	(19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)	(11) 공개번호 10-2018-0026760 (43) 공개일자 2018년03월13일
(51) 국제특허분류(Int. Cl.) <i>C07D 471/04</i> (2006.01) <i>A61K 31/437</i> (2006.01) <i>A61P 25/00</i> (2006.01) <i>A61P 25/28</i> (2006.01) (52) CPC특허분류 <i>C07D 471/04</i> (2013.01) <i>A61K 31/437</i> (2013.01) (21) 출원번호 10-2018-7003560 (22) 출원일자(국제) 2016년07월07일 심사청구일자 없음 (85) 번역문제출일자 2018년02월05일 (86) 국제출원번호 PCT/US2016/041339 (87) 국제공개번호 WO 2017/007938 국제공개일자 2017년01월12일 (30) 우선권주장 62/190,416 2015년07월09일 미국(US)		(71) 출원인 얀센 파마슈티카 엔.브이. 벨기에왕국 베-2340-비어제 투른호우트세베크 30 (72) 발명자 크로비안 크리스타 씨. 미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로 우 3210 레타빅 마이클 에이. 미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로 우 3210 (뒷면에 계속) (74) 대리인 특허법인한성

전체 청구항 수 : 총 33 항

(54) 발명의 명칭 치환된 4-아자인돌 및 GLUN2B 수용체 조절제로서의 이의 용도

### (57) 요약

NR2B 수용체 리간드로서의 치환된 4-아자인돌. 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 25/00* (2018.01)

*A61P 25/28* (2018.01)

(72) 발명자

**레쉬 제이슨 씨.**

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로  
우 3210

**소요데-존슨 아키놀라**

미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로  
우 3210

---

**월 제시카 엘.**

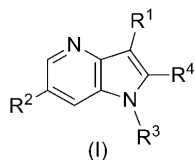
미국 92121 캘리포니아주 샌디에이고 메리필드 로  
우 3210

## 명세서

## 청구범위

### 청구항 1

화합식 (I)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:

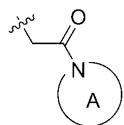


상기 식에서,

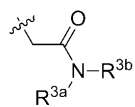
$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 및  $C_{1-3}$ 할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원(member)으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및 -CN으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

$R^3$ 는,





(a) (여기서, 고리 A는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $CH_2OH$ ,  $C_{1-5}$ 알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아세티디닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의  $C_{1-5}$ 알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);



(b) (여기서,  $R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;  $R^{3b}$ 는 OH, 할로 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $C_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $CH_2$ 사이클로프로필;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);

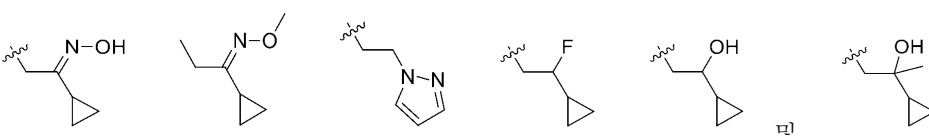
(c) (여기서,  $R^{3c}$ 는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐;  $C_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 옥사다이아졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(d)  (여기서,  $R^{3d}$ 는  $\text{CH}_2$ -사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);

(e)  (여기서,  $R^{3e}$ 는 OH,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(f) OH 또는  $\text{C}_{1-5}$ 알콕시로 임의로 치환되는  $\text{C}_{1-5}$ 알킬;  $\text{CH}_2\text{S}(\text{CH}_3)$ ;  $\text{CH}_2(\text{S}=\text{O})\text{CH}_3$ ;  $\text{CH}_2(\text{SO}_2)\text{CH}_3$ ; 및  $\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{CH}_3$ ; 또는

(g)

로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^4$ 는 H,  $^2\text{H}$  또는  $\text{C}_{1-3}$ 알킬이다.

## 청구항 2

제1항에 있어서,  $R^1$ 은 H, Cl, Br, F 또는  $\text{CH}_3$ 인 화합물.

## 청구항 3

제1항에 있어서,  $R^1$ 은 H인 화합물.

## 청구항 4

제1항에 있어서,  $R^1$ 은 Cl인 화합물.

## 청구항 5

제1항에 있어서,  $R^1$ 은  $\text{CH}_3$ 인 화합물.

## 청구항 6

제1항에 있어서,  $R^2$ 는 Cl, F,  $\text{CH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $\text{CF}_2\text{H}$  및  $\text{CF}_3$ 로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; F, CN,  $\text{CH}_3$  및  $\text{CF}_3$ 로 임의로 치환되는 피리디닐;  $\text{CH}_3$ 로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 Cl,  $\text{CH}_3$ ,  $\text{CH}_2\text{CH}_3$ ,  $\text{CHF}_2$  및  $\text{CF}_3$ 로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐인 화합물.

## 청구항 7

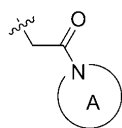
제1항에 있어서,  $R^2$ 는 페닐, 2-메틸페닐, 3-메틸페닐, 4-메틸페닐, 3-에틸페닐, 3-(다이플루오로메틸)페닐, 3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3,5-다이메틸페닐, 2,3-다이메틸페닐, 2-플루오로페닐, 3-플루오로페닐, 3-클로로페닐, 4-플루오로페닐, 2,3-다이플루오로페닐, 2,4-다이플루오로페닐, 3,4-다이플루오로페닐, 3,4-다이클로로페닐, 2,5-다이플루오로페닐, 3,5-다이플루오로페닐, 3-클로로-2-플루오로-페닐, 3-클로로-4-플루오로-페닐, 2-플루오로-3-메틸-페닐, 4-플루오로-2-메틸-페닐, 2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐, 2-플루오로-5-메틸-페닐, 4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐, 2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐, 2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐,

2,3,4-트라이플루오로페닐, 3,4,5-트라이플루오로페닐, 2-티에닐, 3-티에닐, 5-메틸-2-티에닐, 4-메틸-2-티에닐, 5-에틸-2-티에닐, 5-클로로-2-티에닐, 3-클로로-2-티에닐, 4-클로로-2-티에닐, 5-클로로-3-티에닐, 5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐, 5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐, 2,5-다이하이드로-3-티에닐, 5-클로로-4-메틸-2-티에닐, 2,4,5-트라이메틸-3-티에닐, 6-티아졸-5-일, 2-메틸티아졸-5-일, 6-메틸-3-피리딜, 6-플루오로-3-피리딜, 피리딘-2-카르보니트릴, 2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜, 5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜, 6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜 또는 벤조티오펜-2-일인 화합물.

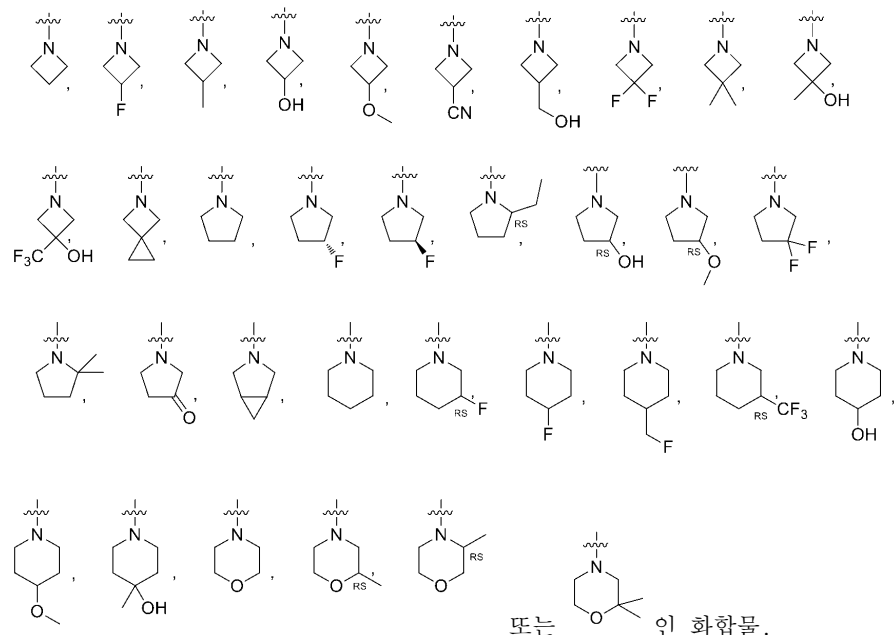
#### 청구항 8

제1항에 있어서,  $R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐 또는 티에닐인 화합물.

#### 청구항 9

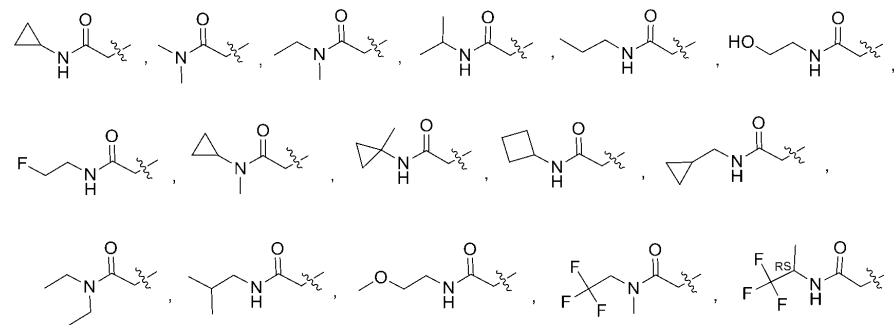


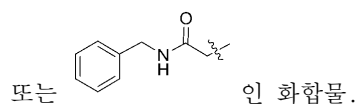
제1항에 있어서,  $R^3$ 는 이고, 여기서 고리 A는



#### 청구항 10

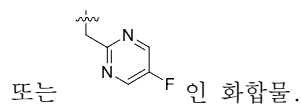
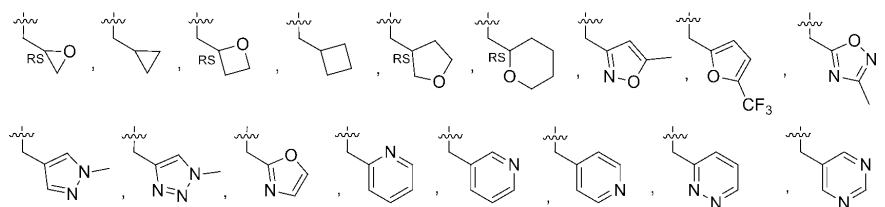
제1항에 있어서,  $R^3$ 는



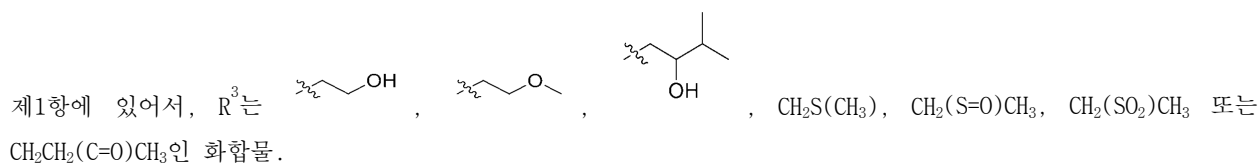


#### 청구항 11

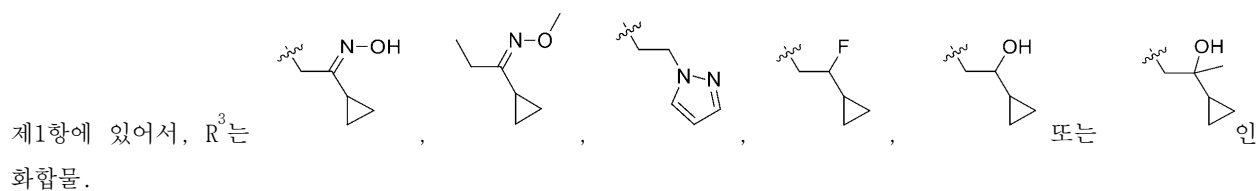
제1항에 있어서, R<sup>3</sup>는



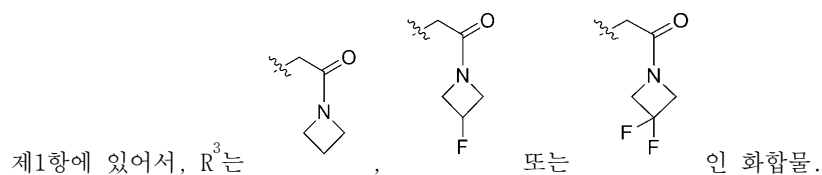
#### 청구항 12



#### 청구항 13



#### 청구항 14



#### 청구항 15

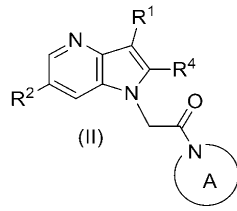
제1항에 있어서, R<sup>4</sup>는 H인 화합물.

#### 청구항 16

제1항에 있어서, R<sup>4</sup>는 CH<sub>3</sub>인 화합물.

#### 청구항 17

제1항에 있어서, 화학식 (II)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:

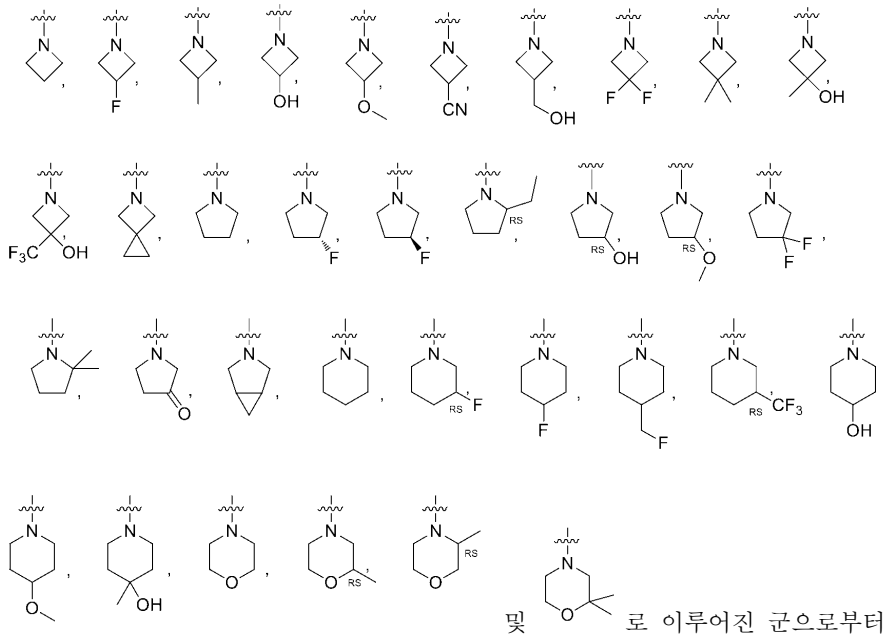


상기 식에서,

$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로 및  $C_{1-3}$ 알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및 CN으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 및 할로 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

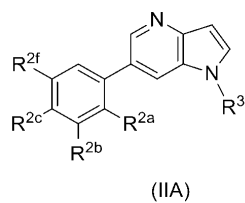
고리 A는



$R^4$ 는 H,  $^2H$  또는  $CH_3$ 이다.

#### 청구항 18

제1항에 있어서, 화학식 (IIA)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:



상기 식에서,

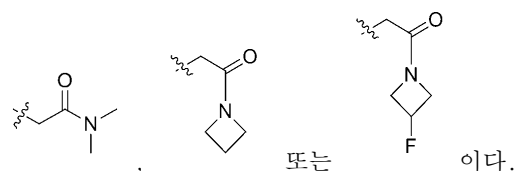
$R^{2a}$ 는 H 또는 F이고;

$R^{2b}$ 는 H, F,  $CH_3$  또는  $CH_2CH_3$ 이며;

$R^{2c}$ 는 H, F 또는  $CH_3$ 이고;

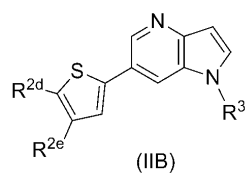
$R^{2f}$ 는 H, F 또는  $CH_3$ 이며;

$R^3$ 는



#### 청구항 19

제1항에 있어서, 화학식 (IIB)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:

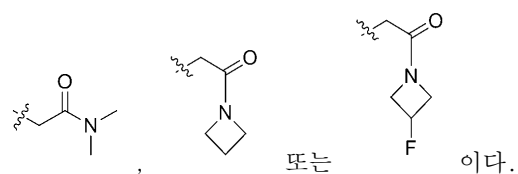


상기 식에서,

$R^{2d}$ 는 H, Cl,  $CH_3$  또는  $CF_3$ 이고;

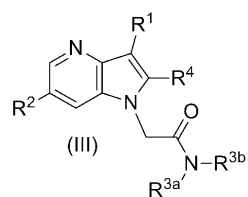
$R^{2e}$ 는 H 또는  $CH_3$ 이며;

$R^3$ 는



#### 청구항 20

제1항에 있어서, 화학식 (III)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:



상기 식에서,

$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 또는  $C_{1-3}$ 할로알킬이고;



$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐;  $C_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 피리디닐; 벤조티오펜; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 또는  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

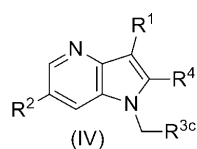
$R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;

$R^{3b}$ 는 OH 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $C_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $CH_2$ 사이클로프로필;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택되며;

$R^4$ 는 H,  $H^2$  또는  $CH_3$ 이다.

## 청구항 21

제1항에 있어서, 화학식 (IV)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:

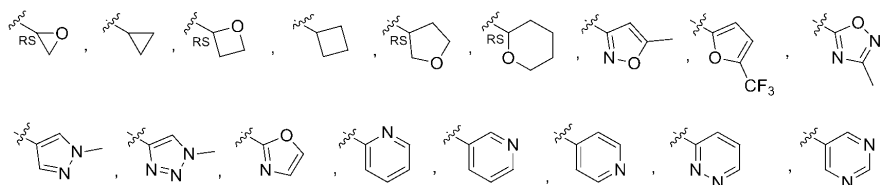


상기식에서,

$R^1$ 은 H 또는 할로이고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 치환되는 티에닐이며;

$R^{3c}$ 는

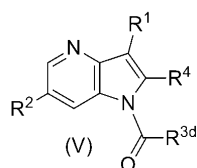


또는 이고;

$R^4$ 는 H이다.

## 청구항 22

제1항에 있어서, 화학식 (V)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:



상기 식에서,

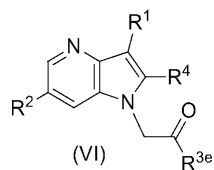
$R^1$  및  $R^4$ 는 H이고;

$R^2$ 는 2개의 할로로 임의로 치환되는 페닐이며;

$R^{3d}$ 는 사이클로부틸 또는  $CH_2$ -사이클로프로필이다.

### 청구항 23

제1항에 있어서, 화학식 (VI)의 구조를 갖는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 용매화물 또는 N-옥사이드:



상기 식에서,

$R^1$ 은 H 또는 할로이고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 또는 할로 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 치환되는 티에닐이며;

$R^{3e}$ 는 OH,  $C_{1-5}$ 알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^4$ 는 H 또는  $CH_3$ 이다.

### 청구항 24

2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;

2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;

2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

N-사이클로프로필-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;

2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

N-사이클로프로필-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-(2-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;

2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

3-[[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸;

5-메틸-3-[[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸;

5-메틸-3-[[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

5-메틸-3-[[6-(o-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

3-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

3-[[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

3-[[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

N-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(p-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

N-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

N-사이클로프로필-2-[6-(p-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 1-모르폴리노-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;  
 2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 1-모르폴리노-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-모르폴리노-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 N-사이클로프로필-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-메틸-3-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 5-[1-[2-(아제티딘-1-일)-2-옥소-에틸]피콜로[3,2-b]피리딘-6-일]피리딘-2-카르보니트릴;

6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리미딘-5-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;  
 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[(5-플루오로피리미딘-2-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;  
 사이클로부틸-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-사이클로프로필-1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;  
 1-피롤리딘-1-일-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 1-모르폴리노-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-모르폴리노-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 6-(4-메틸-2-티에닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;  
 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;  
 2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 6-(4-메틸-2-티에닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;  
 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;  
 N,N-다이메틸-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;  
 1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;  
 1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;  
 3,3-다이메틸-1-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;  
 1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;  
 1-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;  
 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

- 2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- N-사이클로프로필-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로아세테이트  
염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로아세테이트  
염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로아세테이트    염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로아세테이트  
염;
- N-사이클로프로필-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플  
루오로아세테이트    염;
- N-사이클로프로필-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드      트라이플루오로아세테이트    염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로  
아세테이트    염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(o-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
- N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드      트라이플루오로아세테  
이트    염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(o-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아세테이트    염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아세테이트  
염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아세  
테이트    염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아세테이트    염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아세테  
이트    염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로  
아세테이트    염;
- N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온      트라이플루오로아  
세테이트    염;
- 1-부틸-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘      트라이플루오로아세테이트    염;
- 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-아이소헨틸-피롤로[3,2-b]피리딘      트라이플루오로아세테이트    염;
- 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(3-피리딜메틸)피롤로[3,2-b]피리딘      트라이플루오로아세테이트    염;
- 1-(사이클로부틸메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘      트라이플루오로아세테이트    염;
- 1-(사이클로프로필메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘      트라이플루오로아세테이트    염;
- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드      트라이플루오로아세테이  
트    염;
- 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드      트라이플루

오로아세테이트 염;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(테트라하이드로푸란-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥시란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피라졸-1-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리미딘-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥세탄-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-1-(3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-메톡시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-플루오로-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[4-(플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(2-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(트라이플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-1-(2-에틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(2,2-다이메틸모르폴린-4-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시피롤리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(2,2-다이메틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;



- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피콜리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시-3-메틸-아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-하이드록시-3-(트라이플루오로메틸)아제티딘-1-일]에탄온;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(하이드록시메틸)아제티딘-1-일]에탄온;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;
- 1-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-4-메틸-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
- (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;
- 1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]아제티딘-3-카르보니트릴;
- 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸아제티딘-1-일)에탄온;
- 1-(3,3-다이메틸아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]피콜리딘-3-온 트라이플루오로아세테이트 염;
- 1-(3,3-다이플루오로피콜리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- (R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시피콜리딘-1-일)에탄온;
- 1-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-사이클로프로필-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
- 1-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
- 1-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
- 1-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-페닐-에탄온;
- 1-(4-플루오로페닐)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- (R/S)-6-(4-플루오로페닐)-1-(테트라하이드로피란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소프로필-아세트아미드;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-프로필-아세트아미드;
- (R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2,2,2-트라이플루오로-1-메틸-에틸)아세트아미드;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(1-메틸사이클로프로필)아세트아미드;

N-(2-플루오로에틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소부틸-아세트아미드;  
 5-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;  
 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 N-(사이클로프로필메틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸트리아졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 5-[[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;  
 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로부틸-에탄온;  
 1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 N-사이클로프로필-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-벤질-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 2-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]옥사졸;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-하이드록시에틸)아세트아미드;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-메톡시에틸)아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세트레이트 염;

- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온  
트라이플루오로아세테이트 염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세테이트  
염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로  
아세테이트 염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루  
오로아세테이트 염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세테이트 염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온  
트라이플루오로아세테이트 염;
- 2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온   트라이플루오로아세테이트  
염;
- 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
- 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-  
1-일]에탄온;
- (R/S)-1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-올;
- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;
- (R/S)-1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올;
- (R/S)-2-사이클로프로필-1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]프로판-2-올   트라이플루오로  
아세테이트 염;
- 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메톡시-에탄아민;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-피콜리딘-1-일-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
- 2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
- 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   옥심   트라이플루오로아세테  
이트 염;
- 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
- 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
- (R/S)-1-(2-사이클로프로필-2-플루오로-에틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘;
- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-메톡시에틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트이트 염;  
 1-사이클로부틸-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염;  
 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3S)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염;  
 1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온 트라이플루오로아세트이트 염;  
 N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;  
 N,N-다이에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;  
 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-사이클로프로필-에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;

(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설피닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;

6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설폴닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;

1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

4-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드   트라이플루오로아세테이트 염;

N-사이클로프로필-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드   트라이플루오로아세테이트 염;

N-사이클로프로필-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드   트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온   트라이플루오

오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딘]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N-사이클로프로필-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

N,N-다이메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

N,N-다이메틸-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
- 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
- 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- N,N-다이메틸-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-메틸티아졸-5-일)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-티아졸-5-일피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-플루오로-3-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
- 2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
- 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
- 2-[6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-(2,4,5-트라이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
2-[6-(5-클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(2,5-다이클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
2-[6-(2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(2-플루오로-5-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
N-에틸-N-메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;  
N-에틸-N-메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;



1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;

2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;

N-에틸-N-메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;

2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;

N-에틸-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

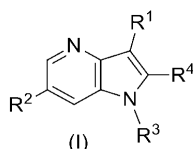
1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄  
 온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 N,N-다이메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;  
 N-에틸-N-메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미  
 드;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-  
 일]에탄온;  
 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 N-에틸-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리  
 딤-1-일]에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[3-클로로-6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(벤조티오펜-2-일)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-[3H]-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;  
 2-[2-듀테리오-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 3-클로로-1-(3-피리딜메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;  
 3-클로로-1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;  
 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;  
 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;  
 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;  
 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;  
 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;  
 N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;  
 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온; 및  
 2-[6-[5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물.

