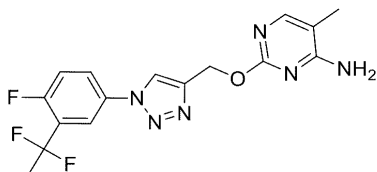
실시예 575: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[2392]

[2393] (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.11 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.31 (t, J = 9.4 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.49 (d, J = 2.5 Hz, 3H), 2.05 (td, J = 18.7, 1.2 Hz, 3H).

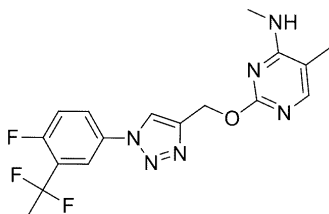
[2394] 실시예 576: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



[2395]

[2396] DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 – 8.05 (m, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.80 (m, 1H), 7.37 – 7.27 (m, 2H), 5.56 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 4.98 – 4.81 (m, 2H), 2.15 – 1.94 (m, 6H).

[2397] 실시예 577: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민.

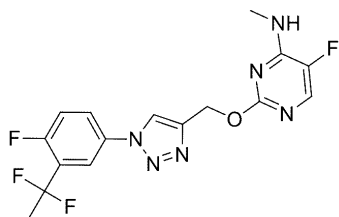


[2398]

[2399] 단계 A: tert-부틸 (2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트. DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 tert-부틸 (2-클로로-5-메틸피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트를 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{22}H_{25}F_3N_6O_5$ 에 대한 질량 계산치, 478.2; m/z 실측치, 479.1 $[M+H]^+$.

[2400] 단계 B: tert-부틸 (2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트. DCM (3mL) 중의 tert-부틸 (2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트를 포함하는 바이알에 TFA (0.5mL)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 하룻밤 동안 교반하였다. 완료된 반응물을 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO_2 , DCM 중 MeOH 중의 0 내지 3% 2M NH_3 로 용리)에 의해, 2단계 공정으로 표제 화합물 (17.9 mg, 41%)을 얻었다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 378.1; m/z 실측치, 379.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.14 – 8.08 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.85 – 7.79 (m, 1H), 7.79 – 7.76 (d, J = 1.1 Hz, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 1H), 5.64 – 5.56 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.75 – 4.59 (s, 1H), 3.13 – 3.03 (d, J = 4.8 Hz, 3H), 2.10 – 1.99 (m, 3H), 1.99 – 1.95 (d, J = 1.0 Hz, 3H).

[2401] 실시예 578: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민.



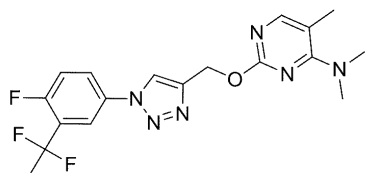
[2402]

[2403]

단계 A에서 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-플루오로-N-메틸-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 59)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 382.1; m/z 실측치, 383.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $CDCl_3$) δ 8.14 – 8.07 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.95 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 2H), 7.36 – 7.22 (m, 1H), 5.61 – 5.52 (d, J = 2.4 Hz, 2H), 5.22 – 5.08 (s, 1H), 3.16 – 3.02 (m, 3H), 2.17 – 1.90 (m, 3H).

[2404]

실시예 579: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민.



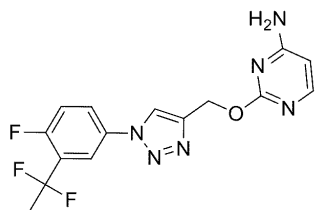
[2405]

[2406]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-N,N,5-트라이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{19}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 392.2; m/z 실측치, 393.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $CDCl_3$) δ 8.10 (s, 1H), 7.92 – 7.87 (m, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 2H), 7.33 – 7.27 (m, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.13 (s, 6H), 2.25 (s, 3H), 2.13 – 1.96 (m, 3H).

[2407]

실시예 580: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민.



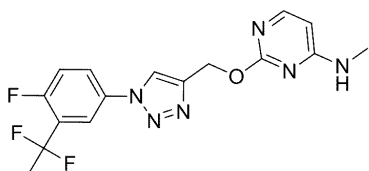
[2408]

[2409]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 351.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 Mhz, $CDCl_3$) δ 8.26 – 7.99 (m, 2H), 7.99 – 7.68 (m, 2H), 7.49 – 7.03 (m, 1H), 6.36 – 5.98 (m, 1H), 5.75 – 5.49 (d, J = 3.0 Hz, 2H), 5.20 – 4.89 (s, 2H), 2.28 – 1.91 (m, 3H).

[2410]

실시예 581: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민.



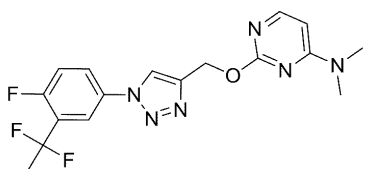
[2411]

[2412]

tert-부틸 (2-클로로피리미딘-4-일)(메틸)카르바메이트 (중간체 55) 및 (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11)을 사용하여, 실시예 163, 단계 B 및 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 – 8.05 (s, 1H), 8.09 – 7.95 (s, 1H), 7.96 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.76 (m, 1H), 7.38 – 7.27 (m, 1H), 6.15 – 5.98 (d, $J = 5.7$ Hz, 1H), 5.71 – 5.51 (s, 2H), 5.27 – 4.95 (s, 1H), 3.05 – 2.86 (d, $J = 4.8$ Hz, 3H), 2.12 – 1.93 (m, 3H).

[2413]

실시예 582: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



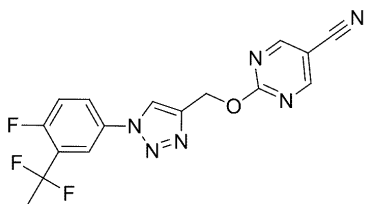
[2414]

[2415]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 378.1; m/z 실측치, 379.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 – 8.08 (t, $J = 0.8$ Hz, 1H), 8.07 – 7.98 (d, $J = 6.0$ Hz, 1H), 7.94 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.34 – 7.26 (m, 1H), 6.18 – 6.08 (d, $J = 6.1$ Hz, 1H), 5.66 – 5.54 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.22 – 3.03 (s, 6H), 2.15 – 1.95 (m, 3H).

[2416]

실시예 583: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-카르보니트릴.



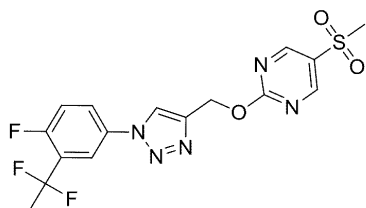
[2417]

[2418]

DMF 대신에 ACN을 사용하고, 140°C에서 90분 동안 마이크로파 가열을 이용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-시아노피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1; m/z 실측치, 361.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.85 (s, 2H), 8.16 – 8.09 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.81 (m, 1H), 7.38 – 7.29 (m, 1H), 5.74 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.17 – 1.91 (m, 3H).

[2419]

실시예 584: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸설폰닐-피리미딘.



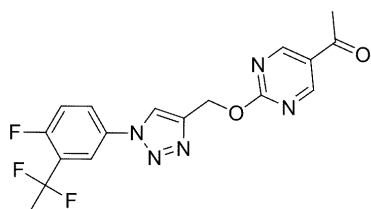
[2420]

[2421]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-(메틸설포닐)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₆H₁₄F₃N₅O₃S에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.05 (s, 2H), 8.21 – 8.05 (m, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.87 – 7.81 (m, 1H), 7.33 (t, J = 9.3 Hz, 1H), 5.84 – 5.68 (m, 2H), 3.15 (s, 3H), 2.18 – 1.92 (m, 3H).

[2422]

실시예 585: 1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



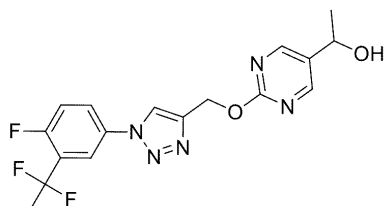
[2423]

[2424]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 1-(2-클로로 피리미딘-5-일)에탄-1-온을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₇H₁₄F₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 9.15 – 9.06 (s, 2H), 8.19 – 8.10 (s, 1H), 7.94 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.80 (m, 1H), 7.38 – 7.28 (m, 1H), 5.81 – 5.71 (m, 2H), 2.65 – 2.55 (s, 3H), 2.16 – 1.94 (m, 3H).

[2425]

실시예 586: (R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올.



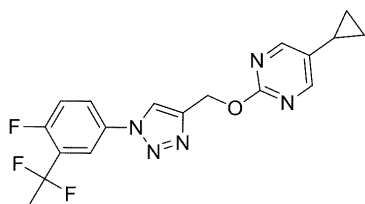
[2426]

[2427]

1-(2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 (실시예 585)을 사용하여, 실시예 157과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): C₁₇H₁₆F₃N₅O₂에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 [M+H]⁺. ¹H NMR (400 MHz, CDCl₃) δ 8.61 – 8.52 (s, 2H), 8.17 – 8.10 (s, 1H), 7.93 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 1H), 7.35 – 7.28 (m, 1H), 5.69 – 5.60 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 5.03 – 4.92 (m, 1H), 2.12 – 1.97 (m, 3H), 1.61 – 1.50 (d, J = 6.5 Hz, 3H).

[2428]

실시예 587: 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



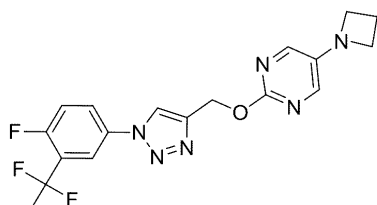
[2429]

[2430]

(1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.34 – 8.29 (m, 2H), 8.13 – 8.08 (m, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 1H), 5.63 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.16 – 1.94 (m, 3H), 1.91 – 1.74 (m, 1H), 1.09 – 0.97 (m, 2H), 0.78 – 0.63 (m, 2H).

[2431]

실시예 588: 5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



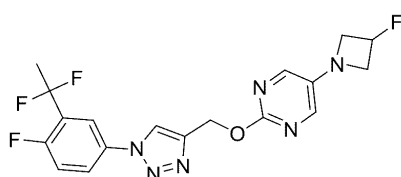
[2432]

[2433]

5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘 (실시예 183) 및 아제티딘을 사용하여, 실시예 165, 단계 A와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 390.1; m/z 실측치, 391.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.12 – 8.07 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.87 – 7.78 (s, 3H), 7.35 – 7.27 (m, 1H), 5.62 – 5.54 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 3.98 – 3.86 (t, J = 7.2 Hz, 4H), 2.53 – 2.39 (m, 2H), 2.16 – 1.97 (m, 3H).

[2434]

실시예 589: 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘.



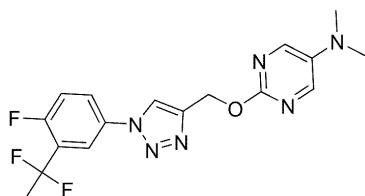
[2435]

[2436]

3-플루오로아제티딘 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_4N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 408.3; m/z 실측치, 409.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.05 – 8.02 (s, 1H), 7.84 – 7.80 (m, 1H), 7.80 – 7.79 (s, 2H), 7.78 – 7.73 (m, 1H), 7.26 – 7.20 (m, 1H), 5.54 – 5.49 (s, 2H), 5.49 – 5.28 (m, 1H), 4.23 – 4.11 (m, 2H), 3.98 – 3.86 (m, 2H), 2.05 – 1.91 (m, 3H).

[2437]

실시예 590: 2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N,N-다이메틸피리미딘-5-아민.



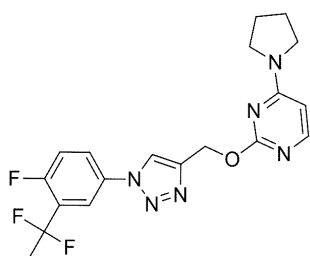
[2438]

[2439]

다이메틸아민 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 187과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 378.3; m/z 실측치, 379.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.05 – 8.03 (m, 1H), 8.03 – 8.01 (s, 2H), 7.84 – 7.80 (dd, J = 6.3, 2.7 Hz, 1H), 7.78 – 7.73 (m, 1H), 7.26 – 7.20 (m, 1H), 5.53 – 5.50 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.89 – 2.83 (s, 6H), 2.05 – 1.90 (m, 3H).

[2440]

실시예 591: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



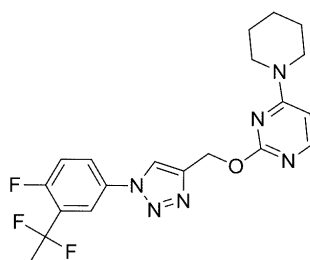
[2441]

[2442]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{19}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 404.2; m/z 실측치, 405.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.12 – 8.08 (t, J = 0.8 Hz, 1H), 8.02 – 7.96 (m, 1H), 7.91 – 7.86 (m, 1H), 7.84 – 7.79 (m, 1H), 7.33 – 7.27 (m, 1H), 6.04 – 5.96 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.65 – 5.57 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.80 – 3.22 (d, J = 110.6 Hz, 4H), 2.13 – 1.94 (m, 7H).

[2443]

실시예 592: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딘)피리미딘.



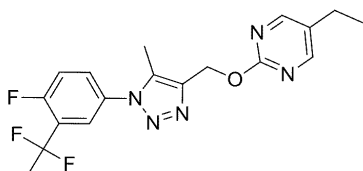
[2444]

[2445]

DMF 대신에 ACN을 사용하여, (1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 11) 및 2-클로로-4-(피페리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 153과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{20}H_{21}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 418.2; m/z 실측치, 419.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 – 8.07 (s, 1H), 8.07 – 7.97 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.95 – 7.86 (m, 1H), 7.86 – 7.78 (m, 1H), 7.34 – 7.27 (m, 1H), 6.22 – 6.15 (d, J = 6.2 Hz, 1H), 5.61 – 5.54 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.73 – 3.53 (s, 4H), 2.13 – 1.98 (m, 3H), 1.75 – 1.65 (m, 2H), 1.65 – 1.56 (m, 4H).