## 청구항 25

(A) 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물의 유효량; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물:

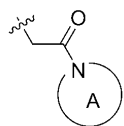


상기 식에서,

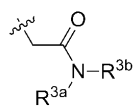
$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 및  $C_{1-3}$ 할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및 -CN으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

$R^3$ 는,





(a) (여기서, 고리 A는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $CH_2OH$ ,  $C_{1-5}$ 알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아제티디닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의  $C_{1-5}$ 알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 6원 헤테로사이클임);




(b) (여기서,  $R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;  $R^{3b}$ 는 OH, 할로 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;

C<sub>1-5</sub>할로알킬; 벤질; CH<sub>2</sub>사이클로프로필; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);

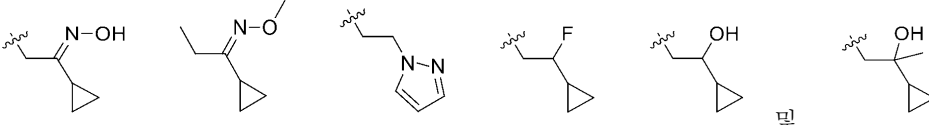
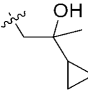
(c)  (여기서, R<sup>3c</sup>는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐; C<sub>1-5</sub>할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(d)  (여기서, R<sup>3d</sup>는 CH<sub>2</sub>-사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);

(e)  (여기서, R<sup>3e</sup>는 OH, C<sub>1-5</sub>알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(f) OH 또는 C<sub>1-5</sub>알콕시로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; CH<sub>2</sub>S(CH<sub>3</sub>); CH<sub>2</sub>(S=O)CH<sub>3</sub>; CH<sub>2</sub>(SO<sub>2</sub>)CH<sub>3</sub>; 및 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(C=O)CH<sub>3</sub>; 또는

(g)

 및  로 이루어진 군으로부터 선택되고;

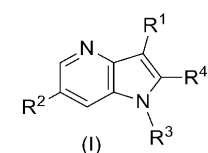
R<sup>4</sup>는 H, <sup>2</sup>H 또는 C<sub>1-3</sub>알킬이다.

## 청구항 26

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

## 청구항 27

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 염, 용매화물 또는 N-옥사이드의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법:



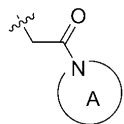
상기 식에서,

R<sup>1</sup>은 H, <sup>3</sup>H, 할로, C<sub>1-3</sub>알킬 및 C<sub>1-3</sub>할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

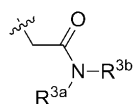
R<sup>2</sup>는 할로, C<sub>1-5</sub>알킬 및 C<sub>1-5</sub>할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되

는 페닐; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬 및 -CN으로 임의로 치환되는 피리디닐; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 할로, C<sub>1-5</sub>알킬 및 C<sub>1-5</sub>할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

R<sup>3</sup>는,



(a) (여기서, 고리 A는 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬, CH<sub>2</sub>OH, C<sub>1-5</sub>알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아제티디닐; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의 C<sub>1-5</sub>알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬, C<sub>1-5</sub>알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);



(b) (여기서, R<sup>3a</sup>는 H 또는 C<sub>1-5</sub>알킬이고; R<sup>3b</sup>는 OH, 할로 또는 OCH<sub>3</sub>로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; C<sub>1-5</sub>할로알킬; 벤질; CH<sub>2</sub>사이클로프로필; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(c) (여기서, R<sup>3c</sup>는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐; C<sub>1-5</sub>할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);



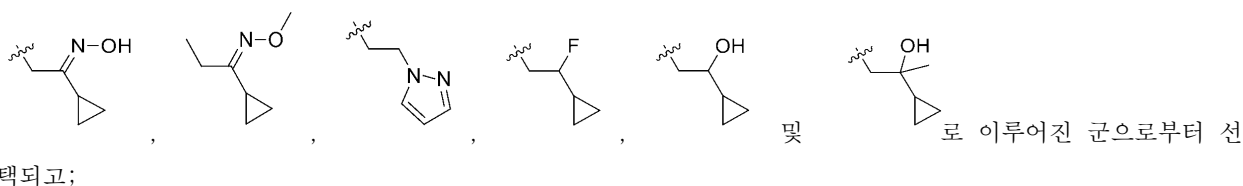
(d) (여기서, R<sup>3d</sup>는 CH<sub>2</sub>-사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);



(e) (여기서, R<sup>3e</sup>는 OH, C<sub>1-5</sub>알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(f) OH 또는 C<sub>1-5</sub>알콕시로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; CH<sub>2</sub>S(CH<sub>3</sub>); CH<sub>2</sub>(S=O)CH<sub>3</sub>; CH<sub>2</sub>(SO<sub>2</sub>)CH<sub>3</sub>; 및 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(C=O)CH<sub>3</sub>; 또는

(g)



택되고;

R<sup>4</sup>는 H, <sup>2</sup>H 또는 C<sub>1-3</sub>알킬이다.



## 청구항 28

제27항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 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 29

제27항에 있어서, GluN2B 수용체에 의해 매개되는 장애, 질환 또는 상태는 치료 저항성 우울증 및 주요 우울장애로 이루어진 군으로부터 선택되는 방법.

## 청구항 30

제28항에 있어서, 상기 질환 또는 장애는 중추신경계 장애인 방법.

## 청구항 31

제28항에 있어서, 상기 질환 또는 장애는 신경 또는 정신 장애인 방법.

## 청구항 32

제28항에 있어서, 상기 질환 또는 장애는 (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 33

제32항에 있어서, 상기 신경증성, 스트레스 관련 또는 신체형 장애는 불안장애이고; 상기 우발적 및 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 수용체의 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 활성화를 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.

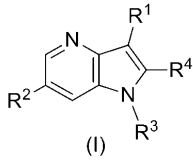
[0005] GluN2 서브유닛은 NMDA 수용체 어셈블리의 기능적 및 약리학적 특성을 결정하는데 지배적인 역할을 하며, 뇌의 다양한 영역에서 특이적인 분포를 나타낸다. 예를 들어, GluN2B 서브유닛은 주로 성체 포유류 뇌의 전뇌에서 발현되며 (문헌[Paoletti P et al., *Nat Rev Neurosci.* 2013; 14(6):383-400; Watanabe M et al., *J Comp Neurol.* 1993; 338(3):377-90]), 학습, 기억 처리, 기분, 주의력, 감정 및 통증 지각에 관여한다 (문헌[Cull-Candy 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[Naspolini 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, 수술 후 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[Guitton 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 홍반성 루푸스 (europsychiatric 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) (Nagy J, 2004, *Curr Drug Targets CNS Neurol Disord.* 2004; 3(3):169-79.; Shen H et al., *Proc Natl Acad Sci USA.* 2011;108(48):19407-12])를 포함하나 이에 한정되지 않는 많은 신경 및 정신 장애의 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 그 리고 바람직한 실시형태에 관한 것이다. 본 발명의 한 측면은 화학식 (I)의 화합물 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염에 관한 것이다:



[0009]

[0010]

[0011]

[0012]

[0013]

[0014]

[0015]

[0016]

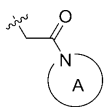
[0017]

상기 식에서,

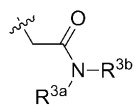
$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 및  $C_{1-3}$ 할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원(member)으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및  $-CN$ 으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

$R^3$ 는,



(a) (여기서, 고리 A는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $CH_2OH$ ,  $C_{1-5}$ 알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아세트디닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의  $C_{1-5}$ 알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);




(b) (여기서,  $R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;  $R^{3b}$ 는 OH, 할로 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $C_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $CH_2$ 사이클로프로필;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);



(c) (여기서,  $R^{3c}$ 는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐;  $C_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

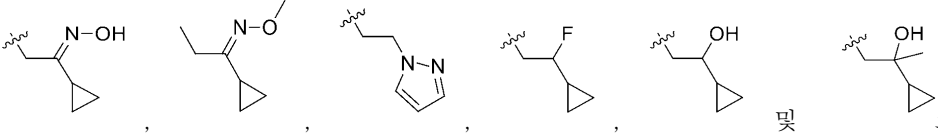


(d) (여기서,  $R^{3d}$ 는  $CH_2$ -사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);

[0018] (e)  (여기서, R<sup>3e</sup>는 OH, C<sub>1-5</sub>알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

[0019] (f) OH 또는 C<sub>1-5</sub>알콕시로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; CH<sub>2</sub>S(CH<sub>3</sub>); CH<sub>2</sub>(S=O)CH<sub>3</sub>; CH<sub>2</sub>(SO<sub>2</sub>)CH<sub>3</sub>; 및 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(C=O)CH<sub>3</sub>; 또는

[0020] (g)

[0021]  로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0022] R<sup>4</sup>는 H, <sup>2</sup>H 또는 C<sub>1-3</sub>알킬이다.

[0023] 추가의 실시형태는 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물에 의해 제공된다.

[0024] 특정 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 하기 상세한 설명에 기재되거나 예시된 이들 종류로부터 선택되는 화합물이다.

[0025] 추가의 측면에서, 본 발명은 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염뿐만 아니라, 이의 거울상 이성질체 및 부분입체 이성질체에 관한 것이다.

[0026] 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 활성화로 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 치료하기 위한 약제학적 조성물에 관한 것이다.

[0027] 본 발명에 따른 약제학적 조성물은 하나 이상의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 추가로 포함할 수 있다.

[0028] 다른 측면에서, 본 발명의 화학적 실시형태는 NR2B 수용체 조절제로서 유용하다. 따라서, 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 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량에 NR2B 수용체를 노출시키는 단계를 포함하는, 이러한 수용체가 대상에 존재하는 경우를 포함하여, NR2B 수용체 활성을 조절하는 방법에 관한 것이다.

[0029] 다른 측면에서, 본 발명은 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 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 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 실시형태가 상세한 설명에 기재되어 있다.

[0030] 추가의 측면에서, 본 발명은 대사 연구 (바람직하게는 <sup>14</sup>C를 사용함), 반응 속도론 연구 (예를 들어, <sup>2</sup>H 또는 <sup>3</sup>H를 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, <sup>18</sup>F 또는 <sup>11</sup>C 표지된 화합물은 PET 또는 SPECT 연구에 특히 바람직할 수 있다.

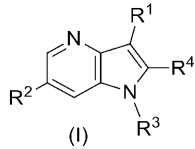
[0031] 본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (I)의 화합물, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I)의 약제학적으로 활성인 대사산물을 제조하는 방법을 포함한다.

[0032] 본 발명의 목적은 종래의 방법 및/또는 종래 기술의 단점 중 적어도 하나를 해소하거나 개선하거나, 이에 대한 유용한 대안을 제공하는 것이다.

[0033] 본 발명의 추가의 실시형태, 특징 및 이점은 하기 상세한 설명 및 본 발명의 실시를 통해 명백해질 것이다.

### 발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0034] 한 측면에서, 화학식 (I)의 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이 본 명세서에 제공된다:



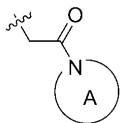
[0035]

[0036] 상기 식에서,

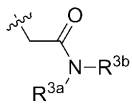
[0037]  $R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 및  $C_{1-3}$ 할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0038]  $R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및  $-CN$ 으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜릴; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0039]  $R^3$ 는,





[0040] (a) (여기서, 고리 A는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $CH_2OH$ ,  $C_{1-5}$ 알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아제티디닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의  $C_{1-5}$ 알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬,  $C_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);



[0041] (b) (여기서,  $R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;  $R^{3b}$ 는 OH, 할로 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $C_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $CH_2$ 사이클로프로필;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);

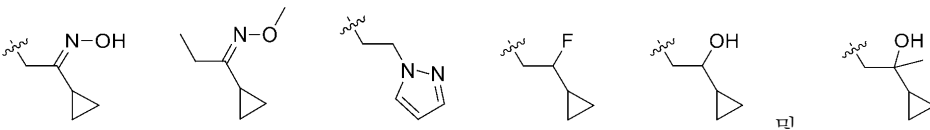
[0042] (c)  $R^{3c}$  (여기서,  $R^{3c}$ 는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐;  $C_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

[0043]  (여기서, R<sup>3d</sup>는 CH<sub>2</sub>-사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);

[0044] (e)  (여기서, R<sup>3e</sup>는 OH, C<sub>1-5</sub>알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

[0045] (f) OH 또는 C<sub>1-5</sub>알콕시로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; CH<sub>2</sub>S(CH<sub>3</sub>); CH<sub>2</sub>(S=O)CH<sub>3</sub>; CH<sub>2</sub>(SO<sub>2</sub>)CH<sub>3</sub>; 및 CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>(C=O)CH<sub>3</sub>; 또는

[0046] (g)

[0047]  , , , , , 및 로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0048] R<sup>4</sup>는 H, <sup>2</sup>H 또는 C<sub>1-3</sub>알킬이다.

[0049] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>1</sup>이 H, Cl, Br, F 또는 CH<sub>3</sub>인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0050] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>1</sup>이 H인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0051] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>1</sup>이 Cl인 화학식 (I)의 화합물이다.

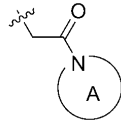
[0052] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>1</sup>이 CH<sub>3</sub>인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0053] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>2</sup>가 Cl, F, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>H 및 CF<sub>3</sub>로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; F, CN, CH<sub>3</sub> 및 CF<sub>3</sub>로 임의로 치환되는 피리디닐; CH<sub>3</sub>로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 Cl, CH<sub>3</sub>, CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>, CHF<sub>2</sub> 및 CF<sub>3</sub>로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐인 화학식 (I)의 화합물이다.

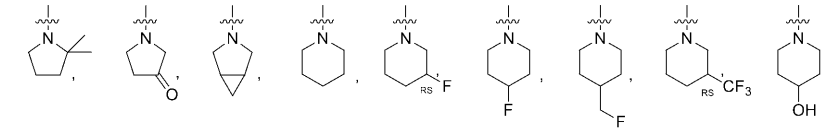
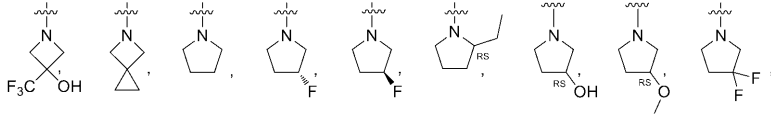
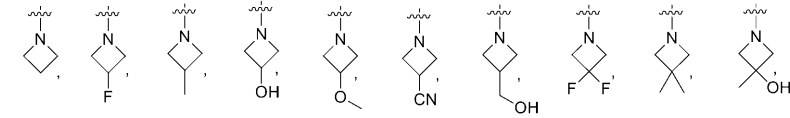
[0054] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>2</sup>가 페닐, 2-메틸페닐, 3-메틸페닐, 4-메틸페닐, 3-에틸페닐, 3-(다이플루오로메틸)페닐, 3-(트라이플루오로메틸)페닐, 3,5-다이메틸페닐, 2,3-다이메틸페닐, 2-플루오로페닐, 3-플루오로페닐, 3-클로로페닐, 4-플루오로페닐, 2,3-다이플루오로페닐, 2,4-다이플루오로페닐, 3,4-다이플루오로페닐, 3,4-다이클로로페닐, 2,5-다이플루오로페닐, 3,5-다이플루오로페닐, 3-클로로-2-플루오로-페닐, 3-클로로-4-플루오로-페닐, 2-플루오로-3-메틸-페닐, 4-플루오로-2-메틸-페닐, 2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐, 4-플루오로-3-메틸-페닐, 2-플루오로-5-메틸-페닐, 4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐, 2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐, 2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐, 2,3,4-트라이플루오로페닐, 3,4,5-트라이플루오로페닐, 2-티에닐, 3-티에닐, 5-메틸-2-티에닐, 4-메틸-2-티에닐, 5-에틸-2-티에닐, 5-클로로-2-티에닐, 3-클로로-2-티에닐, 4-클로로-2-티에닐, 5-클로로-3-티에닐, 5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐, 5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐, 2,5-다이메틸-3-티에닐, 2,5-다이클로로-3-티에닐, 5-클로로-4-메틸-2-티에닐, 2,4,5-트라이메틸-3-티에닐, 6-티아졸-5-일, 2-메틸티아졸-5-일, 6-메틸-3-피리딜, 6-플루오로-3-피리딜, 피리딘-2-카르보닐, 2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜, 5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜, 6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜 또는 벤조티오펜-2-일인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0055] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>2</sup>가 할로, C<sub>1-5</sub>알킬 및 C<sub>1-5</sub>할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐 또는 티에닐인 화학식 (I)의 화합물이다.

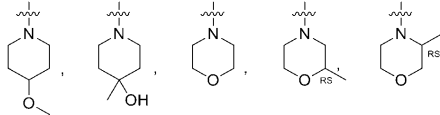




[0056] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>3</sup>가 (여기서, 고리 A는



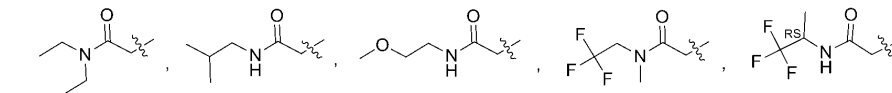
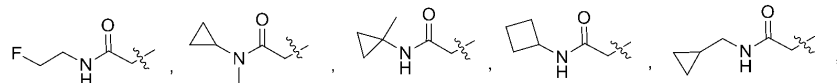
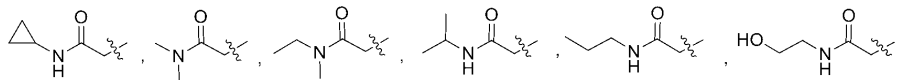
[0057]



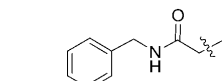
또는 (임)인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0058]

[0059] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>3</sup>가

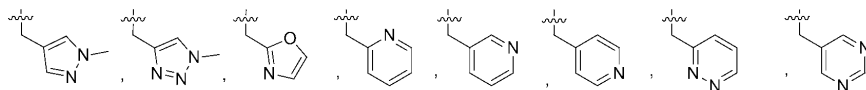
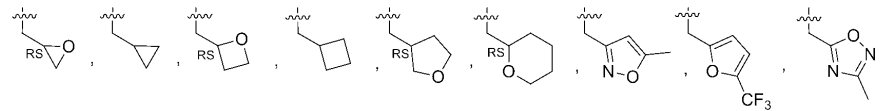


[0060]

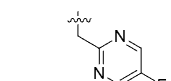


[0061] 또는 인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0062] 본 발명의 추가의 실시형태는 R<sup>3</sup>가

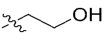
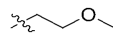
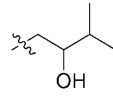


[0063]

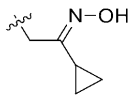
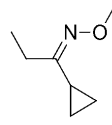
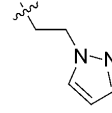
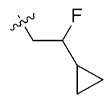
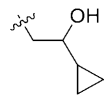
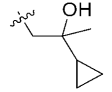


[0064] 또는 인 화학식 (I)의 화합물이다.

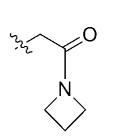
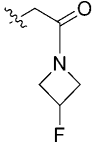
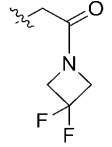
[0065]

본 발명의 추가의 실시형태는  $R^3$ 가 , , ,  $CH_2S(CH_3)$ ,  $CH_2(S=O)CH_3$ ,  $CH_2(SO_2)CH_3$  또는  $CH_2CH_2(C=O)CH_3$ 인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0066]

본 발명의 추가의 실시형태는  $R^3$ 가 , , , ,  또는 인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0067]

본 발명의 추가의 실시형태는  $R^3$ 가 ,  또는 인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0068]

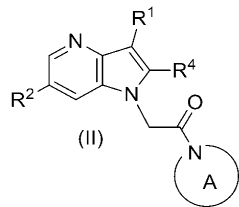
본 발명의 추가의 실시형태는  $R^4$ 가 H인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0069]

본 발명의 추가의 실시형태는  $R^4$ 가  $CH_3$ 인 화학식 (I)의 화합물이다.

[0070]

본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (II)을 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (II)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



[0071]

상기 식에서,

[0072]

$R^1$ 은 H,  $^3H$ , 할로 및  $C_{1-3}$ 알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

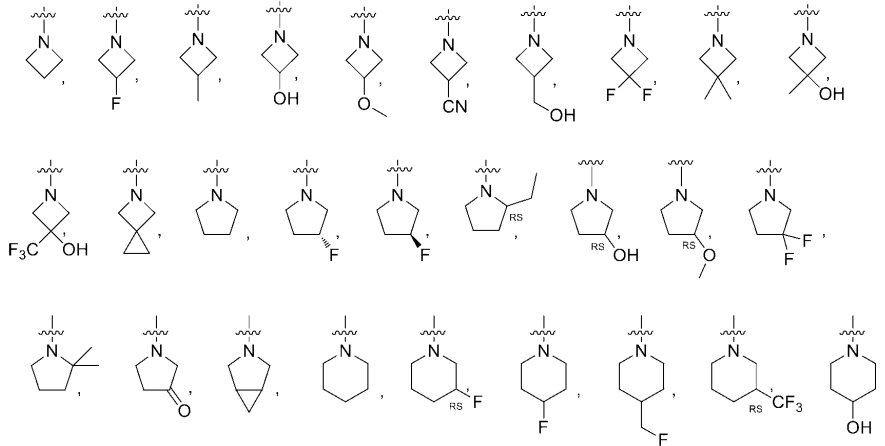
[0073]

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $C_{1-5}$ 알킬,  $C_{1-5}$ 할로알킬 및 CN으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 및 할로 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

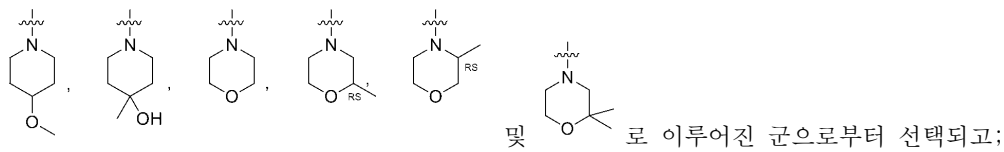
[0074]



[0075] 고리 A는



[0076]



[0077]

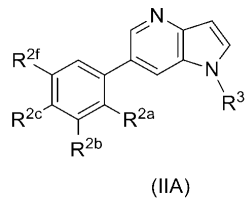
및 로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0078]

R<sup>4</sup>는 H, <sup>2</sup>H 또는 CH<sub>3</sub>이다.

[0079]

본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (IIA)을 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IIA)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



[0080]

상기 식에서,

[0081]

R<sup>2a</sup>는 H 또는 F이고;

[0082]

R<sup>2b</sup>는 H, F, CH<sub>3</sub> 또는 CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>이며;

[0083]

R<sup>2c</sup>는 H, F 또는 CH<sub>3</sub>이고;

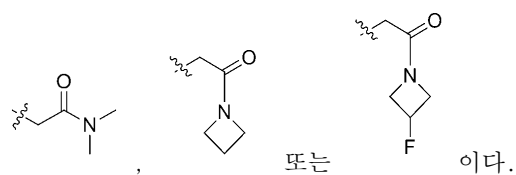
[0084]

R<sup>2f</sup>는 H, F 또는 CH<sub>3</sub>이며;

[0085]

R<sup>3</sup>는

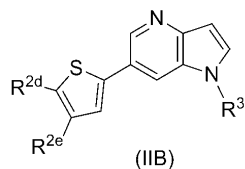
[0086]



[0087]

본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (IIB)의 구조를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IIB)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:

[0088]



[0089]

[0090]

[0091]

[0092]

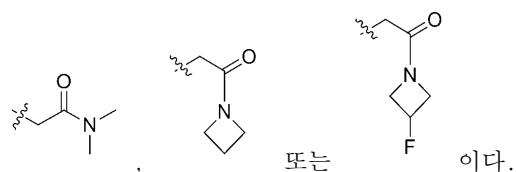
[0093]

상기 식에서,

$R^{2d}$ 는 H, Cl,  $CH_3$  또는  $CF_3$ 이고;

$R^{2e}$ 는 H 또는  $CH_3$ 이며;

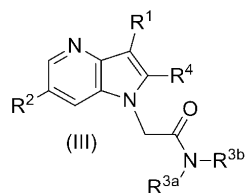
$R^3$ 는



[0094]

[0095]

본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (III)의 구조를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (III)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



[0096]

[0097]

[0098]

[0099]

상기 식에서,

$R^1$ 는 H,  $^3H$ , 할로,  $C_{1-3}$ 알킬 또는  $C_{1-3}$ 할로알킬이고;

$R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐;  $C_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 피리디닐; 벤조티오펜; 및 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 또는  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0100]

$R^{3a}$ 는 H 또는  $C_{1-5}$ 알킬이고;

[0101]

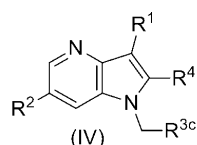
$R^{3b}$ 는 OH 또는  $OCH_3$ 로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $C_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $CH_2$ 사이클로프로필;  $C_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0102]

$R^4$ 는 H,  $H^2$  또는  $CH_3$ 이다.

[0103]

본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (IV)의 구조를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (IV)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



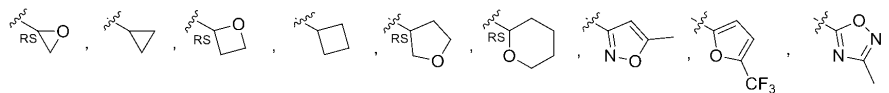
[0104]

[0105] 상기 식에서,

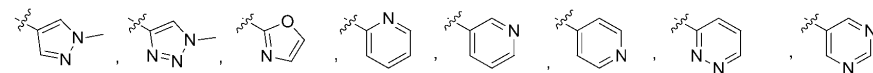
[0106]  $R^1$ 은 H 또는 할로이고;

[0107]  $R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 치환되는 티에닐이며;

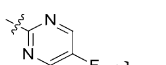
[0108]  $R^{3c}$ 는



[0109]

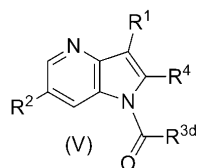


[0110] 또는



[0111]  $R^4$ 는 H이다.

[0112] 본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (V)의 구조를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (V)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



[0113]

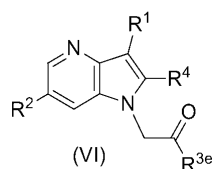
[0114] 상기 식에서,

[0115]  $R^1$  및  $R^4$ 는 H이고;

[0116]  $R^2$ 는 2개의 할로로 임의로 치환되는 페닐이며;

[0117]  $R^{3d}$ 는 사이클로부틸 또는  $CH_2$ -사이클로프로필이다.

[0118] 본 발명의 추가의 실시형태는 화학식 (VI)의 구조를 갖는 화학식 (I)의 화합물, 및 화학식 (VI)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다:



[0119]

[0120] 상기 식에서,

[0121]  $R^1$ 은 H 또는 할로이고;

[0122]  $R^2$ 는 할로,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 또는 할로 또는  $C_{1-5}$ 알킬로 치환되는 티에닐이며;

[0123]  $R^{3e}$ 는 OH,  $C_{1-5}$ 알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진

군으로부터 선택되며;

[0124]  $R^4$ 는 H 또는  $CH_3$ 이다.

[0125] 본 발명의 추가의 실시형태는 하기 표 1에 나타난 화합물:

실시예 번호	화합물명
1	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
2	2-(3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
3	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
4	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
5	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
6	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
7	2-(3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
8	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
9	2-(3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
10	2-(3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
11	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
12	2-(3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
13	2-(3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
14	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
15	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
16	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
17	2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
18	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
19	2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
20	2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
21	2-(3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;
22	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
23	2-(3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
24	2-(3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
25	2-(3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
26	2-(3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
27	2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
28	2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
29	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
30	2-(3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
31	2-(6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
32	N-사이클로프로필-2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;
33	1-(아제티딘-1-일)-2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

[0126]

실시예 번호	화합물명
34	2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
35	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
36	2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
37	2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
38	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
39	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
40	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
41	1-(아제티딘-1-일)-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
42	2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
43	N-사이클로프로필-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;
44	2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
45	2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
46	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
47	1-(아제티딘-1-일)-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
48	2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
49	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
50	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
51	N-사이클로프로필-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
52	2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;
53	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
54	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
55	2-[3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
56	2-[3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
57	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
58	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
59	3-[[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸;
60	5-메틸-3-[[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸;
61	5-메틸-3-[[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;
62	5-메틸-3-[[6-(o-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;

[0127]

실시예 번호	화합물명
63	3-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;
64	3-[[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;
65	3-[[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;
66	N-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1- 일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
67	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
68	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-(브로모-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;
69	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘- 1-일]에탄온;
70	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산;
71	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
72	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
73	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
74	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
75	N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
76	N-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
77	N-사이클로프로필-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
78	2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
79	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
80	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
81	2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
82	2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
83	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
84	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
85	1-모르폴리노-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
86	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
87	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
88	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
89	1-모르폴리노-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
90	1-모르폴리노-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
91	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
92	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N- 다이메틸-아세트아미드;
93	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N- 다이메틸-아세트아미드;
94	2-[3-플루오로-6-(4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N- 다이메틸-아세트아미드;
95	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N- 다이메틸-아세트아미드;
96	2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드;

[0128]

실시예 번호	화합물명
97	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
98	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
99	N-사이클로프로필-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
100	N-사이클로프로필-2-[6-[3,4-다이플루오로페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
101	N-사이클로프로필-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
102	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
103	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3,4-다이플루오로페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
104	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
105	2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
106	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
107	2-[6-[3,4-다이플루오로페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
108	2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
109	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
110	N-사이클로프로필-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
111	N-사이클로프로필-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
112	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-메틸-3-페리닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
113	5-[1-[2-(아제티딘-1-일)-2-옥소-에틸]피롤로[3,2-b]피리딘-6-일]피리딘-2-카르보니트릴;
114	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리미딘-5-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;
115	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[(5-플루오로피리미딘-2-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;
116	사이클로부틸-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
117	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-페리닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
118	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
119	2-사이클로프로필-1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
120	1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
121	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
122	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
123	1-피롤리딘-1-일-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
124	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

[0129]

실시예 번호	화합물명
125	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
126	1-모르폴리노-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
127	1-모르폴리노-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
128	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
129	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
130	6-(4-메틸-2-티에닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
131	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
132	2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
133	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
134	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
135	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
136	1-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
137	6-(4-메틸-2-티에닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;
138	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;
139	N,N-다이메틸-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
140	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;
141	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;
142	1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;
143	3,3-다이메틸-1-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
144	1-[6-(3-다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;
145	1-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;
146	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
147	2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
148	2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
149	2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
150	2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
151	2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
152	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
153	N-사이클로프로필-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
154	N-사이클로프로필-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
155	N-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;

[0130]



실시예 번호	화합물명
156	N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
157	N-사이클로프로필-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
158	N-사이클로프로필-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
159	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
160	N-사이클로프로필-2-[6-(6-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
161	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
162	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
163	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
164	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
165	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
166	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
167	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
168	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
169	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
170	1-부틸-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
171	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-아이소펜틸-피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
172	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(3-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
173	1-(사이클로부틸메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
174	1-(사이클로프로필메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
175	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
176	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
177	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
178	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(테트라하이드로푸란-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
179	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
180	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥시란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;

[0131]

실시예 번호	화합물명
181	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피라졸-1-일에틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
182	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;
183	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리미딘-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
184	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥세탄-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
185	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸- 페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
186	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
187	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염;
188	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-1- 피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
189	(R/S)-1-(3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸- 페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
190	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-메톡시-1- 피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
191	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-플루오로-1- 피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
192	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[4-(플루오로메틸)-1- 피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
193	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
194	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(2-메틸모르폴린- 4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
195	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3- (트라이플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
196	(R/S)-1-(2-에틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘- 1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
197	1-(2,2-다이메틸모르폴린-4-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2- b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
198	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3- 메톡시피롤리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
199	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로-1- 피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
200	1-(2,2-다이메틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2- b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
201	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3- 플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
202	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시-3-메틸- 아제티딘-1-일)에탄온;
203	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-하이드록시-3- (트라이플루오로메틸)아제티딘-1-일]에탄온;
204	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;

[0132]

실시예 번호	화합물명
205	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
206	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(하이드록시메틸)아제티딘-1-일]에탄온;
207	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;
208	1-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
209	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-4-메틸-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
210	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
211	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;
212	1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]아제티딘-3-카르보니트릴;
213	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
214	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸아제티딘-1-일)에탄온;
215	1-(3,3-다이메틸아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
216	1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]피롤리딘-3-온 트라이플루오로아세테이트 염;
217	1-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
218	(R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시피롤리딘-1-일)에탄온;
219	1-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
220	1-사이클로프로필-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
221	1-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
222	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
223	1-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
224	1-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
225	1-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
226	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-페닐-에탄온;
227	1-(4-플루오로페닐)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
228	(R/S)-6-(4-플루오로페닐)-1-(테트라하이드로피란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
229	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소프로필-아세트아미드;
230	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-프로필-아세트아미드;
231	(R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2,2,2-트라이플루오로-1-메틸-에틸)아세트아미드;
232	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(1-메틸사이클로프로필)아세트아미드;
233	N-(2-플루오로에틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
234	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소부틸-아세트아미드;

[0133]

실시예 번호	화합물명
235	5-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;
236	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;
237	N-(사이클로프로필메틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
238	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸트리아졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;
239	5-[[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;
240	3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;
241	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로부틸-에탄온;
242	1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
243	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
244	2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염;
245	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
246	2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;
247	2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
248	N-사이클로프로필-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
249	N-사이클로프로필-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
250	N-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
251	N-벤질-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
252	2-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]옥사졸;
253	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-하이드록시에틸)아세트아미드;
254	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-메톡시에틸)아세트아미드;
255	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
256	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
257	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
258	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
259	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;
260	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;

[0134]

실시예 번호	화합물명
261	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
262	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
263	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
264	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
265	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
266	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
267	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
268	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
269	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
270	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
271	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
272	(R/S)-1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-올;
273	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;
274	(R/S)-1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올;
275	(R/S)-2-사이클로프로필-1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]프로판-2-올 트라이플루오로아세테이트 염;
276	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메톡시-에탄아민;
277	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
278	1-피콜리딘-1-일-2-[6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
279	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
280	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
281	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
282	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
283	2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
284	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
285	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
286	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 옥실 트라이플루오로아세테이트 염;

[0135]

실시예 번호	화합물명
287	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
288	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
289	(R/S)-1-(2-사이클로프로필-2-플루오로-에틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘;
290	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;
291	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-메톡시에틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;
292	1-사이클로부틸-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
293	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
294	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3S)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
295	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염;
296	N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
297	N,N-다이에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
298	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
299	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;
300	2-[3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;
301	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
302	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
303	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
304	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
305	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
306	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
307	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
308	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
309	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
310	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
311	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
312	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

[0136]

실시예 번호	화합물명
313	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
314	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
315	2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;
316	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
317	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
318	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;
319	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
320	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
321	1-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
322	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
323	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
324	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
325	1-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
326	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
327	1-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
328	1-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
329	1-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
330	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
331	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
332	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설포닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
333	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
334	1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
335	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
336	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
337	1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
338	1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
339	1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
340	4-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;
341	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
342	1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
343	1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;

[0137]

실시예 번호	화합물명
344	1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
345	1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
346	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;
347	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
348	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
349	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
350	N-사이클로프로필-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
351	N-사이클로프로필-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
352	N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
353	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
354	1-(아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
355	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
356	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
357	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
358	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
359	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
360	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
361	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
362	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
363	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
364	1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;
365	1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
366	N-사이클로프로필-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
367	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
368	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
369	2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
370	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
371	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
372	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일]에탄온;

[0138]



실시예 번호	화합물명
373	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
374	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
375	N,N-다이메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
376	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
377	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
378	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
379	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
380	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
381	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
382	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
383	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
384	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;
385	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
386	N,N-다이메틸-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
387	2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
388	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
389	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
390	2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
391	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;
392	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
393	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
394	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
395	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
396	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
397	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;

[0139]

실시예 번호	화합물명
398	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
399	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
400	N,N-다이메틸-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
401	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
402	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;
403	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
404	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-메틸티아졸-5-일)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
405	1-(아제티딘-1-일)-2-(6-티아졸-5-일피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
406	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-플루오로-3-피리딜)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
407	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
408	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
409	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
410	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
411	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드;
412	2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
413	2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
414	2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
415	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드;
416	2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
417	2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
418	2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
419	N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
420	2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
421	2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
422	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
423	2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
424	2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
425	2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

[0140]

실시예 번호	화합물명
426	2-[6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
427	2-[6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
428	N,N-다이메틸-2-[6-(2,4,5-트라이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
429	2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
430	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
431	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
432	2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
433	N,N-다이메틸-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;
434	N,N-다이메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
435	N,N-다이메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
436	2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
437	N,N-다이메틸-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
438	N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
439	2-[6-(5-클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
440	2-[6-(2,5-다이클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
441	N,N-다이메틸-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
442	N,N-다이메틸-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
443	N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
444	2-[6-(2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
445	2-[6-(2-플루오로-5-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
446	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
447	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
448	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
449	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
450	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
451	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
452	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
453	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

[0141]

실시예 번호	화합물명
454	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
455	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
456	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
457	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
458	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
459	N-에틸-N-메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
460	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
461	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;
462	N-에틸-N-메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
463	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
464	N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
465	2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
466	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
467	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
468	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
469	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;
470	N-에틸-N-메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
471	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
472	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
473	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
474	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
475	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
476	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
477	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
478	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

[0142]

실시예 번호	화합물명
479	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
480	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
481	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
482	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
483	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
484	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
485	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
486	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
487	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
488	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
489	2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
490	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
491	2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
492	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
493	2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
494	2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
495	2-[3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
496	2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
497	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
498	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
499	2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
500	2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
501	2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
502	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
503	2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
504	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

[0143]

실시예 번호	화합물명
505	2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
506	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
507	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
508	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
509	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
510	2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
46	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
512	2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
513	2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
514	2-[3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
515	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
516	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
517	2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
518	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
519	2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
520	2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
521	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
522	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
523	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
524	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
525	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
526	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
527	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
528	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
529	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;

[0144]

실시예 번호	화합물명
530	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
531	2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
532	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
533	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
534	2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
535	2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
536	2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
537	2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
538	2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
539	2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
540	2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
541	2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
542	2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
543	2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
544	2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸아세트아미드;
545	2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
546	2-[3-클로로-6-(3-(다이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
547	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
548	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
549	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸아세트아미드;
550	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
551	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
552	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
553	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;

[0145]

실시예 번호	화합물명
554	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
555	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
556	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
557	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;
558	2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
559	N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
560	N-에틸-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
561	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
562	2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
563	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
564	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
565	2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
566	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
567	2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
568	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
569	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
570	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
571	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
572	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
573	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
574	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
575	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
576	N,N-다이메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;
577	N-에틸-N-메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;
578	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
579	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;

[0146]



실시예 번호	화합물명
580	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
581	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
582	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
583	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
584	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
585	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
586	2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
587	N-에틸-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
588	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
589	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
590	2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
591	2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
592	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
593	2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
594	N-에틸-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
595	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
596	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
597	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
598	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
599	2-[3-클로로-6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
600	2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
601	2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
602	2-[3-클로로-6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
603	2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
604	2-[6-(벤조티오펜-2-일)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

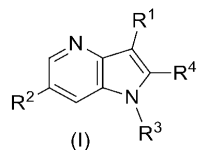
[0147]

실시예 번호	화합물명
605	2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
606	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
607	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
608	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
609	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-[ <sup>3</sup> H]-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;
610	2-[2-듀테리오-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
611	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
612	3-클로로-1-(3-피리딜메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;
613	1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;
614	3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;
615	3-클로로-1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;
616	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
617	N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;
618	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
619	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
620	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;
621	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
622	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
623	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
624	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
625	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;
626	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
627	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
628	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;
629	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;

실시예 번호	화합물명
630	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
631	2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;
632	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
633	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
634	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;
635	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
636	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;
637	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;
638	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온; 및
639	2-[6-[5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;

및 이들의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물이다.

[0151] 본 발명의 추가의 실시형태는 (A) 화학식 (I)의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 및 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물의 유효량; 및 (B) 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다:



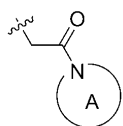
[0152]

[0153] 상기 식에서,

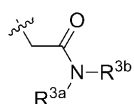
[0154] R¹은 H, <sup>3</sup>H, 할로, C<sub>1-3</sub>알킬 및 C<sub>1-3</sub>할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0155] R²는 할로, C<sub>1-5</sub>알킬 및 C<sub>1-5</sub>할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬 및 -CN으로 임의로 치환되는 피리디닐; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜릴; 및 할로, C<sub>1-5</sub>알킬 및 C<sub>1-5</sub>할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

[0156] R³는,



[0157] (a) (여기서, 고리 A는 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬, CH<sub>2</sub>OH, C<sub>1-5</sub>알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아제티디닐; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의 C<sub>1-5</sub>알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로, C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>할로알킬, C<sub>1-5</sub>알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);



[0158] (b) (여기서, R³ᵃ는 H 또는 C<sub>1-5</sub>알킬이고; R³ᵇ는 OH, 할로 또는 OCH<sub>3</sub>로 임의로 치환되는 C<sub>1-5</sub>알킬; C<sub>1-5</sub>할로알킬; 벤질; CH<sub>2</sub>사이클로프로필; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);



[0159] (c) (여기서, R³ᶜ는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐; C<sub>1-5</sub>할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴; C<sub>1-5</sub>알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);



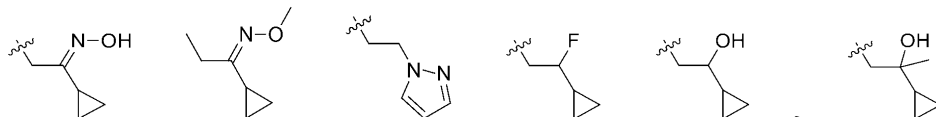
[0160] (d) (여기서, R³ᵈ는 CH<sub>2</sub>-사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);



(e) (여기서,  $R^{3e}$ 는 OH,  $C_{1-5}$ 알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

(f) OH 또는  $C_{1-5}$ 알콕시로 임의로 치환되는  $C_{1-5}$ 알킬;  $CH_2S(CH_3)$ ;  $CH_2(S=O)CH_3$ ;  $CH_2(SO_2)CH_3$ ; 및  $CH_2CH_2(C=O)CH_3$ ; 또는

(g)



로 이루어진 군으로부터 선택되고;

$R^4$ 는 H,  $^2H$  또는  $C_{1-3}$ 알킬이다.

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

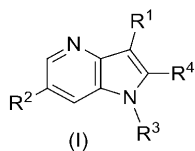
본 발명의 추가의 실시형태는 적어도 하나의 화학식 (IIB)의 화합물, 및 화학식 (IIB)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물, 화학식 (IIB)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (IIB)의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량; 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다.

본 발명의 추가의 실시형태는 적어도 하나의 표 1의 화합물, 및 표 1의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물, 표 1의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 표 1의 약제학적으로 활성인 대사산물의 유효량; 및 적어도 하나의 약제학적으로 허용가능한 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이다.

화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 거울상 이성질체 및 부분 입체 이성질체도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 동위원소 변형체, 예를 들어 화학식 (I)의 중수소화 화합물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 염, N-옥사이드 또는 용매화물도 본 발명의 범위 내에 있다. 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 허용가능한 프로드럭 및 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 동위원소 변형체의 약제학적으로 활성인 대사산물도 본 발명의 범위 내에 있다.