[2446]

실시예 593: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-4-(1-피페리딘)피리미딘.



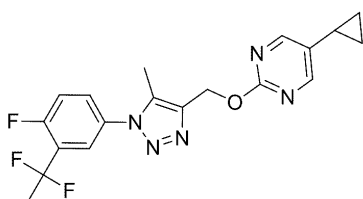
[2447]

[2448]

단계 F에서 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 173, 단계 A 내지 단계 F와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 2H), 7.66 (dd, $J = 6.3, 2.6$ Hz, 1H), 7.57 – 7.51 (m, 1H), 7.32 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 5.57 (s, 2H), 2.60 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.04 (td, $J = 18.6, 1.1$ Hz, 3H), 1.25 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

[2449]

실시예 594: 5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



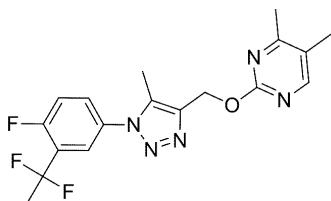
[2450]

[2451]

단계 F에서 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 173, 단계 A 내지 단계 F와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{18}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 389.1; m/z 실측치, 390.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.30 (s, 2H), 7.66 (dd, $J = 6.3, 2.6$ Hz, 1H), 7.55 – 7.51 (m, 1H), 7.34 – 7.29 (m, 1H), 5.56 (s, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.04 (td, $J = 18.6, 1.1$ Hz, 3H), 1.82 (tt, $J = 8.5, 5.1$ Hz, 1H), 1.04 – 0.97 (m, 2H), 0.73 – 0.63 (m, 2H).

[2452]

실시예 595: 2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘.



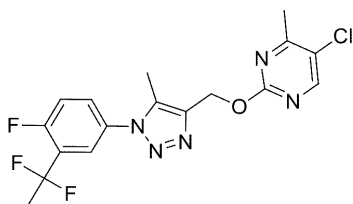
[2453]

[2454]

단계 F에서 2-클로로-4,5-다이메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 173, 단계 A 내지 단계 F와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.19 (s, 1H), 7.66 (dd, $J = 6.4, 2.6$ Hz, 1H), 7.53 (ddd, $J = 8.6, 4.1, 2.8$ Hz, 1H), 7.35 – 7.29 (m, 1H), 5.56 (s, 2H), 2.45 – 2.40 (m, 6H), 2.19 (s, 3H), 2.04 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

[2455]

실시예 596: 5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



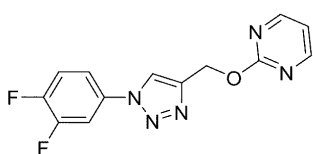
[2456]

[2457]

단계 F에서 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 173, 단계 A 내지 단계 F와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실험치 398.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.37 (s, 1H), 7.66 (dd, $J = 6.3, 2.6$ Hz, 1H), 7.53 (ddd, $J = 8.6, 4.1, 2.7$ Hz, 1H), 7.33 (t, $J = 9.3$ Hz, 1H), 5.56 (s, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.04 (td, $J = 18.6, 1.2$ Hz, 3H).

[2458]

실시예 597: 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



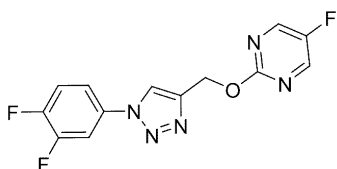
[2459]

[2460]

(1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 289.1; m/z 실험치, 290.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.94 (d, $J = 0.6$ Hz, 1H), 8.66 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 8.13 (ddd, $J = 11.4, 7.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.83 (dddd, $J = 9.0, 4.1, 2.6, 1.6$ Hz, 1H), 7.71 (dt, $J = 10.4, 8.8$ Hz, 1H), 7.20 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.53 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H).

[2461]

실시예 598: 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



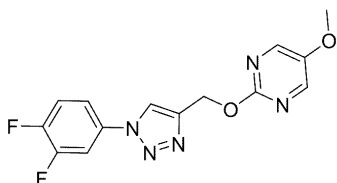
[2462]

[2463]

(1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 307.1; m/z 실험치, 308.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.93 (s, 1H), 8.75 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 8.13 (ddd, $J = 11.5, 7.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.83 (dt, $J = 8.3, 2.9$ Hz, 1H), 7.71 (dt, $J = 10.4, 8.8$ Hz, 1H), 5.52 (s, 2H).

[2464]

실시예 599: 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘.



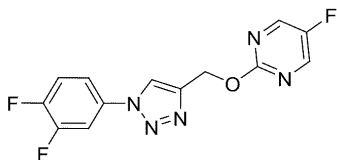
[2465]

[2466]

(1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치,

319.1; m/z 실측치, 320.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.92 (s, 1H), 8.41 (s, 2H), 8.13 (ddd, J = 11.4, 7.0, 2.6 Hz, 1H), 7.83 (dddd, J = 9.0, 4.1, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.71 (dt, J = 10.4, 8.8 Hz, 1H), 5.47 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 3.86 (s, 3H).

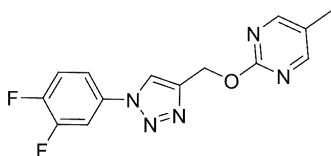
[2467] 실시예 600: 5-클로로-2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2468]

[2469] (1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 323.0; m/z 실측치, 324.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.93 (s, 1H), 8.77 (s, 2H), 8.13 (ddd, J = 11.5, 7.0, 2.7 Hz, 1H), 7.83 (dt, J = 8.1, 2.6, 1.5 Hz, 1H), 7.71 (dt, J = 10.4, 8.8 Hz, 1H), 5.54 (d, J = 0.5 Hz, 2H).

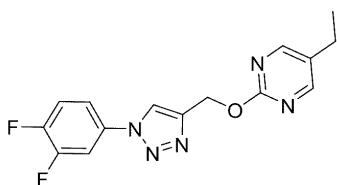
[2470] 실시예 601: 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2471]

[2472] (1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.93 (d, J = 0.6 Hz, 1H), 8.49 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 8.13 (ddd, J = 11.5, 7.0, 2.7 Hz, 1H), 7.83 (dddd, J = 9.1, 4.1, 2.6, 1.6 Hz, 1H), 7.71 (dt, J = 10.3, 8.8 Hz, 1H), 5.49 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 2.21 (d, J = 0.8 Hz, 3H).

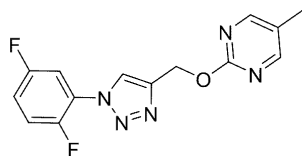
[2473] 실시예 602: 2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[2474]

[2475] (1-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 39) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.93 (s, 1H), 8.52 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 8.13 (ddd, J = 11.5, 7.1, 2.7 Hz, 1H), 7.87 - 7.80 (m, 1H), 7.71 (dt, J = 10.4, 8.8 Hz, 1H), 5.50 (d, J = 0.6 Hz, 2H), 2.62 - 2.54 (m, 2H), 1.19 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

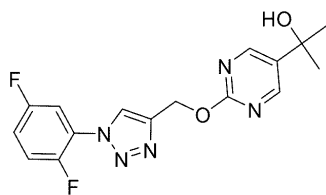
[2476] 실시예 603: 2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2477]

[2478] (1-(2,5-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 47) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.73 (s, 1H), 8.49 (d, $J = 1.0$ Hz, 2H), 7.85 (s, 1H), 7.66 (td, $J = 9.9, 4.9$ Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.21 (d, $J = 0.9$ Hz, 3H).

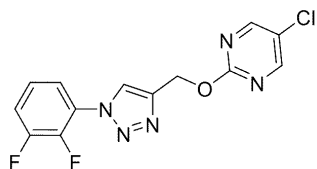
[2479] 실시예 604: 2-[2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2480]

[2481] (1-(2,5-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 47) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.73 (s, 1H), 8.69 (d, $J = 1.1$ Hz, 1H), 7.92 - 7.81 (m, 1H), 7.66 (td, $J = 9.7, 4.6$ Hz, 1H), 7.52 (d, $J = 8.5$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 5.32 (s, 1H), 1.47 (s, 6H).

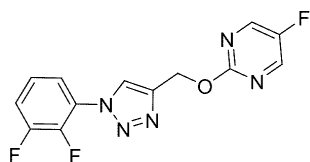
[2482] 실시예 605: 5-클로로-2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2483]

[2484] (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 48) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 323.0; m/z 실측치, 324.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.86 - 8.66 (m, 2H), 7.71 (s, 2H), 7.48 (s, 1H), 5.56 (d, $J = 1.5$ Hz, 2H).

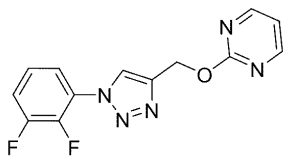
[2485] 실시예 606: 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.



[2486]

[2487] (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 48) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 307.1; m/z 실측치, 308.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.83 - 8.70 (m, 3H), 7.69 (dddd, $J = 11.8, 8.9, 5.5, 1.6$ Hz, 2H), 7.54 - 7.42 (m, 1H), 5.54 (s, 2H).

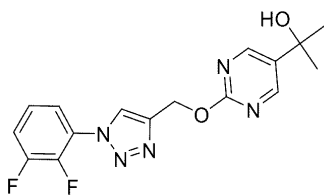
[2488] 실시예 607: 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2489]

[2490] (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 48) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 289.1; m/z 실측치, 290.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.77 (d, $J = 2.0$ Hz, 1H), 8.66 (d, $J = 4.8$ Hz, 2H), 7.76 - 7.64 (m, 2H), 7.53 - 7.43 (m, 1H), 7.20 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.55 (s, 2H).

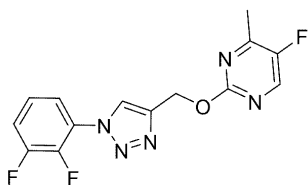
[2491] 실시예 608: 2-[2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2492]

[2493] (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 48) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.70 (s, 2H), 8.58 (d, $J = 2.4$ Hz, 1H), 7.68 (ddt, $J = 8.1, 6.3, 1.8$ Hz, 1H), 7.49 (dddd, $J = 10.1, 8.8, 7.3, 1.7$ Hz, 1H), 7.40 (tdd, $J = 8.4, 5.2, 2.0$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 2.5$ Hz, 2H), 1.56 (d, $J = 2.7$ Hz, 6H).

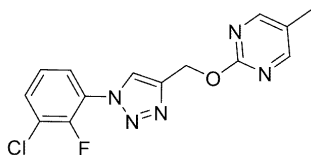
[2494] 실시예 609: 2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[2495]

[2496] (1-(2,3-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 48) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 321.1; m/z 실측치, 322.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.92 - 8.50 (m, 2H), 7.79 - 7.63 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 5.49 (d, $J = 12.0$ Hz, 2H), 2.37 (s, 3H).

[2497] 실시예 610: 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.

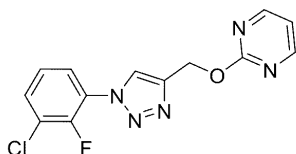


[2498]

[2499] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.55 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 8.45 (t, $J = 0.8$ Hz, 2H), 7.81 (ddd, $J = 8.2, 6.6, 1.6$ Hz, 1H), 7.69 (ddd, $J = 8.3, 6.8, 1.6$ Hz, 1H), 7.40 (td, $J =$

8.2, 1.6 Hz, 1H), 5.60 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.27 (t, $J = 0.8$ Hz, 3H).

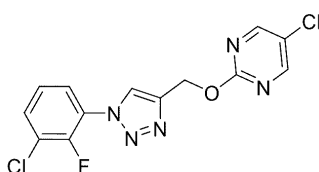
[2500] 실시예 611: 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2501]

[2502] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 305.0; m/z 실측치, 306.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.78 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 8.67 (dd, $J = 4.8, 1.6$ Hz, 2H), 7.92 - 7.79 (m, 2H), 7.57 - 7.43 (m, 1H), 7.28 - 7.15 (m, 1H), 5.55 (d, $J = 1.5$ Hz, 2H).

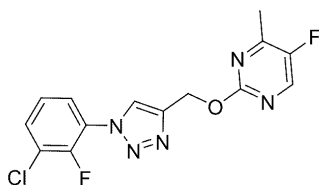
[2503] 실시예 612: 5-클로로-2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2504]

[2505] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8Cl_2FN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 339.0; m/z 실측치, 341.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.78 (d, $J = 5.8$ Hz, 2H), 7.84 (q, $J = 8.0, 7.6$ Hz, 3H), 7.58 - 7.40 (m, 1H), 5.56 (s, 2H).

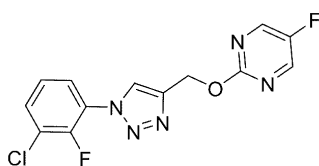
[2506] 실시예 613: 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[2507]

[2508] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.76 (d, $J = 2.2$ Hz, 1H), 8.57 (d, $J = 1.6$ Hz, 1H), 7.84 (dt, $J = 7.9, 6.4$ Hz, 2H), 7.53 - 7.45 (m, 1H), 5.51 (s, 2H), 2.44 (d, $J = 2.6$ Hz, 3H).

[2509] 실시예 614: 2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘.

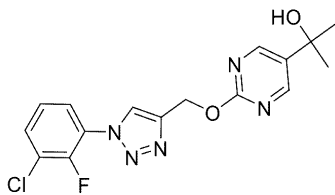


[2510]

[2511] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2-클로로-5-플루오로피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_8ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 323.0; m/z 실측치, 324.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.57 (d, $J = 4.1$ Hz, 3H), 7.81 (ddd, J

= 8.2, 6.6, 1.7 Hz, 1H), 7.69 (ddd, $J = 8.4, 6.7, 1.6$ Hz, 1H), 7.41 (td, $J = 8.2, 1.7$ Hz, 1H), 5.61 (s, 2H).

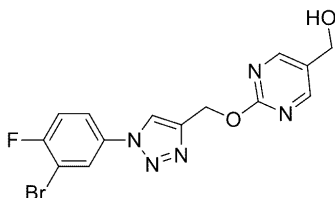
[2512] 실시예 615: 2-[2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2513]

[2514] (1-(3-클로로-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 46) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8.77 (d, $J = 2.1$ Hz, 1H), 8.69 (s, 2H), 7.84 (dddd, $J = 11.7, 8.3, 6.8, 1.6$ Hz, 2H), 7.48 (td, $J = 8.2, 1.5$ Hz, 1H), 5.53 (s, 2H), 5.32 (s, 1H), 1.46 (s, 6H).

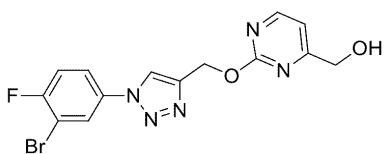
[2515] 실시예 616: [2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



[2516]

[2517] 단계 A에서 (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14)을 사용하여, 실시예 160, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}BrFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.0; m/z 실측치, 380.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (s, 2H), 8.09 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.8, 2.6$ Hz, 1H), 7.66 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.29 – 7.25 (m, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.69 (s, 2H).

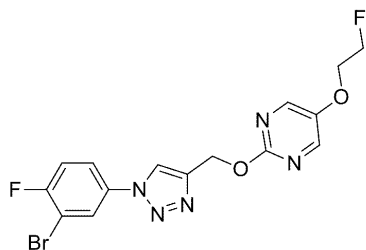
[2518] 실시예 617: [2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.



[2519]

[2520] 단계 A에서 (1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}BrFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 379.0; m/z 실측치, 380.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.98 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.66 (ddd, $J = 8.8, 4.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.29 – 7.26 (m, 1H), 7.02 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.75 – 4.70 (m, 2H), 3.25 (s, 1H).

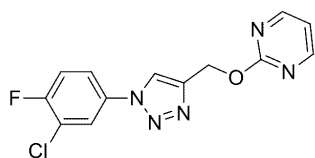
[2521] 실시예 618: 2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘.



[2522]

[2523] 단계 B에서, 1-(3-브로모-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 14)을 사용하여, 실시예 192, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}BrF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 411.0; m/z 실측치, 412.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.37 (s, 1H), 8.32 (s, 2H), 8.09 (dd, $J = 5.8, 2.7$ Hz, 1H), 7.78 (ddd, $J = 8.9, 4.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.35 (dd, $J = 8.9, 7.9$ Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 4.86 – 4.79 (m, 1H), 4.75 – 4.68 (m, 1H), 4.38 – 4.32 (m, 1H), 4.31 – 4.25 (m, 1H).

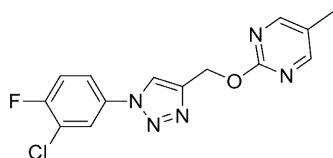
[2524] 실시예 619: 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2525]

[2526] (1-(3-클로로-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 305.0; m/z 실측치, 306.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.57 (d, $J = 4.7$ Hz, 2H), 8.11 – 8.06 (m, 1H), 7.84 (dd, $J = 6.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.62 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.31 (t, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.00 (t, $J = 4.8$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

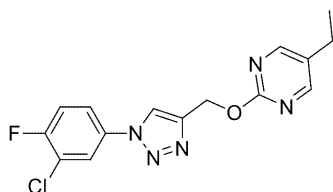
[2527] 실시예 620: 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2528]

[2529] (1-(3-클로로-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 8.07 (s, 1H), 7.84 (dd, $J = 6.3, 2.7$ Hz, 1H), 7.61 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.30 (t, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.26 (s, 3H).

[2530] 실시예 621: 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.

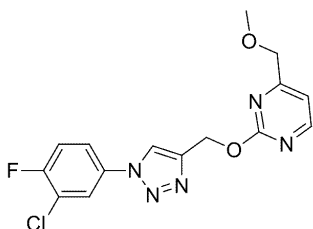


[2531]

[2532] (1-(3-클로로-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시

예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClFN_5O$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.39 (s, 2H), 8.08 (s, 1H), 7.84 (dd, $J = 6.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.61 (ddd, $J = 8.9, 4.0, 2.7$ Hz, 1H), 7.30 (t, $J = 8.6$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.60 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 1.26 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

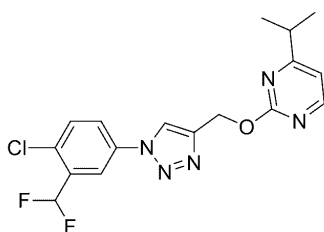
[2533] 실시예 622: 2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[2534]

[2535] (1-(3-클로로-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}ClFN_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.84 (dd, $J = 6.2, 2.7$ Hz, 1H), 7.61 (ddd, $J = 8.9, 3.9, 2.7$ Hz, 1H), 7.30 (t, $J = 8.6$ Hz, 1H), 7.15 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 5.65 (s, 2H), 4.50 (s, 2H), 3.50 (s, 3H).

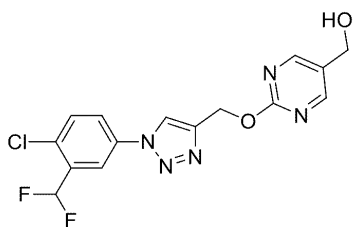
[2536] 실시예 623: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘.



[2537]

[2538] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.43 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 8.00 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.89 – 7.86 (m, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.11 – 6.85 (m, 2H), 5.66 (s, 2H), 2.97 (hept, $J = 6.9$ Hz, 1H), 1.30 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

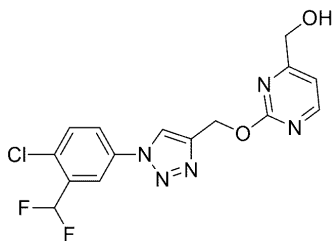
[2539] 실시예 624: [2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올.



[2540]

[2541] 단계 A에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8)을 사용하여, 실시예 160, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.58 (s, 2H), 8.17 (s, 1H), 8.01 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.89 (dd, $J = 8.7, 2.6$ Hz, 1H), 7.66 – 7.56 (m, 1H), 6.99 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 5.68 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.71 (d, $J = 5.6$ Hz, 2H), 1.78 (t, $J = 5.5$ Hz, 1H).

[2542] 실시예 625: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올.

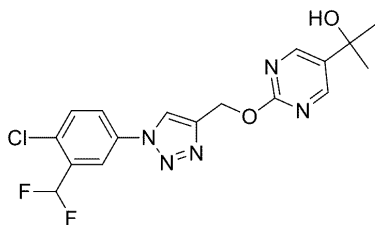


[2543]

[2544] 단계 A에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8)을 사용하여, 실시예 159, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.51 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.83 (m, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 1H), 7.11 – 6.85 (m, 2H), 5.67 (s, 2H), 4.72 (s, 2H).

[2545]

실시예 626: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.

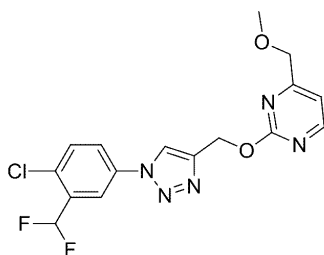


[2546]

[2547] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{16}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.66 (s, 2H), 8.19 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.88 (dd, J = 8.7, 2.6 Hz, 1H), 7.60 (dd, J = 8.6, 1.2 Hz, 1H), 6.98 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.65 – 5.63 (m, 2H), 1.61 (s, 6H).

[2548]

실시예 627: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.

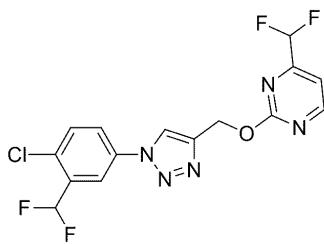


[2549]

[2550] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{14}ClF_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.55 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.91 – 7.86 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.15 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.66 (s, 2H), 4.50 (s, 2H), 3.50 (s, 3H).

[2551]

실시예 628: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘.



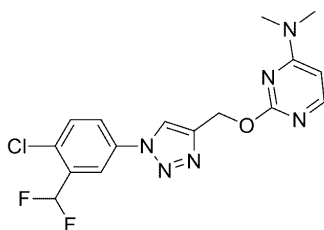
[2552]

[2553]

(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}ClF_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 387.1; m/z 실측치, 388.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.76 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.91 – 7.85 (m, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 1H), 7.30 (d, J = 4.9 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 6.50 (t, J = 54.7 Hz, 1H), 5.71 (d, J = 0.6 Hz, 2H).

[2554]

실시예 629: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민.



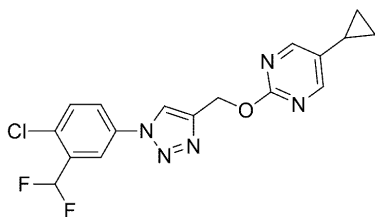
[2555]

[2556]

(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-N,N-다이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 380.1; m/z 실측치, 381.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 8.06 – 7.98 (m, 2H), 7.91 – 7.82 (m, 1H), 7.60 (dt, J = 8.7, 1.2 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.13 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.11 (s, 6H).

[2557]

실시예 630: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘.

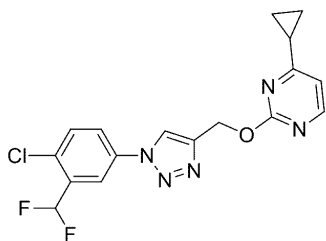


[2558]

[2559]

(1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.00 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.91 – 7.87 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 1H), 6.99 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.64 (s, 2H), 1.83 (tt, J = 8.4, 5.1 Hz, 1H), 1.02 (ddd, J = 8.3, 6.4, 4.8 Hz, 2H), 0.70 (ddd, J = 7.3, 5.7, 4.4 Hz, 2H).

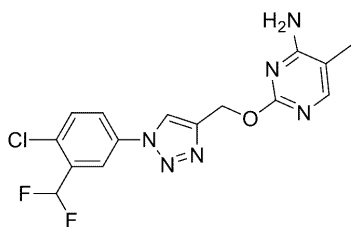
[2560] 실시예 631: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-사이클로프로필-피리미딘.



[2561]

[2562] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{14}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.32 – 8.29 (m, 1H), 8.16 – 8.12 (m, 1H), 8.02 – 7.98 (m, 1H), 7.89 – 7.84 (m, 1H), 7.60 (dd, J = 8.5, 1.2 Hz, 1H), 7.10 – 6.84 (m, 2H), 5.60 (s, 2H), 2.00 – 1.90 (m, 1H), 1.22 – 1.16 (m, 2H), 1.08 (ddd, J = 6.7, 3.0, 1.6 Hz, 2H).

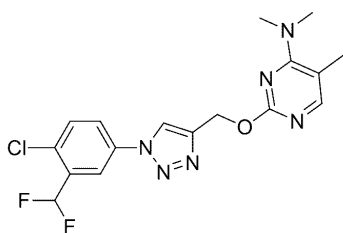
[2563] 실시예 632: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



[2564]

[2565] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8)을 사용하여, 실시예 161과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. (ESI): $C_{15}H_{13}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 366.1; m/z 실측치, 366.9 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.00 (d, J = 2.6 Hz, 1H), 7.92 – 7.84 (m, 2H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.60 – 5.54 (m, 2H), 4.91 (s, 2H), 2.07 – 2.01 (m, 3H).

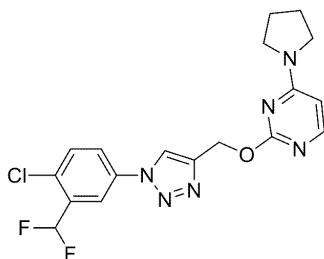
[2566] 실시예 633: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민.



[2567]

[2568] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-N,N,5-트라이메틸피리미딘-4-아민을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 394.1; m/z 실측치, 395.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.14 (s, 1H), 8.04 – 7.97 (m, 1H), 7.90 – 7.80 (m, 2H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 6.99 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 5.59 (s, 2H), 3.13 (s, 6H), 2.25 (s, 3H).

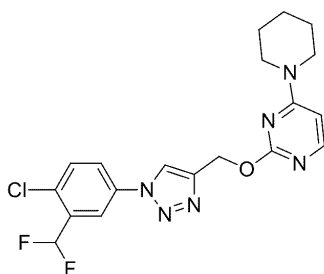
[2569] 실시예 634: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘.



[2570]

[2571] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-(피롤리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{17}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 406.1; m/z 실측치, 407.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 8.03 – 7.98 (m, 2H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.60 (dt, J = 8.6, 1.2 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.00 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 5.61 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 3.62 (s, 2H), 3.35 (s, 2H), 2.00 (s, 4H).

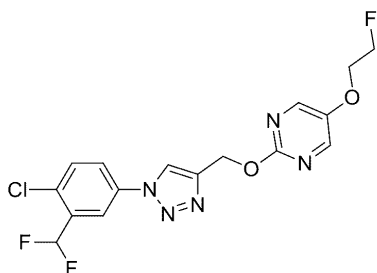
[2572] 실시예 635: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘.



[2573]

[2574] (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8) 및 2-클로로-4-(피페리딘-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{19}H_{19}ClF_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 420.1; m/z 실측치, 421.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.15 (s, 1H), 8.06 – 7.96 (m, 2H), 7.91 – 7.80 (m, 1H), 7.68 – 7.52 (m, 1H), 6.98 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.19 (d, J = 6.1 Hz, 1H), 5.58 (s, 2H), 3.73 – 3.48 (m, 4H), 1.73 – 1.56 (m, 6H).

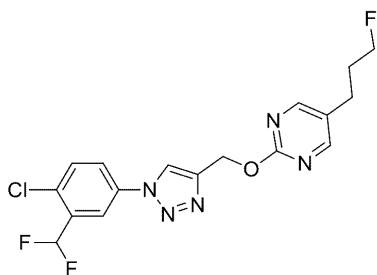
[2575] 실시예 636: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘.