본 발명의 추가의 실시형태는 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 염, N-옥사이드 또는 용매화물의 유효량을 투여하는 단계를 포함하는, NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태를 앓고 있거나 이로 진단받은 대상을 치료하는 방법이다:



[0172]

[0173]

상기 식에서,

[0174]

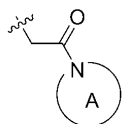
$R^1$ 은 H,  $^3\text{H}$ , 할로,  $\text{C}_{1-3}$ 알킬 및  $\text{C}_{1-3}$ 할로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고;

[0175]

$R^2$ 는 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬 및  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐; 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬,  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬 및  $-\text{CN}$ 으로 임의로 치환되는 피리디닐;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 티아졸릴; 벤조티오펜; 및 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬 및  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 티에닐로 이루어진 군으로부터 선택되며;

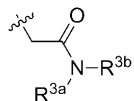
[0176]

$R^3$ 는,



[0177]

(a) (여기서, 고리 A는 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬,  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬,  $\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $\text{C}_{1-5}$ 알콕시, OH 및 CN으로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 아제티디닐; 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬,  $\text{C}_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피롤리디닐; 1개 또는 2개의  $\text{C}_{1-5}$ 알킬 구성원으로 임의로 치환되는 모르폴리노; 할로,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬,  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬,  $\text{C}_{1-5}$ 알콕시 및 OH로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 1개 또는 2개의 구성원으로 임의로 치환되는 피페리디닐; 3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일; 5-아자스피로[2.3]헥산-5-일; 및 피롤리딘-3-온으로 이루어진 군으로부터 선택되는 추가의 산소 헤테로원자를 임의로 포함하는 4원 내지 7원 헤테로사이클로알킬임);



[0178]

(b) (여기서,  $R^{3a}$ 는 H 또는  $\text{C}_{1-5}$ 알킬이고;  $R^{3b}$ 는 OH, 할로 또는  $\text{OCH}_3$ 로 임의로 치환되는  $\text{C}_{1-5}$ 알킬;  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬; 벤질;  $\text{CH}_2$ 사이클로프로필;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 사이클로프로필; 및 사이클로부틸로 이루어진 군으로부터 선택됨);

[0179]

(c) (여기서,  $R^{3c}$ 는 사이클로프로필; 사이클로부틸; 할로로 임의로 치환되는 피리미디닐; 피리디닐; 피리다지닐;  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬로 임의로 치환되는 푸라닐; 옥사졸릴;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 아이속사졸릴;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 옥사다이하졸릴;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 피라졸릴;  $\text{C}_{1-5}$ 알킬로 임의로 치환되는 트라이아졸릴; 테트라하이드로푸라닐; 테트라하이드로피라닐; 옥세타닐; 및 옥시라닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);



[0180]

(d) (여기서,  $R^{3d}$ 는  $\text{CH}_2$ -사이클로프로필 또는 사이클로부틸임);



[0181]

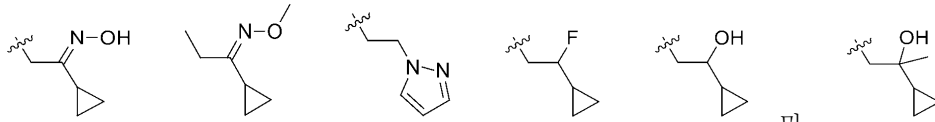
(e) (여기서,  $R^{3e}$ 는 OH,  $\text{C}_{1-5}$ 알킬, 사이클로프로필, 사이클로부틸, 및 1개의 할로 치환기로 임의로 치환되는 페닐로 이루어진 군으로부터 선택됨);

[0182]

(f) OH 또는  $\text{C}_{1-5}$ 알콕시로 임의로 치환되는  $\text{C}_{1-5}$ 알킬;  $\text{CH}_2\text{S}(\text{CH}_3)$ ;  $\text{CH}_2(\text{S}=\text{O})\text{CH}_3$ ;  $\text{CH}_2(\text{SO}_2)\text{CH}_3$ ; 및  $\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{CH}_3$ ; 또

는

(g)



택되고;

$R^4$ 는 H,  $^2H$  또는  $C_{1-3}$ 알킬이다.

본 발명의 추가의 실시형태는 NR2B 수용체 활성화에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 의학적 상태의 치료를 필요로 하는 대상에게 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물로부터 선택되는 적어도 하나의 화합물, 화학식 (I)의 화합물의 거울상 이성질체 및 부분입체 이성질체, 화학식 (I)의 화합물의 동위원소 변형체 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.

본 발명의 방법의 바람직한 실시형태에서, 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.

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.

본 발명에 따라 치료될 수 있는 신경증성, 스트레스 관련 및 신체형 장애에 속하는 장애의 예로는 불안장애, 범불안장애, 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.

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.

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.

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(L-dopa) 유발성 운동이상을 포함하나 이에 한정되지 않는 기타 추체외로 및 운동장애; 신경이완제 약성 증후군(NMS), 신경이완제 유발성 파킨슨병, 신경이완제 유발성 조발성(early onset) 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.

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) 근육



긴장이상, 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.

[0194] 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.

[0195] 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 초기 마이오클로누스 뇌병증, 웨스트 증후군(West's syndrome), 소발작 및 대발작; 간질지속증을 포함하나 이에 한정되지 않는다.

[0196] 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.

[0197] 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.

[0198] 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.

[0199] 일부 실시형태에서, 본 발명의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용가능한 염의 투여는 질환을 예방하는데 효과적이는데, 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.

[0200] 본 발명의 추가의 실시형태, 특징 및 이점은 하기 상세한 설명 및 본 발명의 실시를 통해 명백해질 것이다.

[0201] 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.

[0202] 본 명세서에 사용되는 용어 "을 포함하여", "함유하는" 및 "포함하는"은 이들의 개방적이고, 비제한적인 의미로 본 명세서에서 사용된다.

[0203] 용어 "알킬"은쇄의 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<sub>1-3</sub>알킬"은쇄의 탄소 원자수가 1 내지 3인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 본 명세서에서 사용되는 용어 "C<sub>1-5</sub>알킬"은쇄의 탄소 원자수가 1 내지 5인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다.

[0204] 용어 "알콕시"는 알킬기를 분자의 나머지 부분에 연결하는 말단 산소를 갖는 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 포함한

다. 알콕시는 메톡시, 에톡시, 프로폭시, 아이소프로폭시, 부톡시, t-부톡시, 펜톡시 등을 포함한다.

[0205] 용어 "아릴"은 고리 당 6개의 원자를 갖는 모노사이클릭, 방향족 탄소 고리 (모두 탄소인 고리 원자를 갖는 고리 구조)를 지칭한다 (아릴기의 탄소 원자는  $sp^2$  혼성화됨.).

[0206] 용어 "페닐"은 하기 부분을 나타낸다:



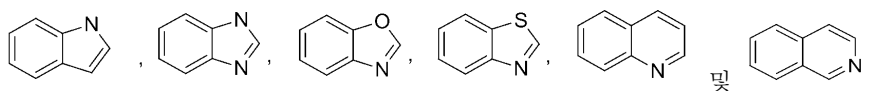
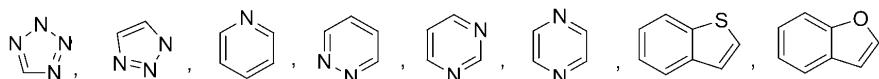
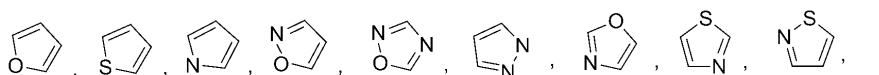
[0207] .

[0208] 용어 "티에닐"은 하기 부분을 나타낸다:



[0209] .

[0210] 용어 "헤테로아릴"은 헤테로사이클 당 3 내지 9개의 고리 원자를 가진, 모노사이클릭 또는 융합 바이사이클릭 헤테로사이클 (탄소 원자, 및 질소, 산소, 및 황으로부터 선택되는 4개 이하의 헤테로원자로부터 선택된 고리 원자를 갖는 고리 구조)을 말한다. 헤테로아릴기의 예시적인 예는 적절히 결합된 부분 형태의 하기 실체 (entity)를 포함한다:

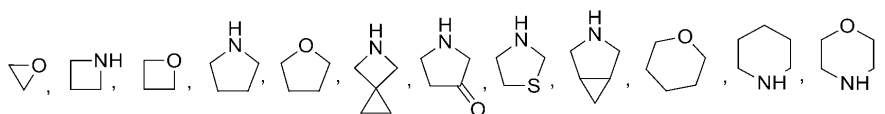


[0211]

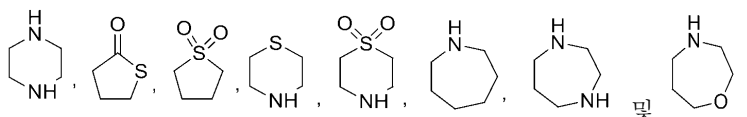
[0212] .

[0213] 당업자는 상기에 열거되거나 예시된 헤테로아릴, 사이클로알킬, 아릴 및 헤테로사이클로알킬기의 화학종이 완전히 망라되지 않으며, 이들 정의된 용어의 범위내의 추가의 화학종이 또한 선택될 수 있음을 인식할 것이다.

[0214] "헤테로사이클로알킬"은 포화 또는 부분 포화되고, 고리 구조당, 탄소 원자, 및 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 2개 이하의 헤테로원자로부터 선택되는 4 내지 7개의 고리 원자를 가진 모노사이클릭 고리 구조를 말한다. 이러한 고리 구조는 황 고리 구성원 상에 2개 이하의 옥소기를 임의로 포함할 수 있다. 적절히 결합된 부분 형태의 예시적인 실체에는 하기가 포함된다:



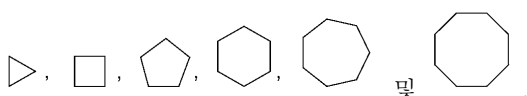
[0215]



[0216]

[0217] 용어 "시아노"는 기  $-CN$ 을 지칭한다.

[0218] 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:



[0219]

[0220] 용어 "할로"는 클로로, 플루오로, 브로모 또는 요오도를 나타낸다.

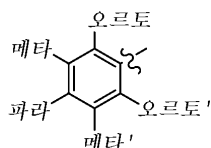


[0221] 용어 "퍼할로알킬" 또는 "할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 5인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 용어 " $C_{1-3}$ 할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 3인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. 용어 " $C_{1-5}$ 할로알킬"은 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 5인 직쇄 또는 분지쇄 알킬기를 지칭한다. "퍼할로알킬", "할로알킬" 기의 예로는 트라이플루오로메틸 ( $CF_3$ ), 다이플루오로메틸 ( $CF_2H$ ), 모노플루오로메틸 ( $CH_2F$ ), 펜타플루오로에틸 ( $CF_2CF_3$ ), 테트라플루오로에틸 ( $CHFCH_2F$ ), 모노플루오로에틸 ( $CH_2CH_2F$ ), 트라이플루오로에틸 ( $CH_2CF_3$ ), 테트라플루오로트라이플루오로메틸에틸 ( $-CF(CF_3)_2$ ), 및 당해 기술분야에 있어서의 통상의 기술 및 본 명세서에 주어진 교시내용을 고려하여, 상술한 예 중 어느 하나와 동등한 것으로 간주되는 기를 들 수 있다.

[0222] 용어 "퍼할로알콕시" 또는 "할로알콕시"는 임의로 수소를 할로젠으로 치환하는 쇠의 탄소 원자수가 1 내지 5인 직쇄 또는 분지쇄 알콕시기를 지칭한다. 퍼할로알콕시기의 예로는 트라이플루오로메톡시 ( $OCF_3$ ), 다이플루오로메톡시 ( $OCF_2H$ ), 모노플루오로메톡시 ( $OCH_2F$ ), 모노플루오로에톡시 ( $OCH_2CH_2F$ ), 펜타플루오로에톡시 ( $OCF_2CF_3$ ), 테트라플루오로에톡시 ( $OCHFCH_2F$ ), 트라이플루오로에톡시 ( $OCH_2CF_3$ ), 테트라플루오로트라이플루오로메틸에톡시 ( $-OCF(CF_3)_2$ ), 및 당해 기술분야에 있어서의 통상의 기술 및 본 명세서에 주어진 교시내용을 고려하여, 상술한 예 중 어느 하나와 동등한 것으로 간주되는 기를 들 수 있다.

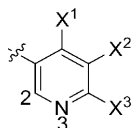
[0223] 용어 "치환된"은 특정 기 또는 부분이 하나 이상의 치환기를 갖는 것을 의미한다. 용어 "비치환된"은 특정 기가 치환기를 갖지 않는 것을 의미한다. 용어 "임의로 치환된"은 특정 기가 비치환되거나 하나 이상의 치환기로 치환되는 것을 의미한다. 용어 "치환된"이 구조 시스템을 설명하는데 사용되는 경우, 상기 시스템 상의 임의의 원자가 허용 위치에서 치환이 일어나는 것을 의미한다. 특정 부분 또는 기가 임의의 특정 치환기로 임의로 비치환되거나 치환되는 것으로 명시되지 않은 경우에, 그러한 부분 또는 기는 비치환되지 않은 것으로 의도되는 것으로 이해된다.

[0224] 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.







[0225]

[0226] 피리딜기 상의 치환기를 언급하는 경우, 용어 "파라", "메타" 및 "오르토"는 피리딜 고리의 부착점에 대한 치환기의 배치를 의미한다. 예를 들어, 하기 구조는 오르토 위치의  $X^1$  치환기, 메타 위치의  $X^2$  치환기 및 파라 위치의  $X^3$  치환기를 갖는 3-피리딜로 표현된다:



[0227]

[0228] 보다 간결한 설명을 제공하기 위해, 본 명세서에 주어진 정량적 표현의 일부는 용어 "약"으로 한정되지 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 등가값 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.

- [0229] 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, 5<sup>th</sup> 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.
- [0230] 본 명세서에 주어진 임의의 화학식은 구조식뿐만 아니라, 특정 변형체 또는 형태로 나타낸 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.
- [0231] 또한 동일한 분자식을 가지나 이들의 원자의 결합 특성 또는 결합 순서 또는 이들의 원자의 공간 배열이 상이한 화합물이 "이성질체"로 명명되는 것으로 이해되어야 한다. 이들의 원자의 공간 배열이 상이한 이성질체는 "입체 이성질체"로 명명된다.
- [0232] 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 평광면을 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.
- [0233] "호변 이성질체"는 상호 교환가능한 형태의 특정 화합물 구조로 되어 있으며, 수소 원자 및 전자의 치환에 따라 변화하는 화합물을 지칭한다. 따라서, 2개의 구조는  $\pi$  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.
- [0234] 호변 이성질체는 대상으로 하는 화합물의 최적 화학 반응성 및 생물 활성의 달성과 관련될 수 있다.
- [0235] 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.
- [0236] 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.
- [0237] 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 나타낸 화합물은 (R) 또는 (S)의 절대 배열을 갖는 순수한 거울상 이성질체 화합물을 의미한다. 절대 입체화학이 확인된 경우, 구조는 (R) 및 (S)를 사용하여 명명된다.
- [0238] 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.
- [0239] 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 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물, 또는 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB),

(III), (IV), (V) 및 (VI))의 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 실시형태에서, 용매는 물이며, 용매화물은 수화물이다. 또한, 특정한 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물, 또는 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염의 결정질 형태는 공결정 (co-crystal)으로서 얻어질 수 있다. 본 발명의 특정 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 결정질 형태로서 얻어졌다. 다른 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물의 결정질 형태는 사실상 입방체이었다. 다른 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염은 결정질 형태로서 얻어졌다. 또 다른 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 결정질 형태의 혼합물로서, 다형체로서, 또는 비결정질 형태로서 다수의 다형체 중 하나로 얻어졌다. 다른 실시형태에서, 화학식 (I)의 화합물은 용액 중에서 하나 이상의 결정질 형태 및/또는 다형체로 전환된다.

[0240]

본 명세서에서 화합물에 대한 언급은 (a) 이러한 화합물의 실제적으로 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<sub>(s)</sub>, R-COOH<sub>(sol)</sub> 및 R-COO<sup>-</sup><sub>(sol)</sub> 중 어느 하나에 대한 언급을 포함한다. 본 예에서, R-COOH<sub>(s)</sub>는 예를 들어, 정제 또는 일부 다른 고체 약제학적 조성물 또는 제제로 될 수 있기 때문에, 고체 화합물을 말하며; R-COOH<sub>(sol)</sub>는 용매 중의 해리되지 않은 형태의 화합물을 말하고; R-COO<sup>-</sup><sub>(sol)</sub>는 해리된 형태가 R-COOH로부터, 이의 염으로부터, 또는 매질에서의 해리 시에 R-COO<sup>-</sup>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<sub>(aq)</sub> 및/또는 R-COO<sup>-</sup><sub>(aq)</sub> (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.

[0241]

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(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 H<sub>2</sub>NCH<sub>2</sub>COOH를 가지며, 이것은 일부 매질에서는(이 경우에는 중성 매질에서) 쯔비터이온 형태 <sup>+</sup>H<sub>3</sub>NCH<sub>2</sub>COO<sup>-</sup>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 실시형태를 명명할 필요가 없으므로, 본 발명의 화합물과 관련되는 쯔비터이온 화합물의 어떤 구조도 본 명세서에서 명시적으로 주어지지 않는다. 그러나, 이들은 본 발명의 실시형태의 일부이다. 주어진 화합물의 다양한 형태를 유도하는 주어진 매질에서의 상호 작용 및 변환이 당업자에게 공지되어 있기 때문에, 이와 관

련하여 더 이상의 예는 본 명세서에 제공되지 않는다.

[0242] 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,  $^2\text{H}$ ,  $^3\text{H}$ ,  $^{11}\text{C}$ ,  $^{13}\text{C}$ ,  $^{14}\text{C}$ ,  $^{15}\text{N}$ ,  $^{18}\text{O}$ ,  $^{17}\text{O}$ ,  $^{31}\text{P}$ ,  $^{32}\text{P}$ ,  $^{35}\text{S}$ ,  $^{18}\text{F}$ ,  $^{36}\text{Cl}$ ,  $^{125}\text{I}$ 를 들 수 있다. 그러한 동위원소로 표지된 화합물은 대사 연구 (바람직하게는  $^{14}\text{C}$ 를 사용함), 반응 속도론 연구 (예를 들어,  $^2\text{H}$  또는  $^3\text{H}$ 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,  $^{18}\text{F}$  또는  $^{11}\text{C}$  표지된 화합물은 PET 또는 SPECT 연구에 특히 바람직할 수 있다. 또한, 중수소(즉,  $^2\text{H}$ )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.

[0243] 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.

[0244] 지정 및 명명법에 관한 상술한 해석상의 고려사항에 따르면, 본 명세서에서 세트에 대한 명시적 언급은 화학적으로 의미가 있는 경우에 달리 명시하지 않는 한, 이러한 세트의 실시형태에 대한 독립적인 언급, 및 명시적으로 언급된 세트의 서브세트의 가능한 모든 하나하나의 실시형태에 대한 언급을 의미하는 것으로 이해된다.

[0245] 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 실시형태를 나타낸다. 따라서, 더 짧은 용어 " $S_1^1$ 은  $S_1$  및  $S_2$  중 하나이고,  $S_2^2$ 은  $S_3$  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,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^{2c}$ ,  $R^{2d}$ ,  $R^{2e}$ ,  $R^{2f}$ ,  $R^3$ ,  $R^{3a}$ ,  $R^{3b}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{3d}$ ,  $R^{3e}$ ,  $R^{3e1}$ ,  $R^4$ ,  $\text{Het}^1$  및  $\text{Hal}^2$ 와 같은 구성원 및 본 명세서에 사용된 임의의 다른 일반 치환기 기호로 확대 적용한다.

[0246] 게다가, 임의의 구성원 또는 치환기에 대하여 하나 이상의 지정이 주어지는 경우, 본 발명의 실시형태는 열거된 지정으로부터 형성될 수 있는, 독립적으로 취해진 다양한 그룹 및 그 등가물을 포함한다. 치환기 용어에 대한 두 번째 예로서, 치환기  $S_{\text{예}}$ 가  $S_1$ ,  $S_2$  및  $S_3$  중 하나인 것으로 기술된다면, 이러한 목록은  $S_{\text{예}}$ 가  $S_1$ 이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_2$ 이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_3$ 이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_1$  및  $S_2$  중 하나이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_1$  및  $S_3$  중 하나이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_2$  및  $S_3$  중 하나이고;  $S_{\text{예}}$ 가  $S_1$ ,  $S_2$  및  $S_3$  중 하나이고;  $S_{\text{예}}$ 가 이러한 선택의 각각의 임의의 등가물인 본 발명의 실시형태를 나타낸다. 따라서, 더 짧은 용어 " $S_{\text{예}}$ 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,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{2a}$ ,  $R^{2b}$ ,  $R^{2c}$ ,  $R^{2d}$ ,  $R^{2e}$ ,  $R^{2f}$ ,  $R^3$ ,  $R^{3a}$ ,  $R^{3b}$ ,  $R^{3c}$ ,  $R^{3d}$ ,  $R^{3e}$ ,  $R^{3e1}$ ,  $R^4$ ,  $\text{Het}^1$  및  $\text{Hal}^2$ 와 같은 구성원 및 본 명세서에 사용된 임의의 다른 일반 치환기 기호로 확대 적용한다.

[0247]  $j > i$ 인 " $\text{C}_{i-j}$ " 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 실시형태를 나타내고자 한다. 예로서, 용어 " $\text{C}_{1-}$



<sub>3</sub>"는 독립적으로, 1개의 탄소 구성원(C<sub>1</sub>)을 갖는 실시형태, 2개의 탄소 구성원(C<sub>2</sub>)을 갖는 실시형태 및 3개의 탄소 구성원(C<sub>3</sub>)을 갖는 실시형태를 나타낸다.

[0248] 용어 "C<sub>n-m</sub>알킬"은 직쇄 또는 분지쇄에 관계없이, 쇠의 탄소 구성원의 총수 N이  $n \leq N \leq m$  ( $m > n$ )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 ≠ B 임)에 대한 언급은 본 명세서에서, 제1 치환 구성원에 부착된 A 및 제2 치환 구성원에 부착된 B를 갖는 그러한 이치환기를 말하며, 그것은 또한, 제2 치환 구성원에 부착된 A 및 제1 치환 구성원에 부착된 B를 갖는 그러한 이치환기를 말한다.

[0249] 본 발명은 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물, 바람직하게는 상술한 것들 및 본 명세서에 예시되는 특정 화합물의 약제학적으로 허용가능한 염, 및 그러한 염을 이용한 치료 방법을 또한 포함한다.

[0250] 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.

[0251] "약제학적으로 허용가능한 염"은 비독성이거나, 생물학적으로 용인되거나, 그 밖에 대상에게 투여하기에 생물학적으로 적합한 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))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, and Use*, Stahl and Wermuth, Eds., Wiley-VCH and 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 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물은 충분히 산성인 기, 충분히 염기성인 기, 또는 두 가지 유형의 작용기를 가질 수 있고, 따라서, 다수의 무기 또는 유기 염기, 및 무기 및 유기 산과 반응하여 약제학적으로 허용가능한 염을 형성할 수 있다.

[0252] 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, 부틴-1,4-다이오에이트, 헥신-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.

[0253] 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))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.

[0254] 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))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 명세서

에 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.

[0255] 본 발명은 또한 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))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 가용태 분해 또는 효소적 절단과 같은 화학적 또는 생리적 과정을 통해, 또는 생리적 조건하에(예를 들어, 생리적 pH에 도달하면 프럭드럭이 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

[0256] 예시적인 프로드럭에는 아마이드 또는 에스테르 결합을 통하여 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))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 설포도 포함된다.

[0257] 추가의 프로드럭 유형이 예를 들어, 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 구조의 유리 카르복실기를 아마이드 또는 알킬 에스테르로서 유도체화함으로써 생성될 수 있다. 아마이드의 예에는 암모니아, 일차 C<sub>1-6</sub>알킬 아민 및 이차 다이(C<sub>1-6</sub>알킬)아민으로부터 유도된 것들이 포함된다. 이차 아민에는 5원 또는 6원 헤테로사이클로알킬 또는 헤테로아릴 고리 부분이 포함된다. 아마이드의 예에는 암모니아, C<sub>1-3</sub>알킬 일차 아민 및 다이(C<sub>1-2</sub>알킬)아민으로부터 유도된 것들이 포함된다. 본 발명의 에스테르의 예에는 C<sub>1-7</sub>알킬, C<sub>5-7</sub>사이클로알킬, 페닐 및 페닐(C<sub>1-6</sub>알킬) 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 포스포틸옥시메틸옥시카르보닐을 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 아마이드, 설포아미드 또는 포스포아미드로서 유도체화될 수 있다. 모든 이들 프로드럭의 부분은 에테르, 아민 및 카르복실산 작용기를 비롯한 기들을 포함할 수 있다.