[2576]

[2577] 단계 B에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8)을 사용하여, 실시예 192, 단계 A 및 단계 B와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{13}ClF_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 399.1; m/z 실측치, 400.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.29 (s, 2H), 8.16 (s, 1H), 8.01 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 8.7, 2.7 Hz, 1H), 7.61 (d, J = 8.7 Hz, 1H), 6.99 (t, J = 54.5 Hz, 1H), 5.62 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 4.90 – 4.77 (m, 1H), 4.76 – 4.66 (m, 1H), 4.37 – 4.27 (m, 1H), 4.27 – 4.18 (m, 1H). ^{19}F NMR (376 MHz, $CDCl_3$) δ -115.87 (s), -116.02 (s).

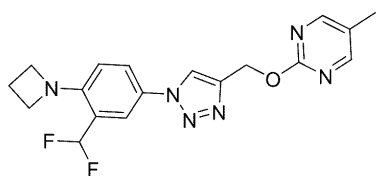
[2578] 실시예 637: 2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘.



[2579]

[2580] 단계 G에서 (1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 8)을 사용하여, 실시예 196, 단계 A 내지 단계 G와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}ClF_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실측치, 398.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.42 (s, 2H), 8.18 (s, 1H), 8.01 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 7.92 – 7.86 (m, 1H), 7.61 (d, $J = 8.7$ Hz, 1H), 6.99 (t, $J = 54.5$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 1H), 4.55 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 4.43 (t, $J = 5.7$ Hz, 2H), 2.78 – 2.63 (m, 1H), 2.10 – 1.92 (m, 1H).

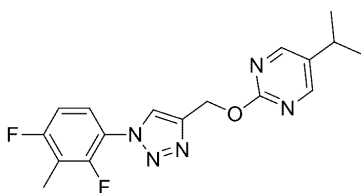
[2581] 실시예 638: 2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘.



[2582]

[2583] 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘 (실시예 51)을 사용하여, 실시예 188과 유사한 방식으로 제조하였다. MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 372.3; m/z 실측치, 373.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.41 – 8.34 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 8.05 – 8.00 (s, 1H), 7.74 – 7.70 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 7.67 – 7.62 (m, 1H), 6.91 – 6.64 (m, 1H), 6.58 – 6.51 (d, $J = 8.8$ Hz, 1H), 5.64 – 5.58 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 4.15 – 4.07 (m, 4H), 2.45 – 2.35 (m, 2H), 2.29 – 2.21 (m, 3H).

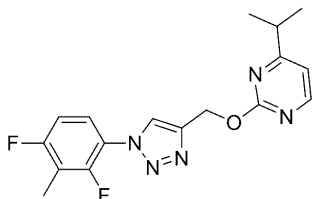
[2584] 실시예 639: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘.



[2585]

[2586] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-아이소프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.42 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.74 – 7.65 (m, 1H), 7.02 (td, $J = 8.8, 1.8$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.91 (hept, $J = 6.8$ Hz, 1H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H), 1.29 (d, $J = 7.0$ Hz, 6H).

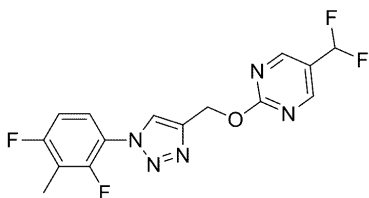
[2587] 실시예 640: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘.



[2588]

[2589] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-4-아이소프로필 피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.42 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 8.13 (d, $J = 2.9$ Hz, 1H), 7.71 – 7.64 (m, 1H), 7.04 – 6.97 (m, 1H), 6.85 (d, $J = 5.1$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.95 (hept, $J = 6.9$ Hz, 1H), 2.28 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H), 1.28 (d, $J = 6.9$ Hz, 6H).

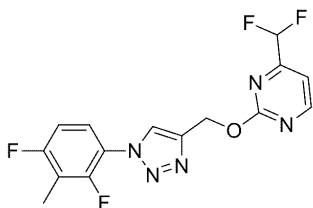
[2590] 실시예 641: 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2591]

[2592] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-다이플루오로 메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.71 (t, $J = 1.2$ Hz, 2H), 8.15 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.74 – 7.66 (m, 1H), 7.03 (td, $J = 8.6, 1.8$ Hz, 1H), 6.72 (t, $J = 55.6$ Hz, 1H), 5.72 (s, 2H), 2.30 (t, $J = 2.1$ Hz, 3H).

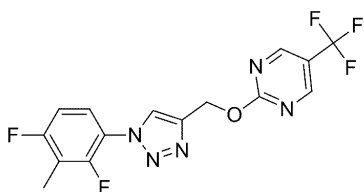
[2593] 실시예 642: 4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2594]

[2595] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-4-다이플루오로 메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.75 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 8.16 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.75 – 7.64 (m, 1H), 7.29 (d, $J = 4.9$ Hz, 1H), 7.10 – 6.96 (m, 1H), 6.49 (t, $J = 54.7$ Hz, 1H), 5.71 (s, 2H), 2.30 (t, $J = 2.1$ Hz, 3H).

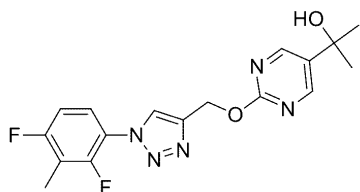
[2596] 실시예 643: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.



[2597]

[2598] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{10}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 372.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.81 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 8.16 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.70 (td, $J = 8.7, 5.6$ Hz, 1H), 7.03 (td, $J = 8.7, 1.8$ Hz, 1H), 5.74 (s, 2H), 2.30 (t, $J = 2.1$ Hz, 3H).

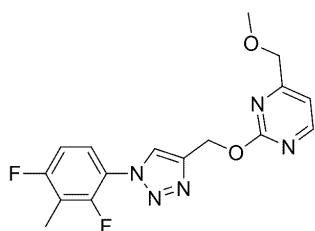
[2599] 실시예 644: 2-[2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올.



[2600]

[2601] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-(2-클로로피리미딘-5-일)프로판-2-올을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{17}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.67 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.69 (td, $J = 8.6, 5.7$ Hz, 1H), 7.02 (td, $J = 8.7, 1.9$ Hz, 1H), 5.67 (s, 2H), 2.30 (s, 3H), 1.62 (s, 6H).

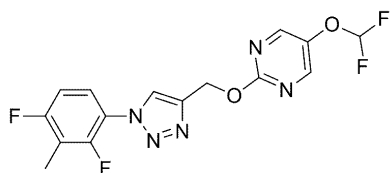
[2602] 실시예 645: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘.



[2603]

[2604] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-4-(메톡시메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.54 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.14 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.68 (dddd, $J = 9.1, 8.4, 5.7, 0.8$ Hz, 1H), 7.14 (dt, $J = 5.0, 0.7$ Hz, 1H), 7.01 (td, $J = 8.7, 1.8$ Hz, 1H), 5.65 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 4.49 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 3.49 (s, 3H), 2.29 (t, $J = 2.1$ Hz, 3H).

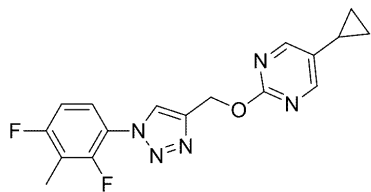
[2605] 실시예 646: 5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2606]

[2607] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1; m/z 실측치, 370.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.44 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 7.74 - 7.65 (m, 1H), 7.02 (td, $J = 8.7, 1.8$ Hz, 1H), 6.52 (t, $J = 71.9$ Hz, 1H), 5.66 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.30 (t, $J = 2.1$ Hz, 3H).

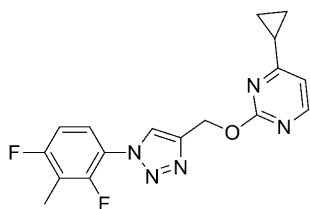
[2608] 실시예 647: 5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2609]

[2610] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.31 (s, 2H), 8.12 (d, J = 2.8 Hz, 1H), 7.68 (td, J = 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.01 (td, J = 8.7, 1.8 Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.29 (t, J = 2.0 Hz, 3H), 1.82 (tt, J = 8.4, 5.1 Hz, 1H), 1.01 (ddd, J = 8.4, 6.4, 4.9 Hz, 2H), 0.72 – 0.66 (m, 2H).

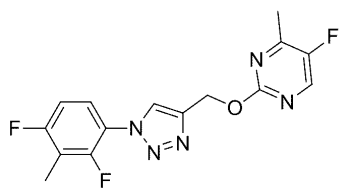
[2611] 실시예 648: 4-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2612]

[2613] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-4-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.29 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 8.10 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.68 (td, J = 8.7, 5.7 Hz, 1H), 7.01 (td, J = 8.7, 1.8 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 5.1 Hz, 1H), 5.60 (s, 2H), 2.29 (t, J = 2.1 Hz, 3H), 1.94 (tt, J = 8.1, 4.6 Hz, 1H), 1.22 – 1.16 (m, 2H), 1.10 – 1.03 (m, 2H).

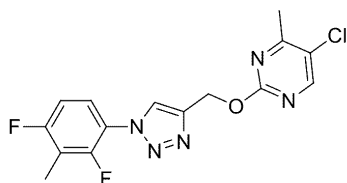
[2614] 실시예 649: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘.



[2615]

[2616] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}F_3N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 335.1; m/z 실측치, 336.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.25 (d, J = 1.2 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.76 – 7.64 (m, 1H), 7.06 – 6.95 (m, 1H), 5.67 – 5.57 (m, 2H), 2.49 (d, J = 2.5 Hz, 3H), 2.30 (t, J = 2.0 Hz, 3H).

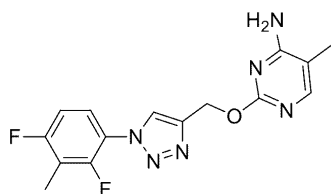
[2617] 실시예 650: 5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2618]

[2619] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 1H), 8.13 (d, $J = 2.6$ Hz, 1H), 7.76 – 7.63 (m, 1H), 7.06 – 6.99 (m, 1H), 5.66 – 5.60 (m, 2H), 2.56 (s, 3H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H).

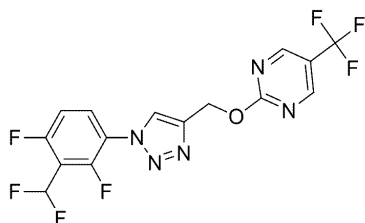
[2620] 실시예 651: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민.



[2621]

[2622] (1-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 10)을 사용하여, 실시예 161과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{14}F_2N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실측치, 333.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, CD_3OD) δ 8.46 (d, $J = 2.3$ Hz, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.65 (td, $J = 8.6, 5.6$ Hz, 1H), 7.15 (td, $J = 8.8, 1.8$ Hz, 1H), 5.46 (s, 2H), 2.30 (t, $J = 2.0$ Hz, 3H), 1.99 (s, 3H).

[2623] 실시예 652: 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘.

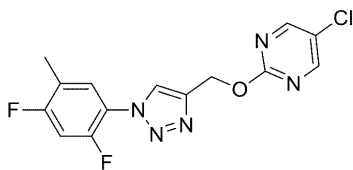


[2624]

[2625] 단계 A. 1-(3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올. 단계 A에서 3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로아닐린, 및 단계 B에서 1-아지도-3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로벤젠 및 60°C의 반응 온도를 사용하여, 중간체 5와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다.

[2626] 단계 B. 2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘. (1-(3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-트라이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_3F_7N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 407.1; m/z 실측치, 408.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.82 (s, 2H), 8.22 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 8.14 – 8.05 (m, 1H), 7.24 – 7.16 (m, 1H), 7.00 (t, $J = 52.9$ Hz, 1H), 5.74 (s, 2H).

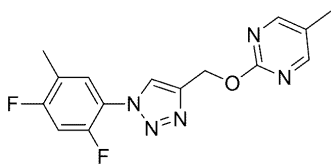
[2627] 실시예 653: 5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2628]

[2629] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{10}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.49 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.5$ Hz, 1H), 7.77 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 7.00 (t, $J = 9.7$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.32 (s, 3H).

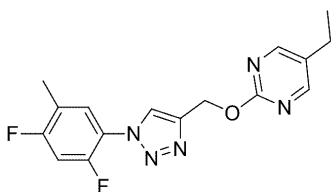
[2630] 실시예 654: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘.



[2631]

[2632] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2-클로로-5-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.37 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.7$ Hz, 1H), 7.77 (t, $J = 8.0$ Hz, 1H), 6.99 (dd, $J = 10.6, 8.9$ Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.25 (s, 3H).

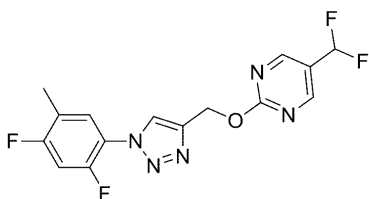
[2633] 실시예 655: 2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[2634]

[2635] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{16}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.38 (s, 2H), 8.14 (d, $J = 2.8$ Hz, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 1H), 6.98 (dd, $J = 10.6, 8.9$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 2.59 (q, $J = 7.6$ Hz, 2H), 2.36 – 2.25 (m, 3H), 1.25 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

[2636] 실시예 656: 5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

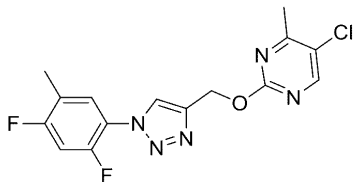


[2637]

[2638] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2-클로로-5-다이플루오로메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O$ 에

대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.70 (s, 2H), 8.16 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.00 (dd, J = 10.7, 8.9 Hz, 1H), 6.72 (t, J = 55.6 Hz, 1H), 5.71 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.37 – 2.26 (m, 3H).

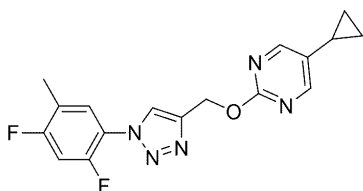
[2639] 실시예 657: 5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘.



[2640]

[2641] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{12}ClF_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.36 (s, 1H), 8.14 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.82 – 7.70 (m, 1H), 6.99 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H), 2.55 (s, 3H), 2.33 – 2.29 (m, 3H).

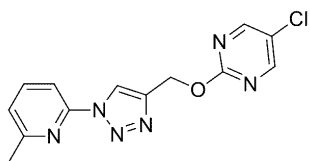
[2642] 실시예 658: 5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2643]

[2644] (1-(2,4-다이플루오로-5-메틸페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 13) 및 2-클로로-5-사이클로프로필피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_2N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.31 (s, 2H), 8.14 (d, J = 2.7 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 10.6, 8.9 Hz, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.33 – 2.31 (m, 3H), 1.82 (tt, J = 8.5, 5.2 Hz, 1H), 1.04 – 0.99 (m, 2H), 0.69 (dt, J = 6.4, 4.9 Hz, 2H).

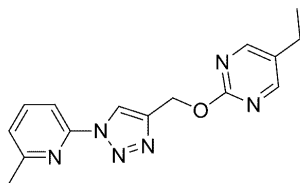
[2645] 실시예 659: 5-클로로-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2646]

[2647] 단계 C에서 2,5-다이클로로피리미딘을 사용하여, 실시예 174, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_{11}ClN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 302.1; m/z 실측치, 303.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.71 (s, 1H), 8.49 (s, 2H), 7.96 (d, J = 8.1 Hz, 1H), 7.77 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.18 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 5.64 (d, J = 0.7 Hz, 2H), 2.57 (s, 3H).

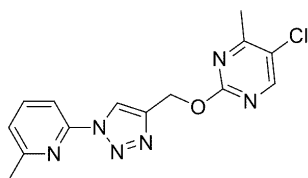
[2648] 실시예 660: 5-에틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2649]

[2650] 단계 C에서 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 174, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{16}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1; m/z 실측치, 297.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.71 (s, 1H), 8.39 (d, $J = 0.6$ Hz, 2H), 7.96 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.76 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.17 (d, $J = 7.5$ Hz, 1H), 5.64 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.65 – 2.53 (m, 5H), 1.25 (t, $J = 7.6$ Hz, 3H).

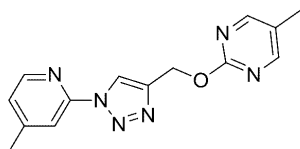
[2651] 실시예 661: 5-클로로-4-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2652]

[2653] 단계 C에서 2,5-다이클로로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 174, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}ClN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 316.1; m/z 실측치, 317.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.71 (s, 1H), 8.38 (s, 1H), 7.97 (d, $J = 8.1$ Hz, 1H), 7.77 (t, $J = 7.8$ Hz, 1H), 7.18 (d, $J = 7.3$ Hz, 1H), 5.63 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H), 2.57 (s, 3H), 2.56 (s, 3H).

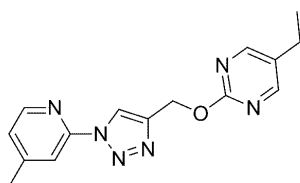
[2654] 실시예 662: 5-메틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2655]

[2656] 단계 A에서 4-메틸피리딘 *N*-옥사이드, 단계 B에서 7-메틸테트라졸로[1,5-a]피리딘 및 단계 C에서 (1-(4-메틸피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올을 사용하여, 실시예 174, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{14}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 282.1; m/z 실측치, 283.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.66 (s, 1H), 8.37 (s, 2H), 8.32 (d, $J = 5.0$ Hz, 1H), 8.04 – 7.98 (m, 1H), 7.17 – 7.12 (m, 1H), 5.63 (s, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

[2657] 실시예 663: 5-에틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.

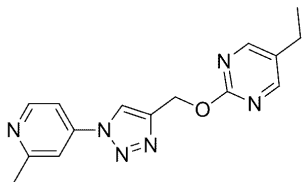


[2658]

[2659] 단계 A에서 4-메틸피리딘 *N*-옥사이드, 단계 B에서 7-메틸테트라졸로[1,5-a]피리딘 및 단계 C에서 (1-(4-메틸피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 174, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{16}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1; m/z

실측치, 297.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.69 – 8.64 (m, 1H), 8.40 – 8.37 (m, 2H), 8.33 (d, J = 5.0 Hz, 1H), 8.04 – 8.01 (m, 1H), 7.17 – 7.12 (m, 1H), 5.67 – 5.60 (m, 2H), 2.59 (q, J = 7.4 Hz, 2H), 2.47 (s, 3H), 1.25 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

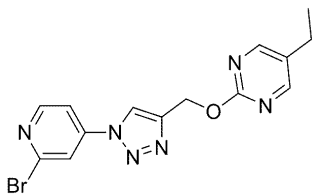
[2660] 실시예 664: 5-에틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2661]

[2662] 단계 C에서 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 175, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{16}N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1; m/z 실측치, 297.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.65 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 8.40 (s, 2H), 8.21 (s, 1H), 7.61 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.51 – 7.47 (m, 1H), 5.65 (s, 2H), 2.67 (s, 3H), 2.61 (q, J = 7.6 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

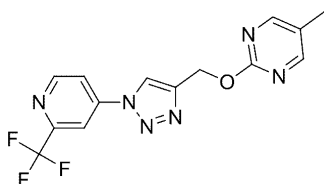
[2663] 실시예 665: 2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘.



[2664]

[2665] 단계 C에서 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 177, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{13}BrN_6O$ 에 대한 질량 계산치, 360.0; m/z 실측치, 361.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, CD_3OD) δ 8.88 (s, 1H), 8.53 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 8.48 (s, 2H), 8.24 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.01 (dd, J = 5.5, 2.1 Hz, 1H), 5.61 (s, 2H), 2.64 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 1.26 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

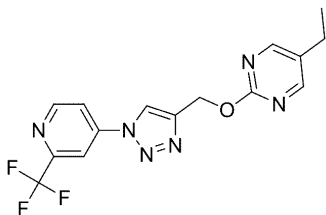
[2666] 실시예 666: 5-메틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2667]

[2668] 단계 A에서 4-아미노-2-(트라이플루오로메틸)피리딘, 단계 B에서 4-아지도-2-(트라이플루오로메틸)피리딘 및 단계 C에서 (1-(2-(트라이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올을 사용하여, 실시예 177, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{14}H_{11}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.90 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 8.39 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 8.30 – 8.28 (m, 1H), 8.12 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 5.4, 2.0 Hz, 1H), 5.66 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.27 (s, 3H).

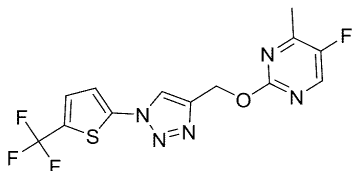
[2669] 실시예 667: 5-에틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딘]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘.



[2670]

[2671] 단계 A에서 4-아미노-2-(트라이플루오로메틸)피리딘, 단계 B에서 4-아지도-2-(트라이플루오로메틸)피리딘 및 단계 C에서 (1-(2-(트라이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-에틸피리미딘을 사용하여, 실시예 177, 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{15}H_{13}F_3N_6O$ 에 대한 질량 계산치, 350.1; m/z 실측치, 351.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.90 (d, J = 5.4 Hz, 1H), 8.42 – 8.39 (m, 2H), 8.30 (t, J = 0.7 Hz, 1H), 8.13 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 7.92 (dd, J = 5.4, 2.1 Hz, 1H), 5.67 (d, J = 0.8 Hz, 2H), 2.62 (q, J = 7.7 Hz, 2H), 1.27 (t, J = 7.6 Hz, 3H).

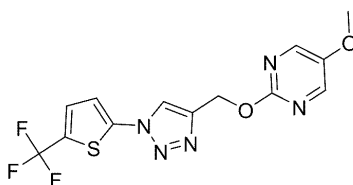
[2672] 실시예 668: 5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[2673]

[2674] (1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-플루오로-4-메틸피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_9F_4N_5OS$ 에 대한 질량 계산치, 359.3; m/z 실측치, 360.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.28 – 8.23 (s, 1H), 8.11 – 8.05 (s, 1H), 7.42 – 7.37 (m, 1H), 7.19 – 7.15 (m, 1H), 5.62 – 5.57 (s, 2H), 2.53 – 2.45 (d, J = 2.4 Hz, 3H).

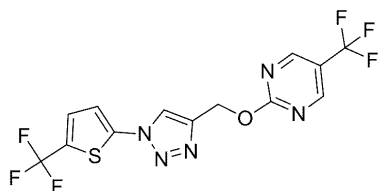
[2675] 실시예 669: 5-메톡시-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[2676]

[2677] (1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-메톡시피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_{10}F_3N_5O_2S$ 에 대한 질량 계산치, 357.3; m/z 실측치, 358.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.26 – 8.22 (s, 2H), 8.09 – 8.06 (d, J = 0.9 Hz, 1H), 7.40 – 7.37 (m, 1H), 7.19 – 7.15 (m, 1H), 5.62 – 5.56 (s, 2H), 3.91 – 3.85 (m, 3H).

[2678] 실시예 670: 5-(트라이플루오로메틸)-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



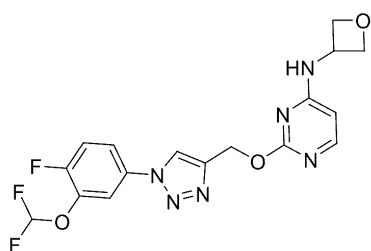
[2679]

[2680]

(1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 155와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{13}H_7F_6N_5OS$ 에 대한 질량 계산치, 395.3; m/z 실측치, 396.1 $[M+H]^+$. ^1H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.85 – 8.80 (d, $J = 0.9$ Hz, 2H), 8.12 – 8.09 (m, 1H), 7.42 – 7.38 (m, 1H), 7.22 – 7.17 (m, 1H), 5.74 – 5.70 (d, $J = 0.7$ Hz, 2H).

[2681]

실시예 671: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민.



[2682]

[2683]

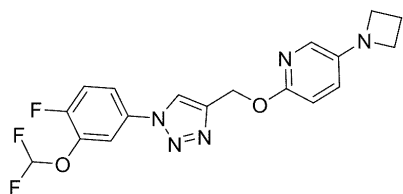
단계 A에서 (1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 및 2-클로로-N-(옥세탄-3-일)-N-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)피리미딘-4-아민 (중간체 62)을 사용하여, 실시예 159와 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_6O_3$ 에 대한 질량 계산치, 408.1; m/z 실측치, 409.2 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8.91 (s, 1H), 8.26 – 8.17 (m, 1H), 8.00 (dd, $J = 7.0, 2.6$ Hz, 1H), 7.97 – 7.91 (m, 1H), 7.87 (ddd, $J = 8.9, 3.9, 2.6$ Hz, 1H), 7.68 (dd, $J = 10.2, 9.0$ Hz, 1H), 7.40 (t, $J = 72.8$ Hz, 1H), 6.24 – 6.16 (m, 1H), 5.38 (s, 2H), 5.00 – 4.86 (m, 1H), 4.79 (t, $J = 6.7$ Hz, 2H), 4.45 (t, $J = 6.1$ Hz, 2H).

[2684]

실시예 672 내지 실시예 689, 실시예 693 내지 실시예 698, 실시예 700 내지 실시예 716을 상술한 실시예와 유사한 방식으로 제조할 수 있다.

[2685]

실시예 672: 5-(아세트딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘.



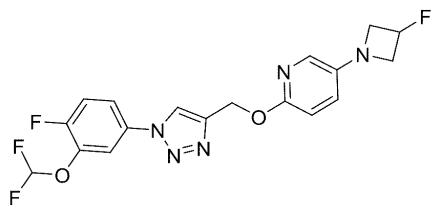
[2686]

[2687]

MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;

[2688]

실시예 673: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아세트딘-1-일)피리딘.



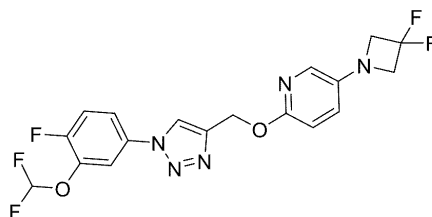
[2689]

[2690]

MS (ESI): $C_{18}H_{15}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 409.1;

[2691]

실시예 674: 5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리딘.



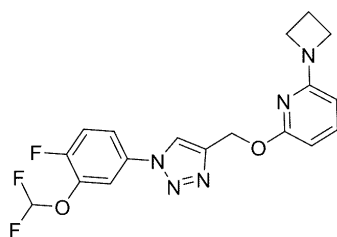
[2692]

[2693]

MS (ESI): $C_{18}H_{14}F_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 427.1;

[2694]

실시예 675: 2-(아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리딘.



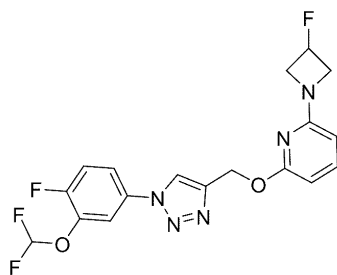
[2695]

[2696]

MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;

[2697]

실시예 676: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-6-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘.



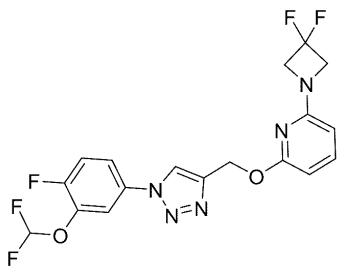
[2698]

[2699]

MS (ESI): $C_{18}H_{15}F_4N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 409.1;

[2700]

실시예 677: 2-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리딘.



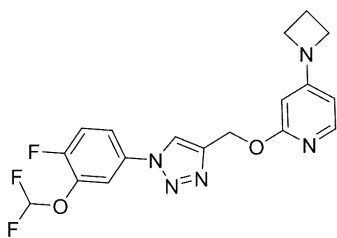
[2701]

[2702]

MS (ESI): C₁₈H₁₄F₅N₅O₂에 대한 질량 계산치, 427.1;

[2703]

실시예 678: 4-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘.



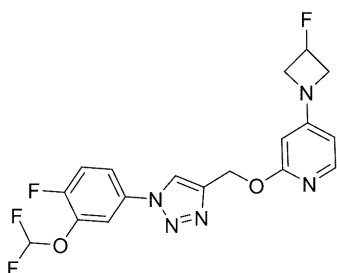
[2704]

[2705]

MS (ESI): $C_{18}H_{16}F_3N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;

[2706]

실시예 679: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘.