[0258] 또한, 본 발명은 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물의 약제학적으로 활성인 대사산물에 관한 것이며, 이는 또한 본 발명의 방법에 사용될 수 있다. "약제학적으로 활성인 대사산물"은 화학식 (I) (및 적용 가능한 경우, 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물 또는 이의 염의 약리학적으로 활성인 체내 대사산물을 의미한다. 화합물의 프로드럭 및 활성 대사산물은 당 업계에 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.

[0259] 본 발명의 화학식 (I) (및 화학식 (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V) 및 (VI))의 화합물, 및 이의 약제학

적으로 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.

[0260] 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 말한다. 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.

[0261] 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 (정신약리학 적 약물에 의해 유발됨) 포함하나 이에 한정되지 않는 근육긴장이상과 같은 NR2B 수용체 활성화에 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(피크노레프), 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, 뇌경색, 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 아

밀로이드 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.

[0262] 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, 단위 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.

[0263] 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.

[0264] 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 실시형태에서, 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.

[0265] 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.

[0266] "약제학적으로 허용가능한 부형제"는 비독성이면서 생물학적 내성을 나타내며, 그 밖에 대상에게 투여하기에 생물학적으로 적합한 물질, 예컨대 약리학 적 조성물에 첨가되거나, 아니면 약제의 투여를 촉진시키도록 비히클, 담체, 또는 희석제로서 사용되고 이것과 상용성을 갖는 불활성 물질을 말한다. 부형제의 예로는 탄산칼슘, 인산칼슘, 각종 당 및 전분 종류, 셀룰로스 유도체, 젤라틴, 식물유 및 폴리에틸렌 글리콜을 들 수 있다.

[0267] 활성제의 하나 이상의 용량 단위를 포함하는 약제학적 조성물의 전달 형태는 당해 기술분야의 숙련자에게 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.

[0268] 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.

[0269] 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.

[0270] 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, 메틸셀룰로스, 스테아르산마그네슘, 만니톨, 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 붕해제이다. 결합제로는 전분 및 젤라틴을 들 수 있다. 윤활제는 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.

[0271] 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.

[0272] 경구 투여용 액체는 현탁액, 용액, 에멀전 또는 시럽의 형태일 수 있거나, 사용 전에 물이나 다른 적절한 비히클과의 재구성을 위한 건조 제품으로서 동결 건조되거나 제공될 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.

[0273] 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 제제를 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.

[0274] 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.

[0275] 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.

[0276] 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 정의한 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.

[0277] 본 명세서에서 사용된 약어 및 두문자어는 다음을 포함한다.

[0278] [표 4]

용어	두문자어
아세토니트릴	ACN
수성	aq
기압	atm
염화금(III)	Au(III)Cl <sub>3</sub>
tert-부틸카르바모일	Boc
벤조트라이아졸-1-일옥사- 트리스(다이메틸아미노)포스포늄 헥사플루오로포스페이트	BOP
브로드	br
규조토	셀라이트(Celite) <sup>®</sup>
다이에틸아미노황 트라이플루오라이드	DAST
1,8-다이아자바이사이클로[5.4.0]운데스-7-엔	DBU
N,N'-다이사이클로헥실카르보다이이미드	DCC
다이클로로에탄	DCE
다이클로로메탄	DCM
비스(2-메톡시에틸)아미노황 트라이플루오라이드	데옥소-플루오르(Dcexo-Fluor) <sup>®</sup>
다이아이소프로필에틸아민	DIPEA
4-다이메틸아미노피리딘	DMAP
1,2-다이메톡시에탄	DME
N,N-다이메틸포름아미드	DMF
다이메틸설폭사이드	DMSO
1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카르보다이이미드	EDCI, EDAC 또는 EDC
다이에틸 에테르	에테르, Et <sub>2</sub> O
아세트산에틸	EtOAc 또는 EA
에탄올	EtOH
순상 실리카 겔 크로마토그래피	FCC
그램	g
시간	h
1-[비스(다이메틸아미노)메틸렌]-1H-1,2,3- 트리아졸로[4,5-b]피리딘 3-옥사이드 헥사플루오로포스페이트	HATU
N,N,N',N'-테트라메틸-O-(1H-벤조트라이아졸-1- 일)우로늄 헥사플루오로포스페이트	HBTU
하이드록시벤조트라이아졸	HOBt
고압 액체 크로마토그래피	HPLC
헤르츠	Hz
아이소프로필 알코올	iPrOH, IPA
액체 크로마토그래피 및 질량 분석	LCMS
리튬 비스(트라이메틸실릴)아미드	LHMDS
몰	M
질량 대 전하 비	m/z
메타-클로로퍼옥시벤조산	mCPBA
요오드화메틸	MeI
메탄올	MeOH
밀리그램	mg
분	min
밀리리터	mL

[0279]

용어	두문자어
마이크로리터	μL
밀리몰	mmol
질량 분석	MS
노르말	N
N-브로모석신이미드	NBS
N-클로로석신이미드	NCS
N-요오도석신이미드	NIS
핵자기 공명	NMR
CF <sub>3</sub> SO <sub>3</sub> <sup>-</sup> 또는 트라이플레이트	OTf
팔라듐(II)비스(트라이페닐포스핀) 다이클로라이드	Pd(PPh <sub>3</sub> ) <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub>
테트라기스(트라이페닐포스핀)팔라듐(0)	Pd(PPh <sub>3</sub> ) <sub>4</sub>
[1,1'-비스(다이- <i>tert</i> -부틸포스포노)페로센]다이클로로팔라듐(II)	PdCl <sub>2</sub> (dtbpf) 또는 Pd(dtbpf) <sub>2</sub> Cl <sub>2</sub>
백만분율	ppm
침전물	ppt
폴리테트라플루오로에틸렌	PTFE
브로모트라이피로리디노포스포늄 헥사플루오로포스페이트	PyBroP®
체류 시간	R <sub>t</sub>
실온	rt
포화	sat
1-클로로메틸-4-플루오로-1,4- 다이아조니아바이사이클로[2.2.2]옥탄 비스(테트라플루오로보레이트)	셀렉트플루오르(Selectfluor)®
[2-(트라이메틸실릴)에톡시]메틸 아세탈	SEM
초임계 유체 크로마토그래피	SFC
온도	T
테트라- <i>n</i> -부틸암모늄 플루오라이드	TBAF
트라이에틸아민	TEA
트라이플루오로아세트산	TFA
테트라하이드로퓨란	THF
박층 크로마토그래피	TLC

[0280]

[0281]

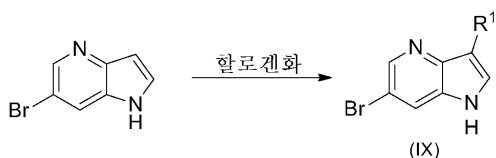
## 제조예

[0282]

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

[0283]

## 반응 도식 1

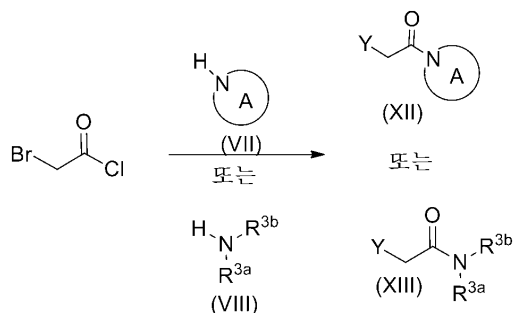


[0284]

[0285]

반응 도식 1에 따라, 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 당업자에게 공지된 조건 하에 할로겐화한다. 예를 들어, 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF 등에서 시약, 예컨대 NCS, NBS 등을 사용하여 할로겐화하여, R<sup>1</sup>이 Cl 또는 Br인 화학식 (IX)의 화합물을 얻는다. R<sup>1</sup>이 F인 화학식 (IX)의 화합물을 당업자에게 공지된 불소화 조건 하에, 예를 들어, 실온에서 적절한 용매, 예컨대 ACN 등에서 불소화제, 예컨대 셀렉트플루오르®, 피리딘과 반응시켜 제조한다.

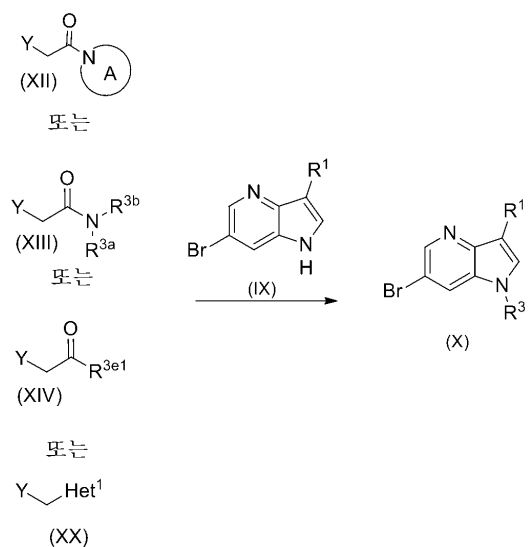
[0286] 반응 도식 2



[0287]

[0288] 반응 도식 2에 따라, 2-브로모아세틸 클로라이드를 -78℃ 내지 실온 범위의 온도에서 용매, 예컨대 아세토니트릴 (ACN) 중에서 적절한 염기, 예컨대 Et<sub>3</sub>N (TEA)의 존재 하에, A가 임의로 추가의 S, N 또는 O 원자를 포함하는 완전 포화 또는 부분 포화된 3원 내지 7원 고리인 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 적절히 치환된 화학식 (VII)의 헤테로사이클로알킬아민, 또는 R<sup>3a</sup> 및 R<sup>3b</sup>가 화학식 (I)에서 정의한 바와 같은 적절히 치환된 화학식 (VIII)의 아민과 반응시켜, 화학식 (XII) 또는 (XIII)의 화합물을 얻는다.

[0289] 반응 도식 3



[0290]

[0291] 반응 도식 3에 따라, R<sup>1</sup>이 H, Cl, F인 화학식 (IX)의 화합물을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF 중에서 염기, 예컨대 NaH를 사용하여, Y가 Cl, Br 또는 -OSO<sub>2</sub>Me인 화학식 (XII), (XIII), (XIV) 또는 (XX)의 화합물로 알킬화하여, 화학식 (X)의 화합물을 얻는다. 알킬화제가 화학식 (XIV)의 화합물인 경우, R<sup>3e1</sup>은 OC<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>1-5</sub>알킬 또는 사이클로프로필이다. 알킬화제가 화학식 (XX)의 화합물인 경우, Het<sup>1</sup>은 적절히 치환된 헤테로아릴, 예컨대 아이속사졸이고, Y는 Cl이다.

[0292] R<sup>1</sup>이 H인 화학식 (X)의 화합물을 상술한 조건을 사용하여 추가로 불소화하여, R<sup>1</sup>이 F인 화학식 (X)의 화합물을 얻는다.

[0293] 반응 도식 4



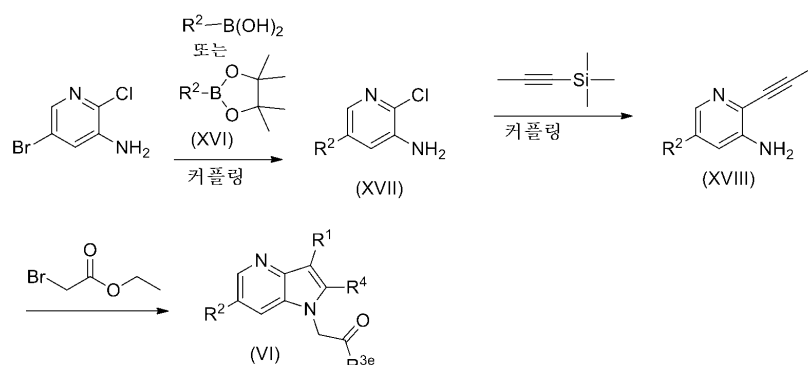
[0294]

[0295] 반응 도식 4에 따라,  $R^1$ 이 H 또는 Cl인 화학식 (IX)의 화합물을 금속 매개 크로스 커플링 반응에서 반응시켜,  $R^2$ 가 각각 할로, -CN,  $C_{1-5}$ 알킬 및  $C_{1-5}$ 할로알킬로부터 독립적으로 선택되는 1개, 2개 또는 3개의 구성원으로 임의로 치환되는 페닐, 피리디닐, 티에닐인 화학식 (XI)의 화합물을 얻는다. 예를 들어,  $R^1$ 이 H 또는 Cl인 화학식 (IX)의 화합물을 60 내지 90℃ 범위의 온도에서 약 16시간 동안 적절한 용매, 예컨대 1,4-다이옥산, DMF, 물 또는 이들의 혼합물 중에서 팔라듐 촉매, 예컨대  $PdCl_2(dtbpf)$ ,  $Pd(PPh_3)_4$  등, 염기, 예컨대  $K_3PO_4$ ,  $Na_2CO_3$  수용액,  $Cs_2CO_3$  등의 존재 하에 적절히 치환된 아릴 또는 헤테로아릴 보론산, 보로네이트 에스테르 등과 반응시켜, 화학식 (XI)의 화합물을 얻는다.

[0296]  $R^1$ 이 H이고,  $R^2$ 가 적절히 치환된 페닐인 화학식 (XI)의 화합물을 당업자에게 공지된 조건을 이용하여, 예를 들어 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF 등에서 NIS와 반응시켜,  $R^1$ 이 I인 화학식 (XI)의 화합물을 얻는다.

[0297] 추가의 방법에서,  $R^1$ 이 Br인 화학식 (XI)의 N1 질소를 당업자에게 공지된 조건을 이용하여, 적절한 질소 보호기, 예컨대 SEM으로 보호한다. 예를 들어, 브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF 중에서 염기, 예컨대 NaH 등의 존재 하에 2-클로로메톡시에틸)트라이메틸실란과 반응시켜, 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 얻는다.  $R^1$ 이 Br인 화합물의 트랜스할로겐화를 용매, 예컨대 THF 중에서 반응 조건, 예컨대  $tBuLi$  및 N-플루오로-N-(페닐설폰닐)벤젠설폰아미드 하에 달성하여,  $R^1$ 이 F인 화합물을 얻는다. 이어서 당업자에게 공지된 조건, 예컨대 약 60℃의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 THF 중에서 TBAF와의 반응 하에서의 SEM 기의 탈보호에 의해,  $R^1$ 이 F인 화학식 (XI)의 화합물을 얻는다.

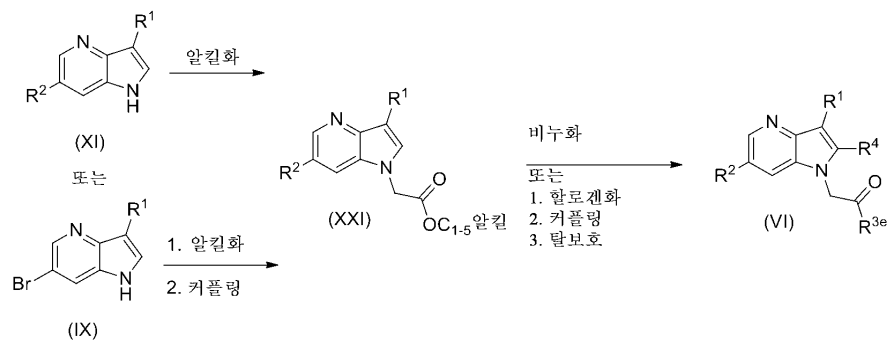
[0298] 반응 도식 5



[0299]

[0300] 반응 도식 5에 따라, 시판용이거나 합성에 의해 입수가 가능한 5-브로모-2-클로로피리딘-3-아민을 80℃에서 용매, 예컨대 다이옥산, 물 또는 이들의 혼합물 중에서 팔라듐 촉매, 예컨대  $Pd(dtbpf)_2Cl_2$  등, 염기, 예컨대  $K_3PO_4$ 의 존재 하에, 보론산, 또는  $R^2$ 가 적절히 치환된 페닐인 화학식 (XVI)의 보론산 에스테르와 커플링시켜, 화학식 (XVII)의 화합물을 얻는다. 화학식 (XVII)의 화합물을 팔라듐 촉매 소노가시라(Sonogashira) 크로스 커플링 반응 하에 약 90℃에서 용매, 예컨대 DMF,  $Et_2O$ , 다이옥산, THF 등에서 (트라이메틸실릴)알킨, 팔라듐 촉매, 예컨대  $Pd(PPh_3)_2Cl_2$  등, 리간드, 예컨대  $PPh_3$ , 구리(I) 공촉매, 예컨대  $CuI$ , 아민 염기, 예컨대  $Et_3N$ , DBU, DIPEA 등,  $CsF$ 와 반응시켜, 화학식 (XVIII)의 화합물을 얻는다. 화학식 (XVIII)의 화합물을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 약 12 내지 24시간 동안 적절한 용매, 예컨대 DMF 등에서 염기, 예컨대 NaH, 에틸 2-브로모아세테이트와 반응시켜,  $R^1$ 이 H이고,  $R^4$ 가  $CH_3$ 인 화학식 (VI)의 화합물을 얻는다.

[0301] 반응 도식 6



[0302]

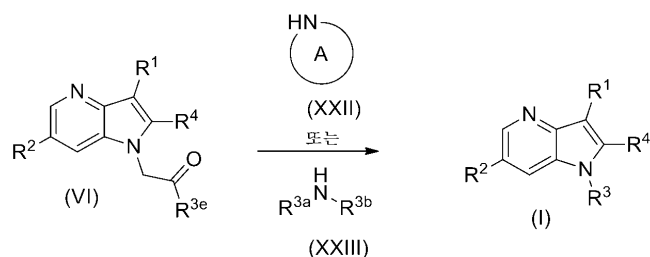
[0303] 반응 도식 6에 따라, 화학식 (VI)의 화합물을 화학식 (XI)의 화합물로부터 2단계로 제조한다. 제1 단계에서, R<sup>1</sup>이 H이고, R<sup>2</sup>가 적절히 치환된 페닐 또는 티에닐인 화학식 (XI)의 화합물을 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF 중에서 친전자체, 예컨대 에틸 2-브로모아세테이트, tert-부틸 2-브로모아세테이트 등, 염기, 예컨대 NaH 등으로 알킬화하여, R<sup>3e</sup>가 C<sub>1-5</sub>알킬인 화학식 (XXI)의 화합물을 얻는다. 대략 실온의 온도에서 용매, 예컨대 THF 및 물 중에서 염기성 조건, 예컨대 LiOH 등 하에서의 화학식 (XXI)의 에스테르 화합물의 비누화에 의해, R<sup>4</sup>가 H이고, R<sup>3e</sup>가 -OH인 화학식 (VI)의 화합물을 얻는다.

[0304] 화학식 (XXI)의 화합물을 화학식 (IX)의 화합물로부터 2단계로 제조한다. 제1 단계에서 화학식 (IX)의 화합물을 상술한 조건을 이용하여, 친전자체, 예컨대 에틸 2-브로모아세테이트, tert-부틸 2-브로모아세테이트 등으로 알킬화한다. 제2 단계에서, 상술한 조건을 이용하여, 적절히 치환된 페닐 또는 티에닐 보론산 또는 에스테르와 커플링시켜, 화학식 (XXI)의 화합물을 얻는다.

[0305] 경우에 따라서는, 개별 에스테르 (XXI)의 분리없이 *in situ* 에스테르 가수분해가 일어나서, R<sup>3e</sup>가 -OH인 화학식 (VI)의 화합물을 얻을 수 있음을 이해할 것이다.

[0306] 대체 방법에서, R<sup>1</sup>이 C<sub>1-5</sub>알킬이고, R<sup>2</sup>가 적절히 치환된 페닐이며, R<sup>4</sup>가 H인 화학식 (VI)의 화합물을 R<sup>1</sup>이 H인 화학식 (XXI)의 화합물로부터 3단계로 제조한다. 제1 단계에서, 상술한 조건을 이용하여, R<sup>1</sup>이 H인 화학식 (XXI)의 화합물의 브롬화에 의해, R<sup>1</sup>이 Br인 화합물을 얻는다. 제2 단계에서, 80 내지 110℃ 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대 DMF, ACN, 다이옥산, 자일렌 등에서 테트라메틸주석, 팔라듐 촉매, 예컨대 Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> 등, 첨가제, 예컨대 LiCl를 사용하여, R<sup>1</sup>이 Br인 할로겐화아릴 화합물의 전이금속 매개 전환 반응에 의해, R<sup>1</sup>이 CH<sub>3</sub>인 화합물을 얻는다. 이어서 당업자에게 공지된 조건을 이용하여, 예를 들어 0℃ 내지 실온 범위의 온도에서 용매, 예컨대 DCM 등에서 TFA와의 반응을 이용하여, 에스테르의 탈보호에 의해, R<sup>1</sup>이 CH<sub>3</sub>인 화학식 (VI)의 화합물을 얻는다.

[0307] 반응 도식 7

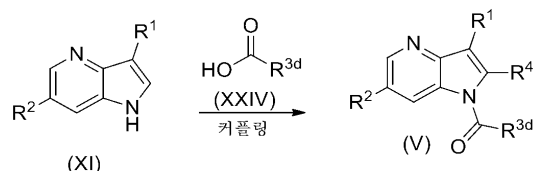


[0308]

[0309] 반응 도식 7에 따라, R<sup>1</sup> 및 R<sup>4</sup>가 H 또는 CH<sub>3</sub>이고, R<sup>2</sup>가 적절히 치환된 페닐 또는 티에닐인 화학식 (I)의 화합물을 통상적인 아미드 결합 형성 기술, 예컨대 당업자에게 잘 알려진 커플링 반응에 의해 제조한다. 예를 들어, 적절히 치환된 화학식 (XXII)의 헤테로사이클로알킬 아민, 또는 R<sup>3a</sup>가 H 또는 C<sub>1-5</sub>알킬이고, R<sup>3b</sup>가 C<sub>1-5</sub>알킬, C<sub>3-6</sub>사

이클로알킬인 화학식 (XXIII)의 아민과,  $R^{3e}$ 가 OH인 화학식 (VI)의 산 화합물의 반응에서, 상기 산은 임의로 HOBT 및/또는 촉매, 예컨대 DMAP; 할로트리스아미노포스포늄 염, 예컨대 BOP 또는 PyBroP; 적절한 피리디늄 염, 예컨대 2-클로로-1-메틸 피리디늄 클로라이드; 또는 다른 적절한 커플링제, 예컨대 HBTU, HATU 등의 존재 하에 적절한 활성화제, 예를 들어 카르보다이이미드, 예컨대 DCC 또는 EDCI로 활성화된다. 커플링 반응을 약 0°C 내지 실온 범위의 온도에서 임의로 삼차 아민, 예컨대 N-메틸모르폴린, N-에틸다이아이소프로필아민 또는 TEA의 존재 하에 적절한 용매, 예컨대 DCM, THF, DMF 등에서 행하여, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

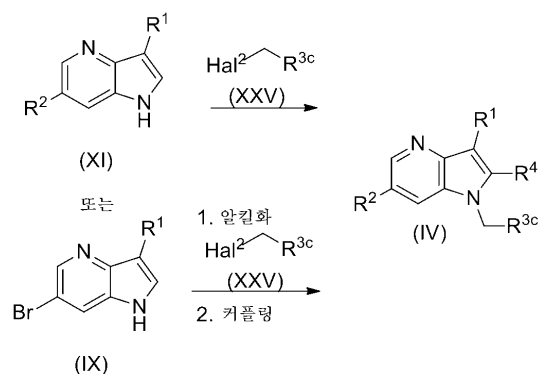
[0310] 반응 도식 8



[0311]

반응 도식 8에 따라,  $R^1$  및  $R^4$ 가 H인 화학식 (XI)의 화합물을 상술한 아마이드 결합 형성 조건 하에,  $R^{3d}$ 가 사이클로부틸 또는  $CH_2$ -사이클로프로필인 화학식 (XXIV)의 산과 반응시켜, 화학식 (V)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, HATU는 커플링 시약이고, DIPEA는 염기이며, DMF는 용매이다.