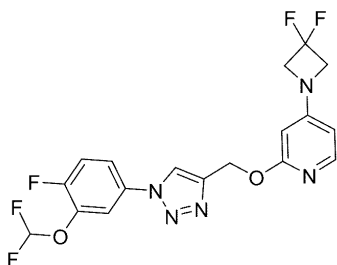
[2707]

[2708]

MS (ESI): C₁₈H₁₅F₄N₅O₂에 대한 질량 계산치, 409.1;

[2709]

실시예 680: 4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘.



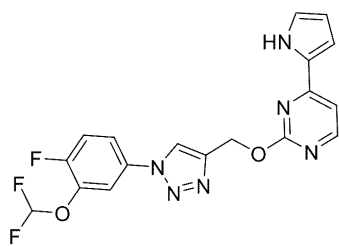
[2710]

[2711]

MS (ESI): C₁₈H₁₄F₅N₅O₂에 대한 질량 계산치, 427.1;

[2712]

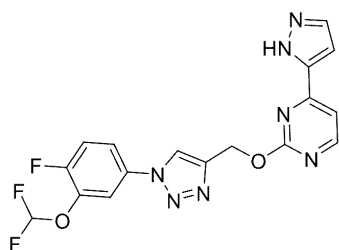
실시예 681: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피롤-2-일)피리미딘.



[2713]

[2714] MS (ESI): $C_{18}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 402.1;

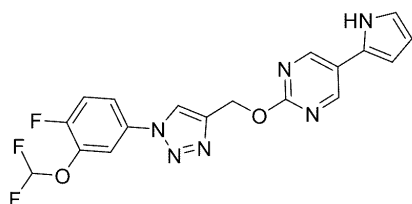
[2715] 실시예 682: 2-((1-(3-(다иф플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘.



[2716]

[2717] MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_3N_7O_2$ 에 대한 질량 계산치, 403.1;

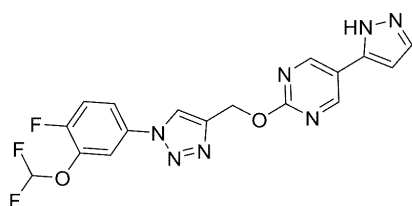
[2718] 실시예 683: 2-((1-(3-(다иф플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피롤-2-일)피리미딘.



[2719]

[2720] MS (ESI): $C_{18}H_{13}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 402.1;

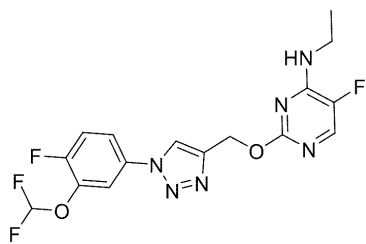
[2721] 실시예 684: 2-((1-(3-(다иф플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘.



[2722]

[2723] MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_3N_7O_2$ 에 대한 질량 계산치, 403.1;

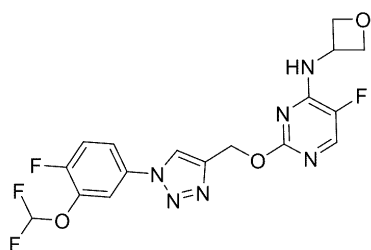
[2724] 실시예 685: 2-((1-(3-(다иф플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[2725]

[2726] MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_4N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 398.1;

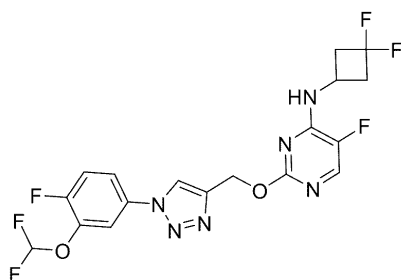
[2727] 실시예 686: 2-((1-(3-(다이하플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민.



[2728]

[2729] MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_4N_6O_3$ 에 대한 질량 계산치, 426.1;

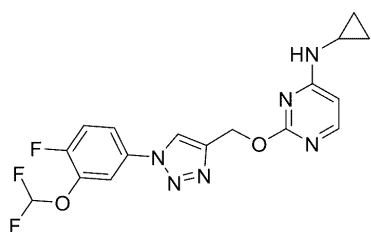
[2730] 실시예 687: N-(3,3-다이하플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이하플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[2731]

[2732] MS (ESI): $C_{18}H_{14}F_6N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 460.1;

[2733] 실시예 688: N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이하플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[2734]

[2735] MS (ESI): $C_{17}H_{15}F_3N_6O_2$ 에 대한 질량 계산치, 392.1;

[2736] 실시예 689: N-(3,3-다이하플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이하플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민.



[2739]

690:

[2740]



[2742]

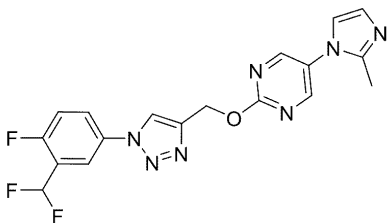
[2743]



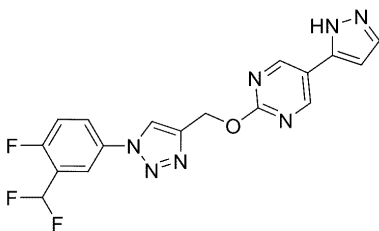
[2745]

- 319 -

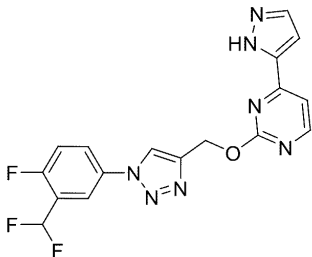
실시예 693: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘.



실시예 694: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘.

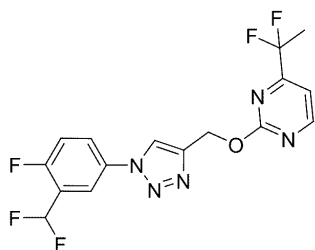


실시예 695: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘.



MS (ESI): C₁₇H₁₂F₃N₇O에 대한 질량 계산치, 387.1;

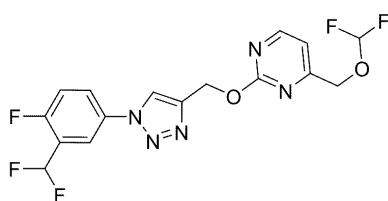
[2757] 실시예 696: 4-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[2758]

[2759] MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O$ 에 대한 질량 계산치 385.1;

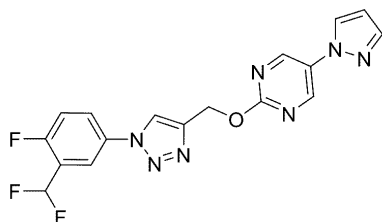
[2760] 실시예 697: 4-((다이플루오로메톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[2761]

[2762] MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O_2$ 에 대한 질량 계산치, 401.1;

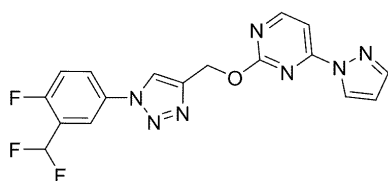
[2763] 실시예 698: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-1-일)피리미딘.



[2764]

[2765] MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_3N_7O$ 에 대한 질량 계산치, 387.1;

[2766] 실시예 699: 2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-1-일)피리미딘.

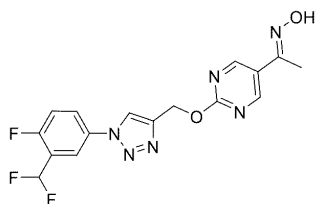


[2767]

[2768] (1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메탄올 (중간체 9) 및 2-클로로-4-(피라졸-1-일)피리미딘을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방식으로 표제 화합물을 제조하였다. MS (ESI): $C_{17}H_{12}F_3N_7O$ 에 대한 질량 계산치, 387.1; m/z 실측치, 388.0 $[M+H]^+$. ^1H NMR (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8.66 – 8.60 (m, 1H), 8.60 – 8.54 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 8.21 – 8.13 (s, 1H), 8.00 – 7.93 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 1H), 7.65 – 7.56 (d, J = 5.5 Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 1H), 7.10 – 6.81 (t, J = 54.6 Hz, 1H), 6.56 – 6.47 (m, 1H), 5.76 – 5.67 (m, 2H).

[2769] 실시예 700: (E)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-

5-일)에탄-1-온 옥심.



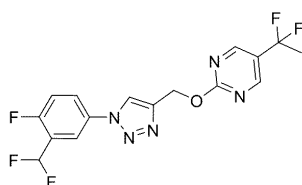
[2770]

MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 378.1;

[2771]

실시예 701: 5-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.

[2772]



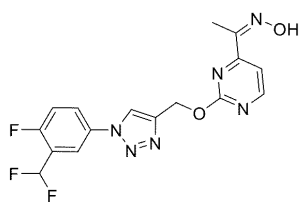
[2773]

MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치 385.1;

[2774]

실시예 702: (Z)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-온 옥심.

[2775]



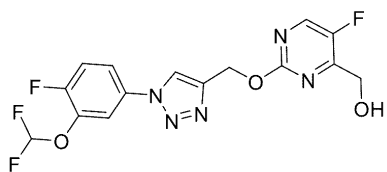
[2776]

MS (ESI): $C_{16}H_{13}F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 378.1;

[2777]

실시예 703: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-일)메탄올.

[2778]



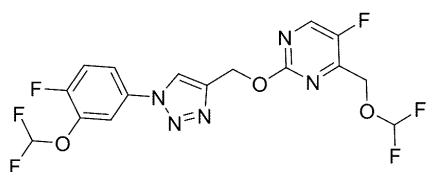
[2779]

MS (ESI): $C_{15}H_{11}F_4N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 385.1;

[2780]

실시예 704: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)-5-플루오로피리미딘.

[2781]

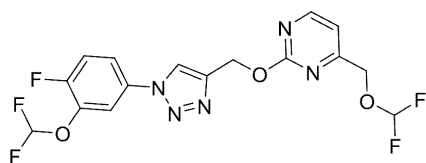


[2782]

MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_6N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 435.1;

[2783]

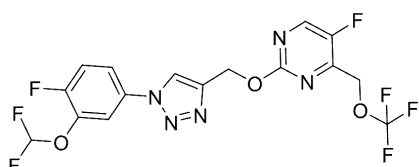
[2784] 실시예 705: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)피리미딘.



[2785]

[2786] MS (ESI): $C_{16}H_{12}F_5N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 417.1;

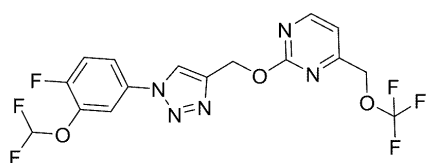
[2787] 실시예 706: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘.



[2788]

[2789] MS (ESI): $C_{16}H_{10}F_7N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 453.1;

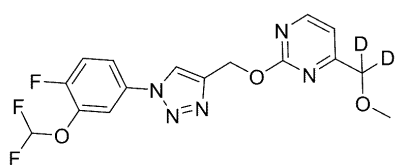
[2790] 실시예 707: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘.



[2791]

[2792] MS (ESI): $C_{16}H_{11}F_6N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 435.1;

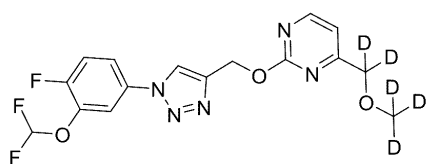
[2793] 실시예 708: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸-d2)피리미딘.



[2794]

[2795] MS (ESI): $C_{16}H_{12}D_2F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 383.1;

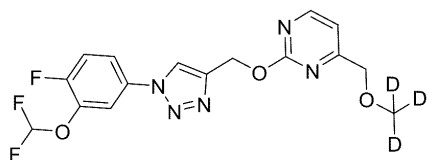
[2796] 실시예 709: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸-d2)피리미딘.



[2797]

[2798] MS (ESI): $C_{16}H_9D_5F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 386.1;

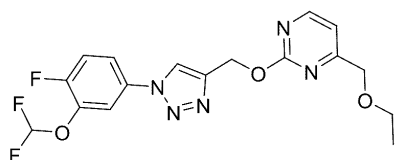
[2799] 실시예 710: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸)피리미딘.



[2800]

[2801] MS (ESI): $C_{16}H_{11}D_3F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 384.1;

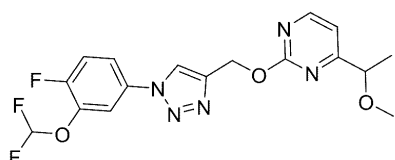
[2802] 실시예 711: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(에톡시메틸)피리미딘.



[2803]

[2804] MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;

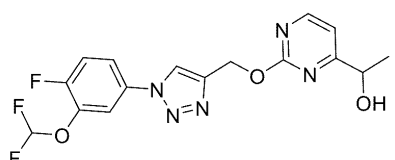
[2805] 실시예 712: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-메톡시에틸)피리미딘.



[2806]

[2807] MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;

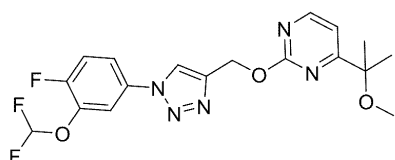
[2808] 실시예 713: 1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-올.



[2809]

[2810] MS (ESI): $C_{16}H_{14}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 381.1;

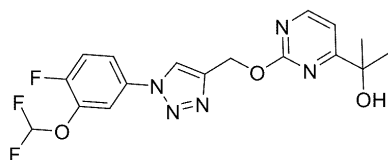
[2811] 실시예 714: 2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메톡시프로판-2-일)피리미딘.



[2812]

[2813] MS (ESI): $C_{18}H_{18}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 409.1;

[2814] 실시예 715: 2-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)프로판-2-올.



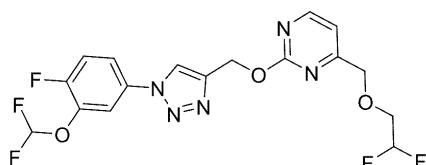
[2815]

[2816]

MS (ESI): $C_{17}H_{16}F_3N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;

[2817]

실시예 716: 4-((2,2-다이플루오로에톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘.



[2818]

[2819]

MS (ESI): $C_{17}H_{14}F_5N_5O_3$ 에 대한 질량 계산치, 431.1;

[2820]

생물학적 분석

[2821]

포유류 세포에 발현되는 복제된 인간 NR1/NR2B 이온 채널에 대한 시험 물질의 효과

[2822]

NMDA 수용체는 Ca^{2+} 이온에 대하여 고투과성인 이온 채널이어서, 세포 기반 칼슘 배출(calcium flux) 분석을 사용하여 NMDA 수용체 기능을 모니터링할 수 있게 한다. 이러한 분석에서, 공동 작용제(co-agonist)인 글루타메이트와 글리신을 인간 GluN1/GluN2B NMDA 수용체를 이중 발현하는 세포에 첨가하여, 세포 Ca^{2+} 유입을 개시한다. 시간 경과에 따른 세포 내 칼슘의 변화를 형광 염료 및 FLIPR (형광 이미징 플레이트 판독기(Fluorometric Imaging Plate Reader)) 장치를 사용하여 측정한다.

[2823]

측정하기 24시간 전에, 안정한 세포주에서의 NMDA 수용체의 발현이 비선택성 NMDA 수용체 차단제의 존재 하에 Tet-On 유도성 시스템으로 유도된다. 실험 당일에, 세포 배양 배지를 조심스럽게 세정하고, 세포를 149 mM NaCl, 4 mM KCl, 2 mM $CaCl_2$, 1.5 mM $MgCl_2$, 10 mM HEPES 및 5 mM D-글루코스를 함유하는 염료 로딩 완충액 (pH 7.4)에 칼슘 5 염료 키트(Calcium 5 Dye Kit) (몰레큘러 디바이시즈(Molecular Devices))와 함께 로딩한다. 실온에서 1시간 배양한 후, 염료를 분석 완충액(149 mM NaCl (표준 분석) 또는 150 mM (HTS 분석), 4 mM KCl (표준 분석) 또는 3 mM (HTS 분석), 2 mM $CaCl_2$, 0.01 mM EDTA, 10 mM HEPES 및 5 mM D-글루코스; pH 7.4)으로 씻어낸다. FLIPR TETRA 판독기에서, 다양한 농도의 시험 화합물을 세포에 5분간 첨가하면서, 형광을 모니터링하여 잠재적인 작용제 활성을 검출한다. 그 다음에, 공동 작용제인 글루타메이트 및 글리신을 추가로 5분간 첨가한다. 약 EC_{80} (표준 분석) 또는 EC_{40} (HTS 분석)에 상당하는 글루타메이트 농도를 사용하여, 분석의 시그널 윈도우(signal window)와, NMDA 수용체 길항제 및 음성 알로스테릭 조절제(negative allosteric modulator)를 검출하는 능력을 각각 최대화한다. 포화 농도 (10 μM)의 글리신도 본 분석에 존재한다. 비선택성 NMDA 수용체 길항제인 (+)MK-801을 길항제 활성에 대한 양성 대조군으로 사용한다. 시험 화합물의 존재 하에서의 형광 신호를 정량화하여, 적절한 대조 웰에 의해 정의된 신호로 정규화한다.

[2824] [표 5]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
1	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.049
2	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메틸]피리딘-2-아민;	0.213
3	N-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메틸]피리딘-2-아민;	2.800
4	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.392
5	3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.333
6	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)피리딘-2-아민;	10.573
7	N-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-이미다졸-2-아민;	1.870
8	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;	0.022
9	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.020
10	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.010
11	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	1.200
12	4-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	2.230
13	4-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.879
14	3-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.401
15	2-[[1-(4-클로로-3-메톡시-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.699
16	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.001
17	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.010
18	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리딘;	0.082
19	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리딘;	0.056
20	2-[[1-(4-플루오로-3-메톡시-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	1.000
21	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.002
22	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.002
23	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피라진;	0.456
24	N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메틸]피리딘-2-아민;	0.824
25	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.050

[2825]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
26	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.003
27	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.009
28	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.002
29	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;	0.011
30	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.004
31	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.001
32	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.002
33	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.018
34	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진;	0.159
35	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;	0.006
36	N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.351
37	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.053
38	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.027
39	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.015
40	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.001
41	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.000
42	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-클로로-피리미딘;	0.003
43	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.005
44	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.005
45	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.004
46	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.001
47	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
48	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.008
49	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
50	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.007

[2826]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
51	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.001
52	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.008
53	(R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.026
54	(R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	4.640
55	(S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.008
56	(R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.028
57	(R*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.338
58	(S*)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.007
59	(R/S)-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.040
60	(R/S)-5-클로로-2-[1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.032
61	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
62	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.007
63	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.003
64	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.007
65	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.056
66	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.052
67	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.015
68	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.007
69	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.009
70	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.044
71	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.040
72	5-에틸-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.010
73	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.008
74	5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.016
75	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.026

[2827]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
76	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.035
77	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.004
78	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.060
79	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.007
80	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.032
81	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.003
82	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.126
83	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.020
84	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.072
85	2-[[1-[3-(브로모-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘];	0.003
86	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.004
87	2-[[1-[4-클로로-3-메톡시-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.012
88	2-[[1-[4-클로로-3-메톡시-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.019
89	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.011
90	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.012
91	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.004
92	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.019
93	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.493
94	2-[[1-[5-(브로모-6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘];	2.910
95	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.023
96	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.008
97	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메틸]옥사졸-2-아민;	0.106
98	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.331
99	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;	5.050
100	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;	0.894
101	N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-3-아민;	0.374

[2828]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
102	N-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-1-메틸-피라졸-4-아민;	3.250
103	3-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘;	0.064
104	5-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메틸-피리딘;	0.729
105	3-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.059
106	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘;	0.276
107	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘;	0.119
108	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-메톡시-피리딘;	0.114
109	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	1.260
110	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-4-아민;	7.570
111	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.684
112	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.056
113	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;	0.038
114	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.021
115	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.170
116	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.102
117	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.073
118	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.026
119	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;	0.114
120	5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.005
121	5-메틸-2-((1-(4-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	NT
122	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-2-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
123	2-((1-(4-클로로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
124	2-((1-(4-클로로-3-(옥세탄-3-일)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
125	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-플루오로-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
126	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-(트라이플루오로메틸)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT

[2829]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
127	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
128	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸티아졸;	NT
129	1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)-4-(((5-메틸-1H-이미다졸-2-일)옥시)메틸)-1H-1,2,3-트리아졸;	NT
130	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리딘;	NT
131	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피리딘;	NT
132	6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피리딘;	NT
133	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메틸피라진;	NT
134	5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2,3-다이메틸피라진;	NT
135	5-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;	NT
136	6-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-3,4-다이메틸피리다진;	NT
137	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(트라이플루오로메틸)피리다진;	NT
138	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-메톡시피리다진;	NT
139	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메틸피리미딘;	NT
140	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	NT
141	4-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-2-메톡시피리미딘;	NT
142	2-((1-(5-클로로-6-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
143	2-((1-(2-(다이플루오로메틸)피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT
144	N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;	NT
145	N-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;	NT
146	3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메톡시피리딘;	NT
147	4-클로로-3-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
148	4-((1-(3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메톡시피리미딘;	NT
149	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	0.952
150	5-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)피리딘-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	NT
151	2-((1-(5-브로모-6-플루오로피리딘-3-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	NT

[2830]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
152	5-메틸-2-((1-(피리딘-4-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	NT
153	5-클로로-N-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.216
154	N-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;	0.030
155	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.006
156	1-[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.005
157	(R/S)-1-[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.018
158	2-[[1-(4-플루오로-3-(트리아플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	3.040
159	[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.408
160	[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.173
161	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.055
162	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-카르복스아미드;	>2.99
163	(R/S) 1-[2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]에탄아민;	1.400
164	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.371
165	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.016
166	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;	0.144
167	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;	0.013
168	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.008
169	2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;	0.031
170	4-[2-[[1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]모르폴린;	0.260
171	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.006
172	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.468
173	2-[[1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐)-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.465
174	5-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>2.99
175	5-메틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.655
176	5-메틸-2-[[1-(5-메틸-3-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.929
177	2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.172
178	2-[2-[[1-(3-사이클로부틸)-4-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.349
179	2-[2-[[1-(4-플루오로-3-아이스프로필-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.029

[2831]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
180	2-[2-[[1-(3-사이클로프로필-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.133
181	2-[2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.097
182	2-[2-[[1-(3-에틸-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.027
183	5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.009
184	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메틸피라졸-3-일)피리미딘;	0.309
185	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;	0.166
186	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1H-피라졸-4-일)피리미딘;	1.360
187	4-(2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐]-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일)모르폴린;	0.088
188	2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	4.580
189	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피라진;	1.460
190	4-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.026
191	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-플루오로-피리미딘;	0.023
192	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;	0.030
193	2-[[1-[4-클로로-3-(2-플루오로에톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.089
194	2-[[1-[4-플루오로-3-(3-플루오로프로필)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.061
195	2-[[1-[3-(3-클로로프로필)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.136
196	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;	0.024
197	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-플루오로-피리미딘-2-아민;	0.652
198	N-[[1-[4-플루오로-3-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;	0.147
199	5-클로로-N-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;	0.051
200	5-클로로-N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.131
201	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-4-메틸-피리미딘-2-아민;	0.100
202	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민;	0.044
203	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메톡시-피리미딘-2-아민;	0.030
204	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;	0.240

[2832]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
205	N-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;	0.616
206	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;	0.219
207	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-에틸-피리미딘-2-아민;	0.128
208	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-아이소프로필-피리미딘-2-아민;	0.581
209	5-사이클로프로필-N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.104
210	N-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-4,5-다이메틸-피리미딘-2-아민;	0.050
211	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-메틸-피리미딘-2-아민;	0.049
212	5-클로로-N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]피리미딘-2-아민;	0.074
213	N-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘-2-아민;	0.108
214	2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메틸아미노]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.654
215	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;	0.986
216	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-5-에틸피리미딘-2-아민;	0.026
217	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-4,5-다이메틸피리미딘-2-아민;	0.012
218	5-클로로-N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-4-메틸피리미딘-2-아민;	0.011
219	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민;	>10
220	N-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-이미다졸-2-아민;	3.650
221	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)피리미딘-2-아민;	0.724
222	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-5-메틸피리미딘-2-아민;	0.064
223	N-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메틸)-1-메틸-1H-피라졸-5-아민; 및	11.801
224	N-((1R)-1-[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]에틸)-5-메틸-피리미딘-2-아민	0.121
225	5-클로로-2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.070
226	2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.155
227	2-[[1-(4-클로로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;	0.151
228	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	5.649
229	5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	2.980
230	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.275
231	5-클로로-2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.389
232	2-[[1-(3-플루오로페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.205

[2833]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
233	5-에틸-2-[[1-(3-플루오로페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.075
234	2-[[1-(3-브로모페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.022
235	2-[[1-(3-브로모페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	NT
236	2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>10
237	5-플루오로-2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	16.600
238	5-메톡시-2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	5.990
239	5-클로로-2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	4.800
240	5-메틸-2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	5.580
241	5-에틸-2-[[1-(o-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.460
242	2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.647
243	5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.014
244	4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.191
245	5-에틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.010
246	5-클로로-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.033
247	5-플루오로-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.340
248	5-메톡시-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.009
249	2-[2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.289
250	4-(메톡시메틸)-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.249
251	4,5-다이메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.002
252	5-플루오로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.065
253	5-클로로-4-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.007
254	5-메틸-2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.151
255	1-[2-[[1-(m-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.224
256	2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	4.420
257	5-플루오로-2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	2.690
258	5-메톡시-2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.225
259	5-클로로-2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.711
260	5-메틸-2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.271
261	5-에틸-2-[[1-(p-톨릴)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.093
262	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.358
263	5-플루오로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.227
264	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.006
265	5-클로로-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.016
266	2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.010
267	5-에틸-2-[[1-(3-아이소프로필페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.012
268	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.134
269	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.325
270	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;	0.617
271	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.360
272	2-[2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.173
273	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.027
274	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.813

[2834]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
275	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.025
276	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.031
277	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.041
278	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.042
279	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.003
280	2-클로로-4-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.173
281	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;	0.130
282	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.011
283	4-사이클로프로필-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.169
284	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.094
285	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;	0.299
286	5-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.012
287	5-에틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.005
288	5-아이스프로필-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.040
289	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.037
290	4,5-다이메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.007
291	5-클로로-4-메틸-2-[[1-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.009
292	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.105
293	5-브로모-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.039
294	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
295	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.061
296	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.012
297	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.005
298	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.034
299	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.049

[2835]

실시에 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
300	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.008
301	2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.119
302	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.002
303	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.085
304	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.711
305	(R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;	0.496
306	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.003
307	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;	0.033
308	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;	0.003
309	1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.010
310	(R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.037
311	(R/S)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시에틸)피리미딘;	1.580
312	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.004
313	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.005
314	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.006
315	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.158
316	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.183
317	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.026
318	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.026
319	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.015
320	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.061
321	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.104
322	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.011
323	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.788
324	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.494

[2836]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
325	2-[[1-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.027
326	5-클로로-2-[[1-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.069
327	2-[[1-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.015
328	2-[[1-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.029
329	2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.854
330	2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.752
331	2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.098
332	5-클로로-2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.200
333	2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.087
334	2-[[1-4-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.051
335	2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	3.120
336	5-플루오로-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	11.301
337	5-메톡시-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>10
338	5-클로로-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	9.049
339	5-메틸-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.130
340	5-에틸-2-[[1-4-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.794
341	2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.538
342	5-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.017
343	5-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.040
344	1-[2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.062
345	2-[2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.284
346	4-(메톡시메틸)-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.202
347	4-메틸-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.137
348	5-플루오로-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.447
349	5-메톡시-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.013
350	5-클로로-2-[[1-3-(트라이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.050