[0313] 반응 도식 9

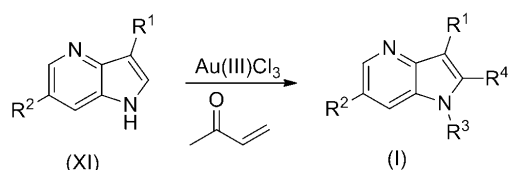


[0314]

반응 도식 9에 따라, 화학식 (XI)의 화합물을 상술한 알킬화 조건을 이용하여,  $Hal^2$ 가 Cl인 화학식 (XXV)의 헤테로아릴 알킬할라이드와 반응시켜,  $R^1$ 이 H 또는 할로이고,  $R^2$ 가 적절히 치환된 페닐 또는 티에닐이며,  $R^{3c}$ 가 적절히 치환된  $C_{3-6}$ 사이클로알킬, 적절히 치환된 3원 내지 6원 헤테로사이클로알킬 또는 적절히 치환된 5원 또는 6원 헤테로아릴 고리이고,  $R^4$ 가 H인 화학식 (IV)의 화합물을 얻는다. 바람직한 방법에서, 염기는 NaH이고, 용매는 DMF이다.

대체 방법에서,  $R^1$ 이 H인 화학식 (IX)의 화합물을  $Hal^2$ 가 Cl인 화학식 (XXV)의 헤테로아릴 알킬할라이드로 알킬화한 다음에, 제2 단계에서 상술한 바와 같이, 금속 매개 커플링 반응 하에 적절히 치환된 페닐 또는 티에닐 보론산 또는 에스테르와 반응시켜, 화학식 (IV)의 화합물을 얻는다.

[0317] 반응 도식 10

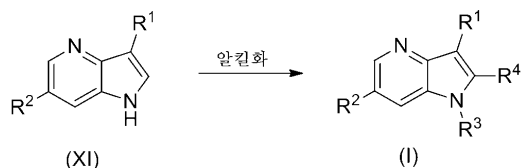


[0318]

반응 도식 10에 따라,  $R^1$ 이 H이고,  $R^2$ 가 적절히 치환된 페닐인 화학식 (XI)의 화합물을 약 100°C의 온도에서 용매, 예컨대 DCE 중에서 부트-3-엔-2-온,  $Au(III)Cl_3$ , 트라이플루오로메탄설폰산과 반응시켜,  $R^3$ 가

$\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{CH}_3$ 인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0320] 반응 도식 11



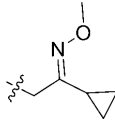
[0321]

[0322] 반응 도식 10에 따라, 화학식 (XI)의 화합물을 상술한 조건 하에, 예를 들어 (클로로메틸)(메틸)설파; 임의로 치환된  $\text{C}_{1-5}$ 할로알킬, 예컨대 1-브로모부탄, 1-브로모-3-메틸부탄, 1-브로모-2-메톡시에탄 등; (할로메틸) $\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬, 예컨대 (브로모메틸)사이클로프로판, (브로모메틸)사이클로부탄 등; (할로메틸)헤테로사이클로알킬, 예컨대 2-(브로모메틸)옥시란, 3-(브로모메틸)테트라하이드로푸란 등; 2-브로모-1-사이클로부틸에탄올; 2-브로모-1-사이클로프로필에탄올; 2-브로모-1-페닐에탄올; 1-브로모부탄-2-올; (할로메틸)헤테로아릴, 예컨대 3-(브로모메틸)피리딘, 5-(클로로메틸)-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸, 4-(클로로메틸)-1-메틸-1H-피라졸, 4-(클로로메틸)-1-메틸-1H-1,2,3-트리아졸 등; 1-(2-클로로에틸)-1H-피라졸; (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트; 또는 피리미딘-5-일메틸 메탄설포네이트와의 반응에 의해 상술한 알킬화 조건을 이용하여 알킬화하여, 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0323]  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{C}_{1-5}$ 알킬인 화학식 (I)의 화합물을  $^\circ$  내지 실온 범위의 온도에서 용매, 예컨대 THF, MeOH, 또는 이들의 혼합물 중에서 환원제, 예컨대  $\text{NaBH}_4$  등으로 환원시켜,  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{C}_{1-5}$ 알킬인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0324]  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을  $^\circ$  내지 실온 범위의 온도에서 적절한 용매, 예컨대  $\text{Et}_2\text{O}$ , THF, 또는 이들의 혼합물 중에서 그리냐르 시약, 예컨대 브롬화메틸마그네슘 등과 반응시켜,  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2(\text{CH}_3)(\text{OH})\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0325]  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2(\text{C}=\text{O})\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 적절한 용매, 예컨대 MeOH 등에서 O-메틸하이드록실아민

하이드로클로라이드, 염기, 예컨대  $\text{NaHCO}_3$  등과 반응시켜,  $\text{R}^3$ 가  인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0326]  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{OH})\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 당업자에게 공지된 조건, 예를 들어  $^\circ$  내지 실온 범위의 온도에서 용매, 예컨대 DCM 등에서의 불소화제, 예컨대 DAST 등과의 반응 하에 불소화하여,  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2\text{CH}(\text{F})\text{C}_{3-6}$ 사이클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0327]  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2\text{SCH}_3$ 인 화학식 (I)의 화합물을 당업자에게 공지된 조건, 예를 들어  $^\circ$  내지 실온 범위의 온도에서 용매, 예컨대 DCM 등에서의 산화제, 예컨대 mCPBA와의 반응 하에 산화시켜,  $\text{R}^3$ 가  $\text{CH}_2(\text{S}=\text{O})\text{CH}_3$  및  $\text{CH}_2(\text{SO}_2)\text{CH}_3$ 인 화학식 (I)의 화합물을 얻는다.

[0328] 화학식 (I)의 화합물은 당업자에게 공지된 방법을 사용하여 이의 대응하는 염으로 전환될 수 있다. 예를 들어, 화학식 (I)의 아민은 용매, 예컨대  $\text{Et}_2\text{O}$ ,  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ , THF, MeOH, 클로로포름 또는 아이소프로판올 중에서 트라이플루오로아세트산, HCl 또는 시트르산으로 처리되어, 대응하는 염 형태가 얻어진다. 대안적으로, 트라이플루오로아세트산 또는 포름산 염은 역상 HPLC 정제 조건의 결과로서 얻어진다. 화학식 (I)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.



- [0329] 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.
- [0330] 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.
- [0331] 하기 구체적인 실시예는 본 발명 및 다양한 바람직한 실시형태를 더욱더 설명하기 위해 제공된다.
- [0332] 실시예
- [0333] 하기 실시예에 기재된 화합물 및 대응하는 분석 데이터를 얻는데 있어서, 달리 지시하지 않는 한, 하기 실험 및 분석 프로토콜을 따랐다.
- [0334] 달리 언급하지 않는 한, 반응 혼합물을 질소 분위기하에 실온(rt)에서 자석 교반하였다. 용액을 "건조시키는" 경우에는, 이를 일반적으로 건조제, 예컨대  $\text{Na}_2\text{SO}_4$  또는  $\text{MgSO}_4$ 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.
- [0335] 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.
- [0336] 순상 실리카 겔 크로마토그래피(FCC)를 미리 충전된 카트리지를 사용하여 실리카 겔( $\text{SiO}_2$ ) 상에서 행하였다.
- [0337] 분취용 역상 고성능 액체 크로마토그래피(RP HPLC)를 다음 중 하나에서 행하였다:
- [0338] 방법 A. 엑스테라(Xterra) 분취용(Prep) RP18 컬럼( $5\ \mu\text{m}$ ,  $30 \times 100$  또는  $50 \times 150\ \text{mm}$ ) 또는 엑스브리지(XBridge) C18 OBD 컬럼( $5\ \mu\text{m}$ ,  $30 \times 100$  또는  $50 \times 150\ \text{mm}$ ), 20 mM  $\text{NH}_4\text{OH}$  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;
- [0339] 방법 B. 이너트실(Inertsil) ODS-3 컬럼( $3\ \mu\text{m}$ ,  $30 \times 100\ \text{mm}$ ,  $T = 45^\circ\text{C}$ ),  $\text{H}_2\text{O}$  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;
- [0340] 방법 C. 엑스브리지 C18 OBD 컬럼( $5\ \mu\text{m}$ ,  $50 \times 100\ \text{mm}$ ),  $\text{H}_2\text{O}$  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; 또는
- [0341] 방법 D. 엑스브리지 C18 컬럼( $5\ \mu\text{m}$ ,  $100 \times 50\ \text{mm}$ ), 80 mL/min의 유량에서의 10분간에 걸친 20 mM  $\text{NH}_4\text{OH}$  중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 2분간 유지의 이동상을 사용한 길슨(Gilson) HPLC.
- [0342] 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  $40^\circ\text{C}$ 로 가열하였다.
- [0343] 질량 스펙트럼(MS)은 달리 지시되지 않으면, 포지티브 모드에서 전기분무 이온화(ESI)를 사용하여 애질런트

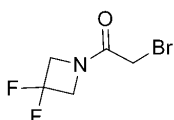
시리즈 1100 MSD 상에서 획득하였다. 계산된 (calcd.) 질량은 정확한 질량에 해당한다.

[0344] 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.

[0345] 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.

[0346] R\* 또는 S\*로 나타낸 화합물은 절대 배열이 결정되지 않은 순수한 거울상 이성질체 화합물이다.

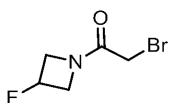
[0347] 중간체 1: 2-브로모-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0348]

[0349] -78°C에서 ACN (29 mL) 중의 3,3-다이플루오로아제티딘 하이드로클로라이드 (3 g, 23 mmol) 및 Et<sub>3</sub>N (3.2 mL, 23 mmol)의 용액에, 2-브로모아세틸 클로라이드 (1.9 mL, 23 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 서서히 실온으로 가온시켰다. 30분 후에, 물을 첨가하여, 수상을 DCM (3x)으로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (3.45 g, 70%)을 얻었다. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 4.66 (t, J = 12.5 Hz, 2H), 4.36 (t, J = 12.6 Hz, 2H), 4.26 (s, 2H).

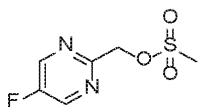
[0350] 중간체 2: 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0351]

[0352] 표제 화합물을 중간체 1과 유사한 방법으로 제조하였다. 본 화합물을 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온과 2-클로로-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온의 혼합물로서 분리하여, 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다.

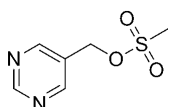
[0353] 중간체 3: (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트.



[0354]

[0355] 0°C에서 DCM (3 mL) 중의 (5-플루오로피리미딘-2-일)메탄올 (100 mg, 0.78 mmol)의 용액에, Et<sub>3</sub>N (0.16 mL, 1.2 mmol), 이어서 염화메탄설포닐 (79 μL, 1 mmol)을 첨가하였다. 30분 후에, 물 (10 mL) 및 포화 NaHCO<sub>3</sub> 수용액 (10 mL)을 첨가하였다. 수상을 DCM으로 2회 추출하여, 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (160 mg, 정량적 수율)을 얻었다. 물질을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다.

[0356] 중간체 4: 피리미딘-5-일메틸 메탄설포네이트.

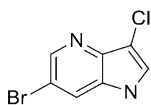


[0357]

[0358] 0°C에서 DCM (4 mL) 중의 5-피리미딘 메탄올 (110 mg, 0.999 mmol)의 용액에, Et<sub>3</sub>N (0.21 mL, 1.5 mmol), 이어

서 염화메탄설포닐 (0.10 mL, 1.3 mmol)을 첨가하였다. 30분 후에, 물 (10 mL) 및 포화 NaHCO<sub>3</sub> 수용액 (10 mL)을 첨가하였다. 수상을 DCM으로 2회 추출하여, 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (188 mg, 정량적 수율)을 얻었다. 물질을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다.

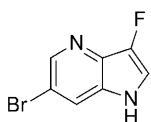
[0359] 중간체 5: 6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.



[0360]

[0361] 0°C에서 DMF (34 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (3 g, 15 mmol)의 용액에, NCS (2.4 g, 18 mmol)를 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 그 다음에 물을 첨가하여, 혼합물을 20분간 교반하였다. 표제 화합물을 여과에 의해 수집하여, 물 (2.6 g, 74%)로 세정하였다. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 11.74 (s, 1H), 8.45 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 8.09 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.86 (d, *J* = 3.0 Hz, 1H).

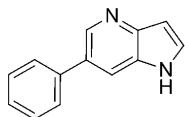
[0362] 중간체 6: 6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.



[0363]

[0364] ACN (20 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (2 g, 10.2 mmol) 및 셀렉트플루오르<sup>®</sup> (4.3 g, 12.2 mmol)의 용액에, 피리딘 (6 mL)을 첨가하였다. 실온에서 16시간 후에, 용매를 감압 하에 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 50 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (666 mg, 31%)을 얻었다. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 11.28 (s, 1H), 8.41 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 8.04 (t, *J* = 2.2 Hz, 1H), 7.71 (t, *J* = 2.6 Hz, 1H).

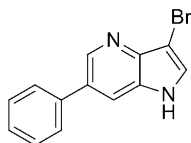
[0365] 중간체 7: 6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.



[0366]

[0367] 다이옥산 (100 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (400 mg, 2.03 mmol)의 용액에, 페닐보론산 (297 mg, 2.43 mmol), Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (149 mg, 0.203 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1.9 g, 6.09 mmol) 및 물 (10 mL)을 첨가하였다. 90°C에서 16시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (257 mg, 65%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>13</sub>H<sub>10</sub>N<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 194.1; *m/z* 실측치, 195.0 [M+H]<sup>+</sup>.

[0368] 중간체 8: 3-브로모-6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.

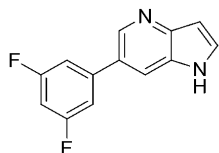


[0369]

[0370] 0°C에서 DMF (6 mL) 중의 6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 7, 526 mg, 2.708 mmol)의 용액에, N-브로모석신이미드 (NBS) (500 mg, 2.809 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 0°C에서 15분간 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (25 mL)에 부었다. 침전물을 수집하고, 물 (2 × 4 mL) 및 메탄올 (2 × 4 mL)로 세정하여, 담갈색 분말로서의 표제 화합물 (510 mg, 1.867 mmol, 69%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>13</sub>H<sub>9</sub>BrN<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치,

272.0; m/z 실측치, 273.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.78 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.88 (d,  $J$  = 2.9 Hz, 1H), 7.74 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.51 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.40 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H).

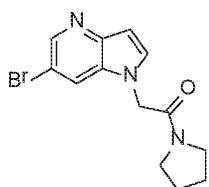
[0371] 중간체 9: 6-(3,5-다이플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.



[0372]

[0373] 표제 화합물을 중간체 7과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{13}H_8F_2N_2$ 에 대한 질량 계산치, 230.07; m/z 실측치, 231 =  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.61 – 11.38 (s, 1H), 8.75 – 8.56 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 8.16 – 7.85 (m, 1H), 7.77 – 7.65 (m, 1H), 7.62 – 7.39 (m, 2H), 7.29 – 7.04 (tt,  $J$  = 9.4, 2.3 Hz, 1H), 6.73 – 6.47 (d,  $J$  = 3.1 Hz, 1H).

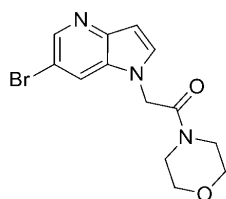
[0374] 중간체 10: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온.



[0375]

[0376] 0°C에서 DMF (20 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (1 g, 5.0 mmol)의 용액에, NaH (284 mg, 7.1 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 30분간 교반하고, DMF (5 mL) 중의 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (1.02 g, 5.3 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물 (1 mL)을 첨가하여, 반응 혼합물을 실리카 겔 상에서 농축시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , EtOAc 중의 0 내지 20% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (정량적 수율)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.37 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.1, 0.8 Hz, 1H), 7.58 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.58 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 3.56 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.37 – 3.25 (m, 2H), 2.01 – 1.90 (m, 2H), 1.86 – 1.75 (m, 2H).

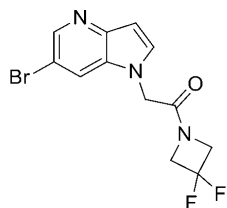
[0377] 중간체 11: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온.



[0378]

[0379] 표제 화합물을 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 대신에 2-브로모-1-모르폴리노에탄온을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.37 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.58 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.69 (t,  $J$  = 4.8 Hz, 2H), 3.60 (t,  $J$  = 4.9 Hz, 2H), 3.54 (t,  $J$  = 4.8 Hz, 2H), 3.44 (t,  $J$  = 4.8 Hz, 2H).

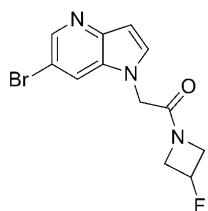
[0380] 중간체 12: 2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0381]

[0382] 표제 화합물을 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 대신에 2-브로모-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 1)을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{12}H_{10}BrF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.0;  $m/z$  실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .

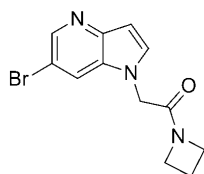
[0383] 중간체 13: 2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0384]

[0385] 표제 화합물을 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 대신에 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 2)을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{12}H_{11}BrFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.0;  $m/z$  실측치, 312.0  $[M+H]^+$ .

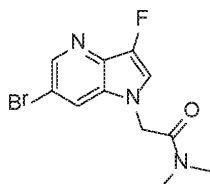
[0386] 중간체 14: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[0387]

[0388] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-브로모에탄온 및 6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.44 – 8.31 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.19 – 8.11 (m, 1H), 7.66 – 7.43 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.64 – 6.50 (m, 1H), 5.02 – 4.85 (s, 2H), 4.29 – 4.15 (m, 2H), 3.96 – 3.81 (m, 2H), 2.34 – 2.20 (m, 2H).

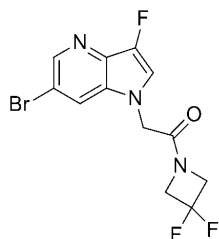
[0389] 중간체 15: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0390]

[0391] 표제 화합물을 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 대신에 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드를 사용하고, 6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 대신에 6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 (중간체 6)을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.42 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.29 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

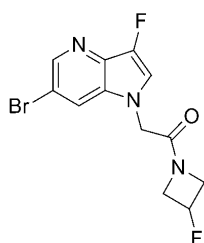
[0392] 중간체 16: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0393]

[0394] 표제 화합물을 2-브로모-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 1) 및 6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 (중간체 6)을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.52 – 8.39 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.34 – 8.21 (m, 1H), 7.73 – 7.53 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 5.07 – 4.89 (s, 2H), 4.83 – 4.56 (m, 2H), 4.46 – 4.25 (m, 2H).

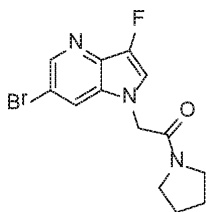
[0395] 중간체 17: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0396]

[0397] 표제 화합물을 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 2) 및 6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 (중간체 6)을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.51 – 8.36 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.36 – 8.17 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.70 – 7.63 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 5.60 – 5.48 (m, 0.5H), 5.48 – 5.31 (m, 0.5H), 5.07 – 4.79 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 2H), 4.69 – 4.47 (m, 1H), 4.40 – 4.17 (m, 2H), 4.14 – 3.87 (m, 1H).

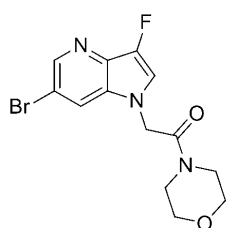
[0398] 중간체 18: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온.



[0399]

[0400] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 10)을 사용하여, 중간체 6과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.36 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.36 – 8.21 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.76 – 7.57 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 5.13 – 4.86 (s, 2H), 3.62 – 3.47 (m, 2H), 3.41 – 3.17 (s, 2H), 2.03 – 1.86 (m, 2H), 1.86 – 1.66 (m, 2H).

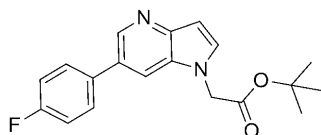
[0401] 중간체 19: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온.



[0402]

[0403] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11)을 사용하여, 중간체 6과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{13}H_{13}BrFN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 341.0; m/z 실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .

[0404] 중간체 20: tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트.

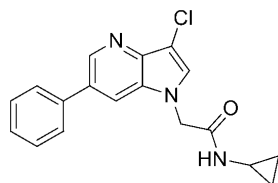


[0405]

[0406] 단계 A: 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 중간체 7과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.39 (s, 1H), 8.60 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.95 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 2H), 6.60 – 6.56 (m, 1H).

[0407] 단계 B: tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. 표제 화합물을 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 8.6, 5.5 Hz, 2H), 7.66 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.34 (t,  $J$  = 8.8 Hz, 2H), 6.61 (d,  $J$  = 3.0 Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 1.41 (s, 9H).

[0408] 실시예 1: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드.



[0409]

[0410] 단계 A: 6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 다이옥산 (100 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (400 mg, 2.03 mmol)의 용액에, 페닐보론산 (297 mg, 2.43 mmol), Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (149 mg, 0.203 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (1.9 g, 6.09 mmol) 및 물 (10 mL)을 첨가하였다. 90°C에서 16시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (257 mg, 65%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{13}H_{10}N_2$ 에 대한 질량 계산치, 194.1; m/z 실측치, 195.0  $[M+H]^+$ .

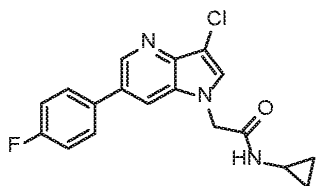
[0411] 단계 B: 3-클로로-6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 0°C에서 N,N-다이메틸포름아미드 (6 mL) 중의 6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (600 mg, 3.09 mmol)의 용액에, N-클로로석신이미드 (619 mg, 4.64 mmol)를 여러 번 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 5시간 동안 연속 교반하였다. 혼합물을 물 (30 mL)에 부었다. 침전물을 수집하고, 따뜻한 메탄올 (5 mL)로 세정하여, 담갈색 분말로서의 표제 화합물 (503 mg, 2.20 mmol, 71%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{13}H_9ClN_2$ 에 대한 질량 계산치, 229.0; m/z 실측치, 229  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.68 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.86 (d,  $J$  = 2.9 Hz, 1H), 7.74 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.51 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.40 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H).

[0412] 단계 C: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드. 0°C에서 아르곤 하에 무수 DMF (1.4 mL) 중의 3-클로로-6-페닐-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (70 mg, 0.306 mmol)의 용액에, NaH (60% 분산액, 18 mg, 0.46 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반하였다. 반응 혼합물을 0°C로 냉각시켜, 혼합물에 2-브로모-N-사이클로프로필아세트아미드 (81 mg, 0.46 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 2시간 동안 연속 교반하였다. 반응 혼합물을 빙수 (10 mL)에 부었다. 침전물을 수집하여, 물 (2 × 3 mL)로 세정하였다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 100:1 내지 95:5 클로로포름/MeOH). 생성물을 따뜻한 에탄올 (1 mL)로 트리투레이션(trituration)하여, 황백색 분말로서의 표제 화합물 (30 mg, 0.09 mmol, 30%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.1; m/z 실측치, 326  $[M+H]^+$ .  $^1H$



NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.74 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.76 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.52 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 2.71 – 2.58 (m, 1H), 0.68 – 0.57 (m, 2H), 0.51 – 0.33 (m, 2H).

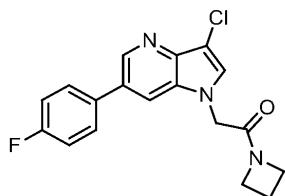
[0413] 실시예 2: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드.



[0414]

[0415] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.31 (d,  $J$  = 4.2 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 8.6, 5.3 Hz, 2H), 7.35 (t,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 4.88 (s, 2H), 2.71 – 2.60 (m, 1H), 0.69 – 0.57 (m, 2H), 0.50 – 0.39 (m, 2H).

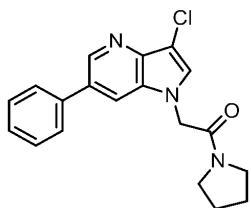
[0416] 실시예 3: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0417]

[0418] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.86 – 7.74 (m, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.36 (t,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 5.01 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.28 (quint,  $J$  = 7.8 Hz, 2H).

[0419] 실시예 4: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

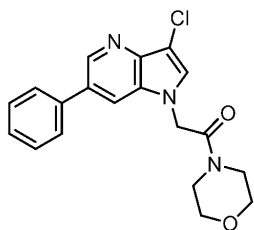


[0420]

[0421] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.77 (d,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 7.52 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.58 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.37 – 3.26 (m, 2H), 1.97 (quint,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 1.81 (quint,  $J$  = 6.9 Hz, 2H).



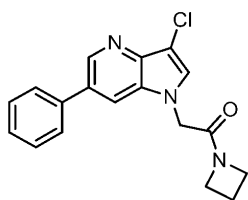
[0422] 실시예 5: 2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온.



[0423]

[0424] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}ClN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.73 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.76 (d,  $J = 7.0$  Hz, 2H), 7.52 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.41 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.90 - 3.37 (m, 8H).

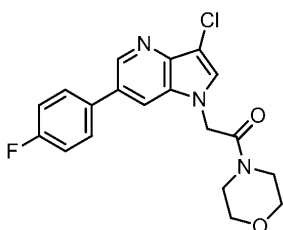
[0425] 실시예 6: 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[0426]

[0427] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.1; m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.73 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.77 (d,  $J = 7.2$  Hz, 2H), 7.53 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.41 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.28 (quint,  $J = 7.7$  Hz, 2H).

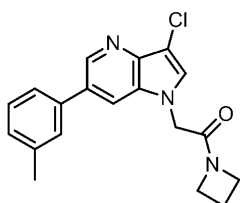
[0428] 실시예 7: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0429]

[0430] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 374.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.85 - 7.72 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 7.36 (t,  $J = 8.7$  Hz, 2H), 5.30 (s, 2H), 3.80 - 3.65 (m, 2H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 3.50 - 3.37 (m, 2H).

[0431] 실시예 8: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

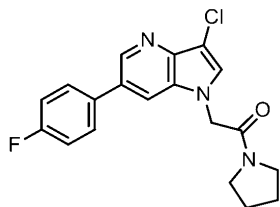


[0432]

[0433] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;

m/z 실측치, 340.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.55 (d,  $J$  = 8.2 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.23 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.28 (quint,  $J$  = 7.8 Hz, 2H).

[0434] 실시예 9: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

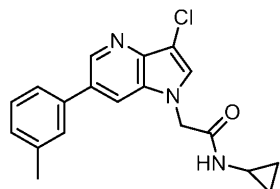


[0435]

[0436] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1;

m/z 실측치, 358.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.80 (dd,  $J$  = 8.4, 6.1 Hz, 2H), 7.77 (s, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 5.18 (s, 2H), 3.58 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.36 - 3.20 (m, 2H), 1.97 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 1.81 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H).

[0437] 실시예 10: 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드.

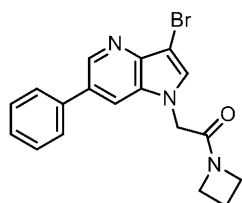


[0438]

[0439] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;

m/z 실측치, 340.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.33 (d,  $J$  = 4.2 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.53 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 2.70 - 2.58 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.70 - 0.53 (m, 2H), 0.50-0.29 (m, 2H).

[0440] 실시예 11: 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.

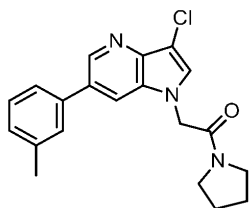


[0441]

[0442] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 369.0;

m/z 실측치, 370.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.74 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.77 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 7.53 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.30 (quint,  $J$  = 7.5 Hz, 2H).

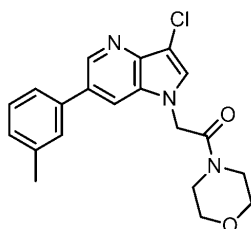
[0443] 실시예 12: 2-[3-클로로-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0444]

[0445] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1;  $m/z$  실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.40 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.22 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.59 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.39 - 3.24 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.97 (quint,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 1.81 (quint,  $J = 6.8$  Hz, 2H).

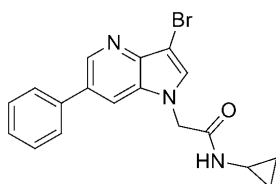
[0446] 실시예 13: 2-[3-클로로-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0447]

[0448] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}ClN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 369.1;  $m/z$  실측치, 370.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.53 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.40 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.22 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.85 - 3.65 (m, 2H), 3.65 - 3.50 (m, 4H), 3.50 - 3.37 (m, 2H), 2.41 (s, 3H).

[0449] 실시예 14: 2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)-*N*-사이클로프로필-아세트아미드.



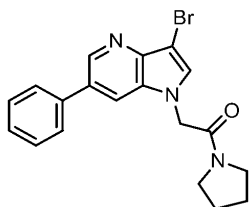
[0450]

[0451] 단계 A: 3-브로모-6-페닐-1*H*-피롤로[3,2-*b*]피리딘. 0°C에서 DMF (6 mL) 중의 6-페닐-1*H*-피롤로[3,2-*b*]피리딘 (중간체 7, 526 mg, 2.708 mmol)의 용액에, *N*-브로모석신이미드 (NBS) (500 mg, 2.809 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 0°C에서 15분간 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (25 mL)에 부었다. 침전물을 수집하고, 물 (2 × 4 mL) 및 메탄올 (2 × 4 mL)로 세정하여, 담갈색 분말로서의 표제 화합물 (510 mg, 1.867 mmol, 69%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{13}H_9BrN_2$ 에 대한 질량 계산치, 272.0;  $m/z$  실측치, 273.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  11.78 (s, 1H), 8.71 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.88 (d,  $J = 2.9$  Hz, 1H), 7.74 (d,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 7.51 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.40 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H).

[0452] 단계 B: 2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)-*N*-사이클로프로필-아세트아미드. 0°C에서 아르곤 하에 무수 DMF (1.5 mL) 중의 3-브로모-6-페닐-1*H*-피롤로[3,2-*b*]피리딘 (60 mg, 0.22 mmol)의 용액에, NaH (60% 분산액, 13 mg, 0.33 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반하였다. 반응 혼합물을 0°C로 냉각시켜, 혼합물에 2-브로모-*N*-사이클로프로필아세트아미드 (43 mg, 0.24 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 1시간 동안 연속 교반하였다. 반응 혼합물을 빙수 (6 mL)에 붓고, 침전물을 수집하여, 물 (2 × 0.5 mL)로 세정하였다. 조생성물을 에탄올 (1.7 mL)로 재결정하여, 백색 분말로

서의 표제 화합물 (49 mg, 0.13 mmol, 60%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 369.0; m/z 실측치, 370  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.74 (s, 1H), 8.35 (d,  $J$  = 4.1 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.76 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.52 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 2.71 – 2.59 (m, 1H), 0.68 – 0.55 (m, 2H), 0.49 – 0.36 (m, 2H).

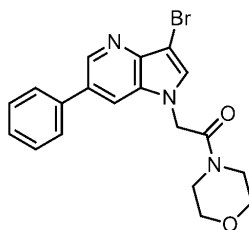
[0453] 실시예 15: 2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0454]

[0455] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (s, 1H), 8.23 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.76 (d,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 7.52 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.40 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.34 – 3.23 (m, 2H), 1.97 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 1.82 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H).

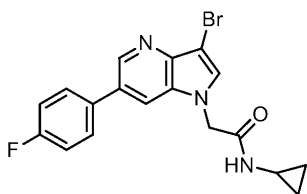
[0456] 실시예 16: 2-(3-브로모-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온.



[0457]

[0458] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}BrN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 399.1; m/z 실측치, 400.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.75 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 7.52 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 7.41 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 3.80 – 3.65 (m, 2H), 3.65 – 3.50 (m, 4H), 3.51 – 3.37 (m, 2H).

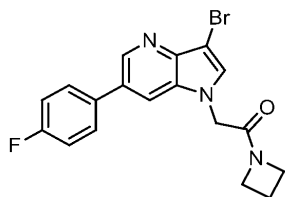
[0459] 실시예 17: 2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드.



[0460]

[0461] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}BrFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.34 (d,  $J$  = 4.1 Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.80 (dd,  $J$  = 8.5, 5.5 Hz, 2H), 7.36 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 2H), 4.90 (s, 2H), 2.70 – 2.58 (m, 1H), 0.68 – 0.57 (m, 2H), 0.50 – 0.38 (m, 2H).

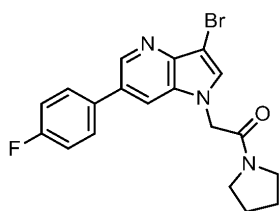
[0462] 실시예 18: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0463]

[0464] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}BrFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.87 - 7.74 (m, 2H), 7.81 (s, 1H), 7.36 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 2H), 5.02 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.28 (quint,  $J$  = 7.7 Hz, 2H).

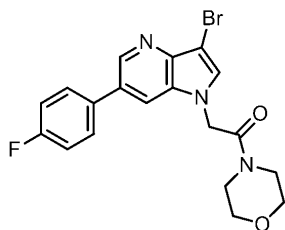
[0465] 실시예 19: 2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0466]

[0467] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}BrFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.88 - 7.70 (m, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 2H), 5.19 (s, 2H), 3.58 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.38 - 3.25 (m, 2H), 1.97 (quint,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 1.81 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H).

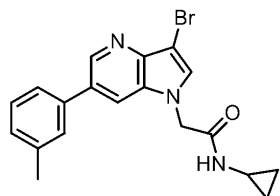
[0468] 실시예 20: 2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0469]

[0470] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}BrFN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 417.0; m/z 실측치, 418.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.86 - 7.74 (m, 2H), 7.80 (s, 1H), 7.36 (t,  $J$  = 8.6 Hz, 2H), 5.31 (s, 2H), 3.76 - 3.65 (m, 2H), 3.64 - 3.51 (m, 4H), 3.51 - 3.38 (m, 2H).

[0471] 실시예 21: 2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드.

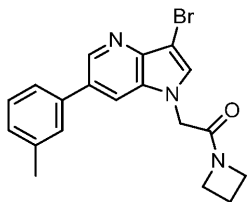


[0472]

[0473] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1;

m/z 실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.35 (d,  $J$  = 4.1 Hz, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 2.71 – 2.59 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 0.70 – 0.57 (m, 2H), 0.50 – 0.37 (m, 2H).

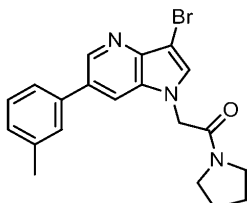
[0474] 실시예 22: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온.



[0475]

[0476] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.53 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.28 (quint,  $J$  = 7.8 Hz, 2H).

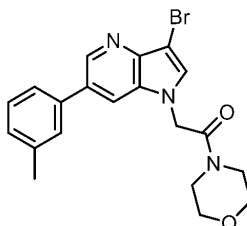
[0477] 실시예 23: 2-[3-브로모-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0478]

[0479] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1; m/z 실측치, 398.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.33 – 3.24 (m, 2H), 2.41 (s, 3H), 1.96 (quint,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 1.82 (quint,  $J$  = 6.8 Hz, 2H).

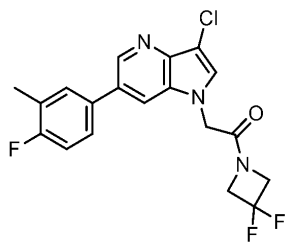
[0480] 실시예 24: 2-[3-브로모-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0481]

[0482] 표제 화합물을 실시예 14와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}BrN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.56 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 3.93-3.66 (m, 2H), 3.66-3.50 (m, 4H), 3.50-3.37 (m, 2H), 2.41 (s, 3H).

[0483] 실시예 25: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



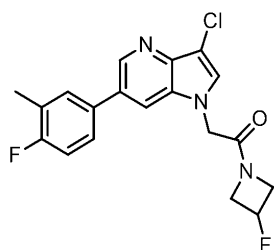
[0484]

[0485]

표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 393.1; m/z 실측치, 394.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 6.8 Hz, 1H), 7.63 – 7.52 (m, 1H), 7.29 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.76 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 4.38 (t,  $J$  = 12.6 Hz, 2H), 2.34 (s, 3H).

[0486]

실시예 26: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



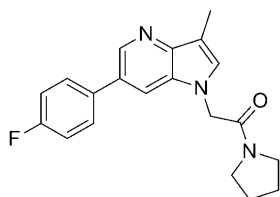
[0487]

[0488]

표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 7.64 – 7.54 (m, 1H), 7.28 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.62 – 5.32 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.67 – 4.49 (m, 1H), 4.45 – 4.13 (m, 2H), 4.08 – 3.86 (m, 1H), 2.34 (s, 3H).

[0489]

실시예 27: 2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0490]

[0491]

단계 A: 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.39 (s, 1H), 8.60 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.95 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.36 – 7.28 (m, 2H), 6.60 – 6.56 (m, 1H).

[0492]

단계 B: tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. 표제 화합물을 tert-부틸 2-브로모아세테이트 및 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 사용하여, 실시예 1, 단계 C와 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 8.6, 5.5 Hz, 2H), 7.66 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.34 (t,  $J$  = 8.8 Hz, 2H), 6.61 (d,  $J$  = 3.0 Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 1.41 (s, 9H).

[0493]

단계 C: tert-부틸 2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. DMF (10 mL) 중의 tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트 (516 mg, 1.58 mmol)의 용액에, N-브로모석신아미드 (NBS) (281 mg, 1.58 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 50°C에서 2시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물에 부어, EtOAc로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여,

농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 0 내지 100% EtOAc/헥산)에 의해, 표제 화합물 (640 mg, 37%)을 얻었다.

[0494]

단계 D: tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. 밀봉관에서 Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (272 mg, 0.39 mmol)를 DMF (5 mL) 중의 tert-부틸 2-(3-브로모-6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트 (1.6 g, 3.9 mmol), 테트라메틸스탄난 (2.1 mL, 15 mmol) 및 LiCl (656 mg, 15 mmol)의 용액에 첨가하였다. 반응 혼합물을 12시간 동안 110℃로 가열하여, 물, 이어서 EtOAc를 첨가하였다. 유기층을 분리하여, MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고, 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 50% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.3 g, 22%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>20</sub>H<sub>21</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 340.2; m/z 실측치, 341.0 [M+H]<sup>+</sup>.

[0495]

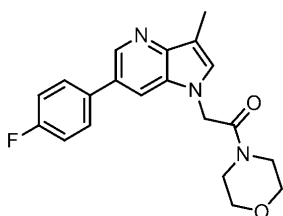
단계 E: 2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트산. 0℃로 냉각된 DCM (6 mL) 중의 tert-부틸 2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트 (290 mg, 0.85 mmol)의 용액에, TFA (6 mL, 78 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 휘발성 물질을 증발시켜, 조생성물을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 그대로 사용하였다.

[0496]

단계 F: 2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온. DMF (5 mL) 중의 2-(6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트산 (80 mg, 0.28 mmol)의 용액에, DIPEA (151 μL, 1.1 mmol) 및 HBTU (160 mg, 0.42 mmol)를 첨가하였다. 30분 후에, DMF (0.2 mL) 중의 피롤리딘 (35 μL, 0.42 mmol)을 첨가하여, 반응 혼합물을 추가로 30분간 교반하였다. 포화 NaHCO<sub>3</sub> 수용액, 이어서 EtOAc를 첨가하였다. 유기상을 분리하여, MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고, 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (31 mg, 32%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>20</sub>H<sub>20</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO) δ 8.60 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.05 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 7.82 – 7.69 (m, 2H), 7.42 – 7.25 (m, 3H), 5.09 (s, 2H), 3.57 (t, J = 6.7 Hz, 2H), 3.33 – 3.24 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.02 – 1.88 (m, 2H), 1.87 – 1.72 (m, 2H).

[0497]

실시예 28: 2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



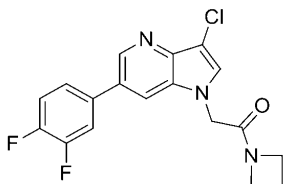
[0498]

[0499]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>20</sub>H<sub>20</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 353.2; m/z 실측치, 354.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO) δ 8.59 (d, J = 1.6 Hz, 1H), 8.02 (d, J = 1.7 Hz, 1H), 7.75 (dd, J = 8.5, 5.6 Hz, 2H), 7.39 – 7.25 (m, 3H), 5.21 (s, 2H), 3.75 – 3.64 (m, 2H), 3.64 – 3.51 (m, 4H), 3.49 – 3.39 (m, 2H), 2.30 (s, 3H).

[0500]

실시예 29: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0501]

[0502]

단계 A: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온. 0℃에서 DMF (60 mL) 중의 6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 5, 250 mg, 1.08 mmol)의 용액에, NaH (60 mg, 1.51 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반한 다음에, 0℃로 냉각시킨 후, DMF 중의 1-(아제티딘-1-일)-2-브로모에탄온 (1.29 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을

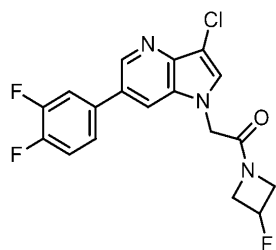


실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (247 mg, 70%)을 얻었다.

[0503] MS (ESI): C<sub>12</sub>H<sub>11</sub>BrClN<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 327.0; m/z 실측치, 328.0 [M+H]<sup>+</sup>.

[0504] 단계 B: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제 화합물을 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>ClF<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 361.9 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.76 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.27 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.90 (ddd, J = 12.3, 7.8, 2.2 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.69 – 7.52 (m, 2H), 5.01 (s, 2H), 4.25 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 2.36 – 2.22 (m, 2H).

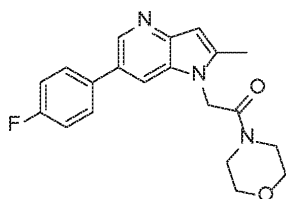
[0505] 실시예 30: 2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0506]

[0507] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>13</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (300 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.76 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.89 (ddd, J = 10.4, 7.3, 1.8 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.72 – 7.49 (m, 2H), 5.48 (d, J = 57.3 Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.70 – 4.46 (m, 1H), 4.37 (dd, J = 26.4, 15.7 Hz, 1H), 4.29 – 4.11 (m, 1H), 3.98 (dd, J = 25.0, 11.6 Hz, 1H).

[0508] 실시예 31: 2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0509]

[0510] 단계 A: 2-클로로-5-(4-플루오로페닐)피리딘-3-아민. 다이옥산 (100 mL) 및 물 (25 mL) 중의 5-브로모-2-클로로피리딘-3-아민 (5 g, 24 mmol) 및 (4-플루오로페닐)보론산 (4 g, 29 mmol)의 용액에, K<sub>3</sub>PO<sub>4</sub> (15 g, 72 mmol), 이어서 PdCl<sub>2</sub>(dtbpf) (393 mg, 0.60 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 탈가스한 후에, 2시간 동안 80℃로 가열하였다. 실온으로 냉각되면, 물 및 EtOAc를 반응 혼합물에 첨가하였다. 수상을 EtOAc (3x)로 추출하였다. 합한 유기층을 수세하여, 건조시키고 (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (6 g, 76%)을 얻었다. 조생성물을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다.

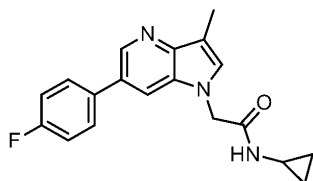
[0511] 단계 B: 5-(4-플루오로페닐)-2-(프로프-1-인-1-일)피리딘-3-아민. DMF (100 mL) 중의 2-클로로-5-(4-플루오로페닐)피리딘-3-아민 (2 g, 6.7 mmol) 및 트라이메틸(프로프-1-인-1-일)실란 (12 mL, 82 mmol)의 용액에, Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (600 mg, 0.86 mmol), 요오드화구리(I) (100 mg, 0.53 mmol), CsF (13 g, 86 mmol) 및 Et<sub>3</sub>N (22 mL, 158 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 90℃에서 5시간 동안 교반하였다. 휘발성 물질을 증발시키고, 물을 잔류물에 첨가하여, EtOAc로 3회 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (Na<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 석유 에테르 중의 0 내지 80% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (250 mg, 14%)을 얻었다. MS

(ESI):  $C_{14}H_{11}FN_2$ 에 대한 질량 계산치, 226.1;  $m/z$  실측치, 227.0  $[M+H]^+$

[0512] 단계 C: 2-(6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트산. 0°C로 냉각된 DMF (10 mL) 중의 5-(4-플루오로페닐)-2-(프로프-1-인-1-일)피리딘-3-아민 (100 mg, 0.44 mmol)의 용액에, NaH (35 mg, 0.88 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 그 다음에 반응 혼합물을 실온으로 가온시켰다. 12시간 후에, 반응물을 0°C로 냉각시키고, NaH (25 mg, 0.63 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하여, 이 온도에서 30분간 교반하였다. 에틸 2-브로모아세테이트 (60  $\mu$ L, 0.54 mmol)를 적가하여, 혼합물을 실온에서 5시간 동안 교반하였다. 0°C에서 물을 첨가하여, 수상을 MTBE로 추출하였다. 수층을 1M HCl로 산성화하고, 휘발성 물질을 증발시켜, 표제 화합물 (100 mg, 55%)을 얻었다. 조생성물을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}FN_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 284.1;  $m/z$  실측치, 285.0  $[M+H]^+$

[0513] 단계 D: 2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온. DMF (5 mL) 중의 2-(6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트산 (100 mg, 0.24 mmol) 중간체, 모르폴린 (37 mg, 0.43 mmol), HATU (170 mg, 0.45 mmol) 및  $Et_3N$  (63  $\mu$ L, 0.45 mmol)의 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 수상을  $EtOAc$ 로 3회 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 ( $Na_2SO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. HPLC 방법 A로 정제하여, 표제 화합물 (30 mg, 33%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.2;  $m/z$  실측치, 354.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.53 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.76 (dd,  $J = 5.5, 8.5$  Hz, 2H), 7.32 (t,  $J = 8.9$  Hz, 2H), 6.38 (s, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.72 (br. s., 2H), 3.61 (d,  $J = 14.6$  Hz, 4H), 3.44 (br. s., 2H), 2.34 (s, 3H).