[2837]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
351	5-에틸-2-[[1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.015
352	N-메틸-2-[[1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.068
353	2-[[1-(3-(트라이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.525
354	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.073
355	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.238
356	5-클로로-2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.185
357	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.350
358	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.726
359	2-[[1-(2,2-다이플루오로-1,3-벤조다이옥솔-5-일)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.009
360	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.791
361	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.587
362	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.032
363	5-클로로-2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.118
364	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.027
365	2-[[1-(3,5-다이메틸페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.022
366	2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.020
367	5-클로로-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘;	0.053
368	2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.114
369	2-[2-(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.175
370	4-(다이플루오로메틸)-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]피리미딘;	0.397
371	5-클로로-2-[(1-인단-5-일트라이아졸-4-일)메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.039
372	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.008
373	2-[[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.010
374	2-[(1R)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.011
375	5-클로로-2-[(1R)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.010
376	2-[(1R)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.011
377	2-[(1R)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.010
378	2-[(1S)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	2.300
379	5-클로로-2-[(1S)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]피리미딘;	0.575
380	2-[(1S)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.237
381	2-[(1S)-1-[1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)트라이아졸-4-일]에톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.196

[2838]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
382	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.021
383	[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.008
384	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.018
385	2-[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.028
386	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-4-아이소프로폭시피리미딘;	0.504
387	메틸 2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-카복실레이트;	0.068
388	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-(2,2-다이플루오로에틸)-5-플루오로-피리미딘-4-아민;	0.842
389	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.033
390	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;	0.006
391	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.022
392	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.017
393	2-((1-(4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.037
394	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메톡시)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-플루오로-피리딘;	0.437
395	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-(트라이플루오로메틸)피리딘;	0.919
396	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피라진;	0.647
397	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-티에닐)피라진;	10.700
398	5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
399	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.023
400	[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.036
401	2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.017
402	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.051
403	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.199
404	(R/S)-2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;	0.482
405	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
406	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.001

[2839]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
407	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.001
408	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.002
409	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복스아미드;	0.149
410	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-카르복스아미드;	>2.99
411	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-5-메틸-피리미딘;	0.021
412	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.124
413	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.015
414	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.122
415	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.008
416	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.010
417	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.006
418	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;	0.271
419	5-(3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.029
420	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로-3-메틸아제티딘-1-일)피리미딘;	0.260
421	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-5-(3-(다이플루오로메틸)아제티딘-1-일)피리미딘;	0.227
422	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)-5-(3-다이플루오로피롤리딘-1-일)피리미딘;	0.068
423	5-사이클로프로필-2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.005
424	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-(2-푸릴)피리미딘;	0.141
425	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로-페닐)-5-요오도-트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.394
426	[3H]-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일-5-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	
427	3-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.897
428	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리딘;	0.796
429	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.665
430	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;	0.110
431	2-[[1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.101

[2840]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
432	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.528
433	2-[6-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-피리딘]프로판-2-올;	1.114
434	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피라진;	6.390
435	2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.098
436	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘;	3.260
437	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;	0.071
438	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.094
439	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.013
440	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.098
441	(R/S)-1,1,1-트라이플루오로-2-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.412
442	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;	0.072
443	5-에톡시-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.004
444	5-클로로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.013
445	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.006
446	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.001
447	1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.014
448	(R/S)-1-[2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.031
449	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.034
450	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.030
451	5-플루오로-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.298
452	2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-5-카르복사미드;	0.218
453	5-사이클로프로필-2-[[1-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.022
454	5-브로모-2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.013
455	2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.034

[2841]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
456	4-(2-((1-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)모르폴린;	0.500
457	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-메틸피리미딘;	0.296
458	2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-4-메틸피리미딘-5-아민;	0.439
459	2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-5-아민;	0.126
460	2-((1-(3-(트라이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-메톡시아제티딘-1-일)피리미딘;	0.726
461	5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.070
462	4-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리미딘;	3.030
463	5-클로로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.647
464	2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.515
465	5-플루오로-2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	3.720
466	2-[2-[[1-(3-플루오로-2-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	7.010
467	2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.711
468	5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.250
469	2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	1.058
470	5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.659
471	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.729
472	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.149
473	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.072
474	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.022
475	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.001
476	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.002
477	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.001
478	5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.001
479	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.036
480	2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.001
481	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.002
482	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.001
483	5-(2-플루오로에톡시)-2-[[1-(4-플루오로-3-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.007
484	2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	1.000
485	5-클로로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	1.010

[2842]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
486	5-플루오로-2-[[1-(2-플루오로-5-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	>2.99
487	5-플루오로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	16.199
488	2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	2.650
489	5-클로로-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	4.420
490	2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	2.440
491	5-에틸-2-[[1-(4-플루오로-2-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.170
492	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	0.026
493	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.004
494	5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
495	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-에틸-피리미딘;	0.010
496	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이스프로필-피리미딘;	0.114
497	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;	0.028
498	[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.019
499	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.016
500	2-[[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.068
501	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.052
502	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-아민;	0.136
503	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.008
504	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-N-에틸피리미딘-4-아민;	0.007
505	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.007
506	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-페닐-피리미딘;	9.750
507	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.008
508	5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.019
509	4-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.003
510	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.025
511	4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.041

[2843]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
512	(R)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]피리미딘;	0.308
513	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.004
514	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.005
515	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.099
516	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;	0.017
517	N-(2,2-다이플루오로에틸)-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘-4-아민;	0.912
518	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.092
519	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;	0.204
520	1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)-N-메틸메탄아민;	0.672
521	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.021
522	1-(2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일)에탄올;	0.093
523	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.114
524	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.028
525	5-브로모-2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.040
526	2-[2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.425
527	2-[[1-[3-(다이플루오로메톡시)-4-메틸-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.132
528	2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.752
529	5-클로로-2-[[1-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-5-메틸-트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.320
530	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.005
531	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.017
532	2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.081
533	[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.017
534	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.003
535	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.009
536	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.067

[2844]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
537	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.016
538	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.318
539	(R/S)-2-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;	0.450
540	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.019
541	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메톡시-피리미딘;	0.012
542	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;	0.012
543	5-클로로-2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.015
544	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.015
545	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.006
546	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,6-다이메틸-피리미딘;	0.024
547	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.033
548	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.055
549	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.094
550	1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.016
551	(R/S)-1-[2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.014
552	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;	0.086
553	2-[[1-[4-클로로-3-(1,1-다이플루오로에틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.043
554	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리딘;	1.640
555	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-3-플루오로-피리딘;	0.265
556	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-6-메틸-피리딘;	0.098
557	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리딘;	0.246
558	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리딘;	0.125
559	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리딘;	0.812
560	6-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2,3-다이메틸-피리딘;	0.052
561	3-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-2-메톡시-피리딘;	0.476

[2845]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
562	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.014
563	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.048
564	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.272
565	(R/S)-2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]-1,1,1-트라이플루오로-프로판-2-올;	0.308
566	2-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.008
567	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(1-메톡시-1-메틸-에틸)피리미딘;	4.630
568	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.025
569	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(메톡시메틸)피리미딘;	0.089
570	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.011
571	[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.021
572	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(다이플루오로메톡시)피리미딘;	0.025
573	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.019
574	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.010
575	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.006
576	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.017
577	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,5-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.128
578	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.140
579	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;	0.087
580	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-아민;	0.088
581	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N-메틸-피리미딘-4-아민;	0.033
582	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.028
583	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-카르보니트릴;	0.067
584	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸설포닐-피리미딘;	0.199
585	1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.011
586	(R/S)-1-[2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]에탄올;	0.014

[2846]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
587	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.041
588	5-(아제티딘-1-일)-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.034
589	2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리미딘;	0.013
590	2-((1-(3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N,N-다이메틸피리미딘-5-아민;	0.039
591	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.016
592	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]트리아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딘)피리미딘;	0.271
593	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.486
594	5-사이클로프로필-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.171
595	2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4,5-다이메틸-피리미딘;	0.706
596	5-클로로-2-[[1-[3-(1,1-다이플루오로에틸)-4-플루오로-페닐]-5-메틸-트리아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.601
597	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	2.100
598	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	1.450
599	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메톡시-피리미딘;	0.034
600	5-클로로-2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.238
601	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.048
602	2-[[1-(3,4-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.023
603	2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	10.430
604	2-[2-[[1-(2,5-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	79.708
605	5-클로로-2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	4.360
606	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	17.499
607	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	3.425
608	2-[2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	>10
609	2-[[1-(2,3-다이플루오로페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	15.900
610	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	1.034
611	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>10
612	5-클로로-2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.737
613	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	1.441
614	2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-피리미딘;	4.032
615	2-[2-[[1-(3-클로로-2-플루오로-페닐)트리아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	4.658

[2847]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
616	[2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.030
617	[2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.041
618	2-[[1-(3-브로모-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;	0.006
619	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.217
620	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.008
621	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.003
622	2-[[1-(3-클로로-4-플루오로-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.066
623	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;	0.129
624	[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]메탄올;	0.020
625	[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-4-일]메탄올;	0.017
626	2-[2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.067
627	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.038
628	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(다이플루오로메틸)피리미딘;	0.042
629	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N-다이메틸-피리미딘-4-아민;	0.007
630	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-사이클로프로필-피리미딘;	0.013
631	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-사이클로프로필-피리미딘;	0.042
632	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.004
633	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-N,N,5-트라이메틸-피리미딘-4-아민;	0.057
634	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-피롤리딘-1-일-피리미딘;	0.012
635	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-4-(1-피페리딜)피리미딘;	0.169
636	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(2-플루오로에톡시)피리미딘;	0.010
637	2-[[1-[4-클로로-3-(다이플루오로메틸)페닐]트라이아졸-4-일]메톡시]-5-(3-플루오로프로필)피리미딘;	0.011
638	2-((1-(4-(아제티딘-1-일)-3-(다이플루오로메틸)페닐)-1H-1,2,3-트라이아졸-4-일)메톡시)-5-메틸피리미딘;	0.511
639	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-5-아이소프로필-피리미딘;	0.052
640	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트라이아졸-4-일]메톡시]-4-아이소프로필-피리미딘;	1.980

[2848]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
641	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.111
642	4-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	2.210
643	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.200
644	2-[2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘-5-일]프로판-2-올;	0.967
645	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.799
646	5-(다이플루오로메톡시)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.099
647	5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.034
648	4-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.592
649	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-플루오로-4-메틸-피리미딘;	0.152
650	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.005
651	2-[[1-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘-4-아민;	0.262
652	2-[[1-(3-(다이플루오로메틸)-2,4-다이플루오로-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-(트라이플루오로메틸)피리미딘;	0.112
653	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.490
654	2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-메틸-피리미딘;	0.979
655	2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.507
656	5-(다이플루오로메틸)-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	1.510
657	5-클로로-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]-4-메틸-피리미딘;	0.781
658	5-사이클로프로필-2-[[1-(2,4-다이플루오로-5-메틸-페닐)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.424
659	5-클로로-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>2.99
660	5-에틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>2.99
661	5-클로로-4-메틸-2-[[1-(6-메틸-2-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>2.99
662	5-메틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	>2.99
663	5-에틸-2-[[1-(4-메틸-2-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	2.450
664	5-에틸-2-[[1-(2-메틸-4-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.169
665	2-[[1-(2-브로모-4-피리딜)트리아아졸-4-일]메톡시]-5-에틸-피리미딘;	0.261
666	5-메틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.668
667	5-에틸-2-[[1-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]트리아아졸-4-일]메톡시]피리미딘;	0.184
668	5-플루오로-4-메틸-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아아졸-4-일)메톡시)피리미딘	0.008

[2849]

실시예 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
669	5-메톡시-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.004
670	5-(트라이플루오로메틸)-2-((1-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.063
671	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;	0.126
672	5-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
673	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;	NT
674	5-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
675	2-(아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
676	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-6-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;	NT
677	2-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-6-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
678	4-(아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
679	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(3-플루오로아제티딘-1-일)피리딘;	NT
680	4-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리딘;	NT
681	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피콜-2-일)피리미딘;	0.681
682	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;	NT
683	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피콜-2-일)피리미딘;	NT
684	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;	NT
685	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-N-에틸-5-플루오로피리미딘-4-아민;	NT
686	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-N-(옥세탄-3-일)피리미딘-4-아민;	NT
687	N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-아민;	NT
688	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;	NT
689	N-(3,3-다이플루오로사이클로부틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;	NT
690	N-사이클로프로필-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;	0.008
691	N-에틸-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-아민;	0.006
692	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘;	1.580

[2850]

실시에 번호	화합물명	NR2B IC ₅₀ (μM) 표준 분석
693	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(2-메틸-1H-이미다졸-1-일)피리미딘;	NT
694	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;	NT
695	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-5-일)피리미딘;	NT
696	4-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.958
697	4-((다이플루오로메톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	NT
698	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;	NT
699	2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1H-피라졸-1-일)피리미딘;	0.389
700	(E)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-5-일)에탄-1-온 옥실;	NT
701	5-(1,1-다이플루오로에틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘;	0.958
702	(Z)-1-(2-((1-(3-(다이플루오로메틸)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-온 옥실;	NT
703	(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로피리미딘-4-일)메탄올;	NT
704	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)-5-플루오로피리미딘;	NT
705	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((다이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;	NT
706	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-5-플루오로-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;	NT
707	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((트라이플루오로메톡시)메틸)피리미딘;	NT
708	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸-d2)피리미딘;	NT
709	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸-d2)피리미딘;	NT
710	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-((메톡시-d3)메틸)피리미딘;	NT
711	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(메톡시메틸)피리미딘;	0.043
712	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(1-메톡시에틸)피리미딘;	NT
713	1-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)에탄-1-올;	NT
714	2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)-4-(2-메톡시프로판-2-일)피리미딘;	NT
715	2-(2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘-4-일)프로판-2-올; 및	NT
716	4-(2,2-다이플루오로에톡시)메틸)-2-((1-(3-(다이플루오로메톡시)-4-플루오로페닐)-1H-1,2,3-트리아졸-4-일)메톡시)피리미딘.	0.049

NT는 미시험을 의미함.

[2851]