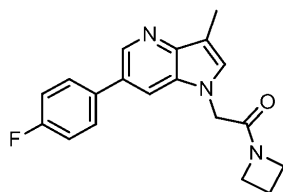
[0514] 실시예 32: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0515]

[0516] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 7.75 – 7.48 (m, 3H), 7.36 – 7.03 (m, 3H), 5.47 (br s, 1H), 4.75 (s, 2H), 2.72 – 2.60 (m, 1H), 2.45 (s, 3H), 0.91 – 0.63 (m, 2H), 0.48 – 0.15 (m, 2H).

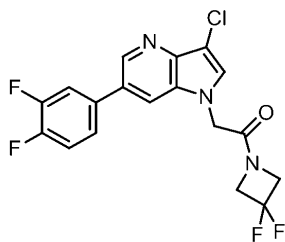
[0517] 실시예 33: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0518]

[0519] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (s, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.82 – 7.70 (m, 2H), 7.43 – 7.25 (m, 3H), 4.93 (s, 2H), 4.19 (t,  $J = 7.4$  Hz, 2H), 3.89 (t,  $J = 7.4$  Hz, 2H), 2.37 – 2.15 (m, 5H).

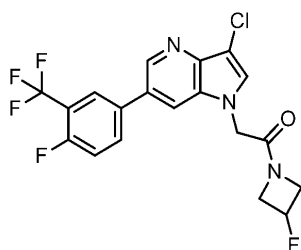
[0520] 실시예 34: 2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0521]

[0522] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1;  $m/z$  실측치, 398.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.88 (dd,  $J = 12.0$ , 8.2 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.72 - 7.52 (m, 2H), 5.14 (s, 2H), 4.76 (t,  $J = 12.4$  Hz, 2H), 4.38 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H).

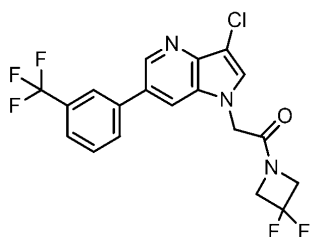
[0523] 실시예 35: 2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0524]

[0525] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 429.1;  $m/z$  실측치, 430.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.78 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.32 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 - 8.06 (m, 2H), 7.84 (s, 1H), 7.69 (t,  $J = 9.6$  Hz, 1H), 5.62 - 5.32 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.68 - 4.48 (m, 1H), 4.45 - 4.15 (m, 2H), 4.07 - 3.86 (m, 1H).

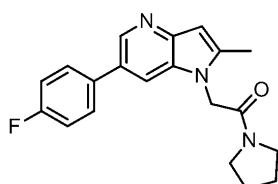
[0526] 실시예 36: 2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0527]

[0528] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 429.1;  $m/z$  실측치, 430.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.81 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.15 - 7.98 (m, 2H), 7.84 (s, 1H), 7.81 - 7.70 (m, 2H), 5.17 (s, 2H), 4.76 (t,  $J = 12.5$  Hz, 2H), 4.38 (t,  $J = 12.5$  Hz, 2H).

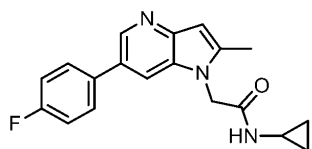
[0529] 실시예 37: 2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0530]

[0531] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;  $m/z$  실측치, 338.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.58 (br. s., 1H), 7.48 – 7.62 (m, 3H), 7.15 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 2H), 6.55 (s, 1H), 4.82 (s, 2H), 3.54 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 2H), 3.48 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.06 (quin,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 1.84 – 1.96 (m, 2H).

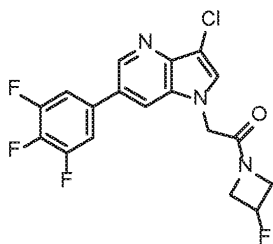
[0532] 실시예 38: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0533]

[0534] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (br. s., 1H), 7.50 – 7.63 (m, 3H), 7.12 – 7.23 (m, 2H), 6.57 (s, 1H), 5.39 (br. s., 1H), 4.75 (s, 2H), 2.67 (qt,  $J$  = 3.6, 7.1 Hz, 1H), 2.45 (s, 3H), 0.70 – 0.80 (m, 2H), 0.30 – 0.41 (m, 2H).

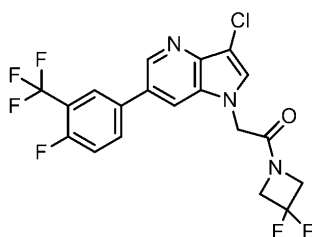
[0535] 실시예 39: 2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0536]

[0537] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1;  $m/z$  실측치, 398.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.80 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.92 – 7.74 (m, 3H), 5.63 – 5.34 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.68 – 4.49 (m, 1H), 4.44 – 4.17 (m, 2H), 4.08 – 3.87 (m, 1H).

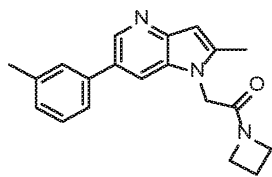
[0538] 실시예 40: 2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0539]

[0540] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{12}ClF_6N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 447.1;  $m/z$  실측치, 448.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.79 (s, 1H), 8.32 (s, 1H), 8.22 – 8.02 (m, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.69 (t,  $J$  = 9.7 Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.76 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 4.38 (t,  $J$  = 12.6 Hz, 2H).

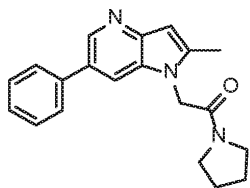
[0541] 실시예 41: 1-(아제티딘-1-일)-2-[2-메틸-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온.



[0542]

[0543] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2;  $m/z$  실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.39 - 7.47 (m, 2H), 7.31 - 7.38 (m, 1H), 7.18 (d,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 4.73 (s, 2H), 4.05 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.16 (quin,  $J$  = 7.8 Hz, 2H).

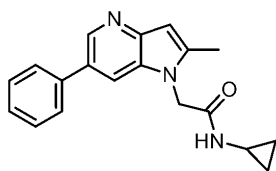
[0544] 실시예 42: 2-(2-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0545]

[0546] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2;  $m/z$  실측치, 320.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.60 (br. s., 1H), 7.59 (d,  $J$  = 7.3 Hz, 3H), 7.44 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.29 - 7.38 (m, 1H), 6.54 (s, 1H), 4.81 (s, 2H), 3.48 (td,  $J$  = 6.8, 20.0 Hz, 4H), 2.44 (s, 3H), 2.03 (quin,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 1.82 - 1.92 (m, 2H).

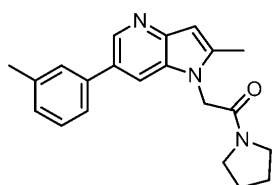
[0547] 실시예 43: N-사이클로프로필-2-(2-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)아세트아미드.



[0548]

[0549] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2;  $m/z$  실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.69 (s, 1H), 7.57 - 7.67 (m, 3H), 7.49 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.34 - 7.43 (m, 1H), 6.53 (s, 1H), 5.58 (br. s., 1H), 4.76 (s, 2H), 2.68 (dt,  $J$  = 3.5, 7.1 Hz, 1H), 2.45 (s, 3H), 0.69 - 0.80 (m, 2H), 0.31 - 0.43 (m, 2H).

[0550] 실시예 44: 2-[2-메틸-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

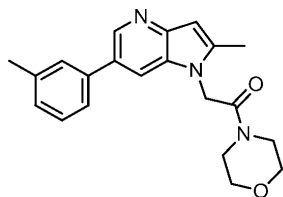


[0551]

[0552] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{23}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 333.2;  $m/z$  실측치, 334.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.36 - 7.44 (m, 2H), 7.29 - 7.36 (m, 1H), 7.15 (d,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.51 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 3.43 (t,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.02 (quin,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 1.87 (quin,  $J$  = 6.9 Hz,

2H).

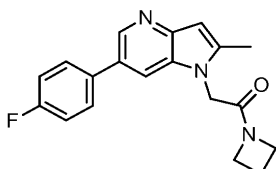
[0553] 실시예 45: 2-[2-메틸-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0554]

표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{23}N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 349.2;  $m/z$  실측치, 350.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.36 - 7.44 (m, 2H), 7.29 - 7.36 (m, 1H), 7.15 (d,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 4.80 (s, 2H), 3.51 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 3.43 (t,  $J = 6.7$  Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.42 (s, 3H), 2.02 (quin,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 1.87 (quin,  $J = 6.9$  Hz, 2H).

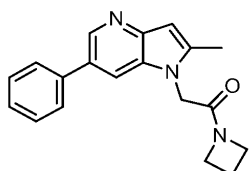
[0556] 실시예 46: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온.



[0557]

표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.58 (br. s., 1H), 7.66 (s, 1H), 7.57 (dd,  $J = 5.29, 8.4$  Hz, 2H), 7.16 (t,  $J = 8.6$  Hz, 2H), 6.54 (s, 1H), 4.75 (s, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 3.76 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.23 (quin,  $J = 7.8$  Hz, 2H).

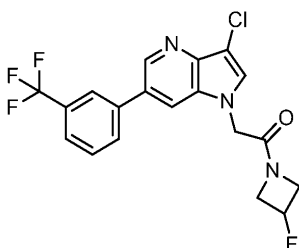
[0559] 실시예 47: 1-(아제티딘-1-일)-2-(2-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)에탄온.



[0560]

표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2;  $m/z$  실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (br. s., 1H), 7.62 (d,  $J = 8.6$  Hz, 3H), 7.46 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 7.32 - 7.39 (m, 1H), 6.52 (s, 1H), 4.72 (s, 2H), 4.05 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 3.64 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.17 (quin,  $J = 7.8$  Hz, 2H).

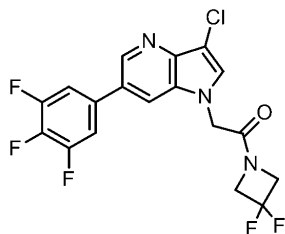
[0562] 실시예 48: 2-[3-클로로-6-[3-(트리플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0563]

[0564] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.81 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 8.08 (s, 2H), 7.94 – 7.65 (m, 3H), 5.65 – 5.32 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.70 – 4.47 (m, 1H), 4.46 – 4.15 (m, 2H), 4.08 – 3.84 (m, 1H).

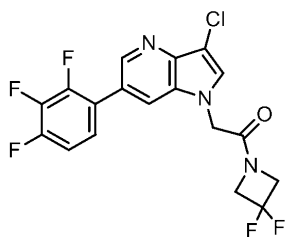
[0565] 실시예 49: 2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0566]

[0567] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{11}ClF_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 415.1; m/z 실측치, 416.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.81 (s, 1H), 8.33 (s, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.81 (dd,  $J$  = 9.3, 7.0 Hz, 2H), 5.14 (s, 2H), 4.76 (t,  $J$  = 12.4 Hz, 2H), 4.38 (t,  $J$  = 12.6 Hz, 2H).

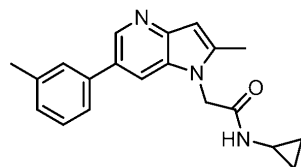
[0568] 실시예 50: 2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0569]

[0570] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{11}ClF_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 415.1; m/z 실측치, 416.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ ): 8.58 (s, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.57 – 7.41 (m, 2H), 5.14 (s, 2H), 4.75 (t,  $J$  = 12.4 Hz, 2H), 4.37 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H).

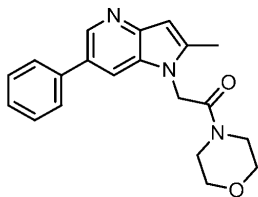
[0571] 실시예 51: N-사이클로프로필-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0572]

[0573] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2; m/z 실측치, 320.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.68 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.32 – 7.47 (m, 3H), 7.21 (d,  $J$  = 7.1 Hz, 1H), 6.52 (s, 1H), 5.65 (br. s., 1H), 4.76 (s, 2H), 2.68 (dt,  $J$  = 3.5, 7.1 Hz, 1H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 0.74 (d,  $J$  = 5.7 Hz, 2H), 0.38 (dd,  $J$  = 1.0, 3.6 Hz, 2H).

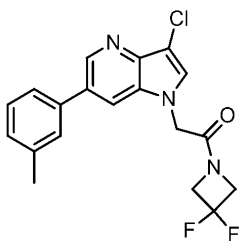
[0574] 실시예 52: 2-(2-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온.



[0575]

[0576] 표제 화합물을 실시예 31과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 335.2; m/z 실측치, 336.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.37 (s, 1H), 7.30 - 7.36 (m, 2H), 7.19 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.05 - 7.12 (m, 1H), 6.99 (s, 1H), 6.29 (s, 1H), 4.61 (s, 2H), 3.46 (d,  $J$  = 4.0 Hz, 4H), 3.38 (d,  $J$  = 4.0 Hz, 2H), 3.30 (d,  $J$  = 4.4 Hz, 2H), 2.17 (s, 3H).

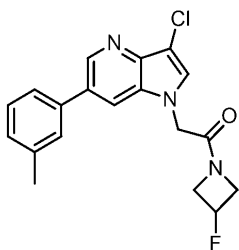
[0577] 실시예 53: 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0578]

[0579] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 8.1 Hz, 1H), 7.41 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.23 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.76 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 4.38 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 2.41 (s, 3H).

[0580] 실시예 54: 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

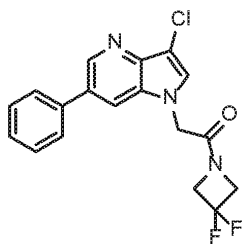


[0581]

[0582] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.20 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.60 - 7.49 (m, 2H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.23 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 5.63 - 5.32 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.68 - 4.48 (m, 1H), 4.44 - 4.16 (m, 2H), 4.08 - 3.86 (m, 1H), 2.41 (s, 3H).



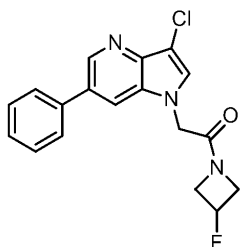
[0583] 실시예 55: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0584]

[0585] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.74 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.76 (d,  $J = 8.2$  Hz, 2H), 7.53 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 7.42 (t,  $J = 7.4$  Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.76 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 4.38 (t,  $J = 12.5$  Hz, 2H).

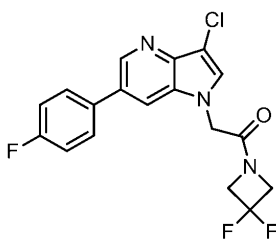
[0586] 실시예 56: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0587]

[0588] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.74 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.22 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.81 – 7.72 (m, 3H), 7.52 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 7.41 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 5.56 – 5.38 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 3.0$  Hz, 2H), 4.66 – 4.51 (m, 1H), 4.42 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.19 (m, 1H), 4.06 – 3.88 (m, 1H).

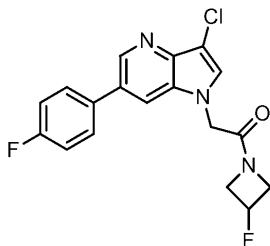
[0589] 실시예 57: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0590]

[0591] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 7.87 – 7.71 (m, 2H), 7.79 (s, 1H), 7.36 (t,  $J = 8.7$  Hz, 2H), 5.14 (s, 2H), 4.76 (t,  $J = 12.4$  Hz, 2H), 4.38 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H).

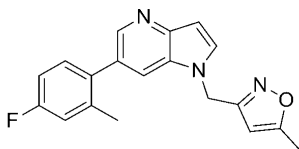
[0592] 실시예 58: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0593]

[0594] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;  $m/z$  실측치, 362.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.21 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.88 – 7.72 (m, 3H), 7.36 (t,  $J = 8.7$  Hz, 2H), 5.62 – 5.32 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.66 – 4.49 (m, 1H), 4.46 – 4.15 (m, 2H), 4.06 – 3.89 (m, 1H).

[0595] 실시예 59: 3-[[6-(4-플루오로-2-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸.

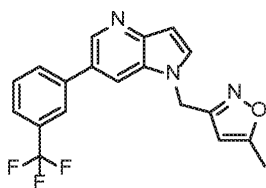


[0596]

[0597] 단계 A: 3-((6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)메틸)-5-메틸아이속사졸. 0℃에서 DMF (2 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (300 mg, 1.5 mmol)의 용액에, NaH (183 mg, 4.6 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 10분간 교반한 다음에, 0℃로 냉각시켜, 3-(클로로메틸)-5-메틸아이속사졸 (240 mg, 1.8 mmol)을 첨가하였다. 혼합물을 0℃에서 10분간 교반한 다음에, 실온으로 가온시켜, 4시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하고, 반응 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (407 mg, 92%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.41 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.26 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.78 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 1.0$  Hz, 1H), 6.07 (d,  $J = 1.0$  Hz, 1H), 5.52 (s, 2H), 2.33 (d,  $J = 0.9$  Hz, 3H).

[0598] 단계 B: 3-[[6-(4-플루오로-2-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸. 마이크로파 바이알에서, 3-((6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)메틸)-5-메틸아이속사졸 (50 mg, 0.17 mmol)을 다이옥산 (3 mL)에 용해시킨 후에, (4-플루오로-2-메틸페닐)보론산 (32 mg, 0.21 mmol),  $Pd(PPh_3)_4$  (19 mg, 0.02 mmol),  $Na_2CO_3$  (54 mg, 0.51 mmol) 및 물 (3 mL)을 첨가하였다. 마이크로파 바이알을 캡핑하여, 반응 혼합물을 14시간 동안 70℃로 가열한 다음에, 실온으로 냉각시켰다. DMSO (1 mL)를 첨가하고, 반응 혼합물을 여과하여, MeOH로 희석시키고, HPLC 방법 C로 정제하여, 표제 화합물 (23 mg, 42%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 321.1;  $m/z$  실측치, 322.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.57 (s, 1H), 8.20 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.41 (dd,  $J = 8.5, 6.0$  Hz, 1H), 7.27 (dd,  $J = 10.2, 2.7$  Hz, 1H), 7.20 (td,  $J = 8.6, 2.8$  Hz, 1H), 6.87 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 6.19 (d,  $J = 0.9$  Hz, 1H), 5.72 (s, 2H), 2.34 (s, 3H), 2.28 (s, 3H).

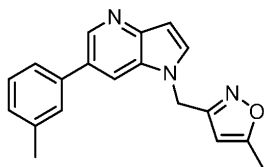
[0599] 실시예 60: 5-메틸-3-[[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸.



[0600]

[0601] 표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.03 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.20 (s, 1H), 8.19 – 8.14 (m, 2H), 7.87 – 7.76 (m, 2H), 6.86 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 6.18 (s, 1H), 5.77 (s, 2H), 2.33 (s, 3H).

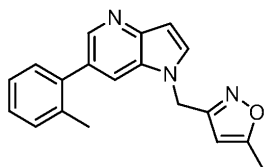
[0602] 실시예 61: 5-메틸-3-[[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세트이트 염.



[0603]

[0604] 표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.99 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.21 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.46 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.30 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 6.87 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 6.20 (d,  $J$  = 0.8 Hz, 1H), 5.79 (s, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.34 (s, 3H).

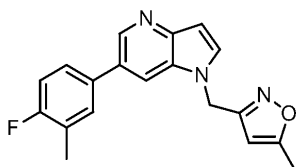
[0605] 실시예 62: 5-메틸-3-[[6-(o-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세트이트 염.



[0606]

[0607] 표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 303.1; m/z 실측치, 304.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.22 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.42 – 7.34 (m, 4H), 6.88 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 6.19 (d,  $J$  = 1.0 Hz, 1H), 5.73 (s, 2H), 2.34 (d,  $J$  = 0.9 Hz, 3H), 2.27 (s, 3H).

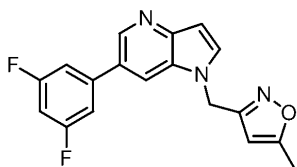
[0608] 실시예 63: 3-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세트이트 염.



[0609]

[0610] 표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 321.1; m/z 실측치, 322.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.96 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.19 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.80 (dd,  $J$  = 7.3, 2.4 Hz, 1H), 7.74 – 7.67 (m, 1H), 7.35 (dd,  $J$  = 9.6, 8.6 Hz, 1H), 6.86 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.19 (d,  $J$  = 0.9 Hz, 1H), 5.77 (s, 2H), 2.37 – 2.32 (m, 6H).

[0611] 실시예 64: 3-[[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세트이트 염.



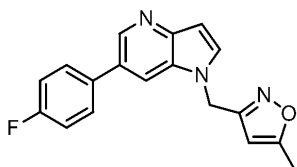
[0612]

[0613]

표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.1; m/z 실측치, 326.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.00 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.14 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.72 – 7.63 (m, 2H), 7.38 – 7.28 (m, 1H), 6.83 (dd,  $J$  = 3.4, 0.8 Hz, 1H), 6.18 (d,  $J$  = 0.9 Hz, 1H), 5.73 (s, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 0.8 Hz, 3H).

[0614]

실시예 65: 3-[[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이소자솔 트라이플루오로아세테이트 염.



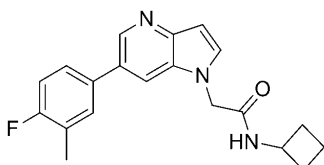
[0615]

[0616]

표제 화합물을 실시예 59와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.1; m/z 실측치, 308.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.95 (s, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.20 – 8.15 (m, 1H), 7.93 – 7.85 (m, 2H), 7.48 – 7.37 (m, 2H), 6.88 – 6.83 (m, 1H), 6.19 (s, 1H), 5.76 (s, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 3H).

[0617]

실시예 66: N-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



[0618]

[0619]

단계 A: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 다이옥산 (50 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (2 g, 10.2 mmol)의 용액에, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 (1.9 g, 12.2 mmol), Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (743 mg, 1.02 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (9.9 g, 30.5 mmol) 및 물 (5 mL)을 첨가하였다. 90°C에서 16시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.95 g, 85%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.37 (s, 1H), 8.59 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.93 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 – 7.62 (m, 2H), 7.59 – 7.51 (m, 1H), 7.24 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 6.59 – 6.55 (m, 1H), 2.33 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 3H).

[0620]

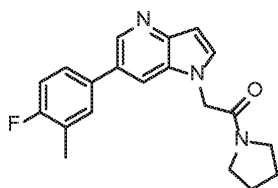
단계 B: 에틸 2-(6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. 0°C에서 DMF (60 mL) 중의 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (1.5 g, 6.6 mmol)의 용액에, NaH (371 mg, 9.3 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반하였다. 반응 혼합물을 0°C로 냉각시켜, 에틸 2-브로모아세테이트 (0.77 mL, 7 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 50% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.8 g, 87%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.69 (dd,  $J$  = 7.7, 2.5 Hz, 1H), 7.67 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 1H), 7.29 – 7.21 (m, 1H),

6.62 (dd,  $J = 3.2, 0.8$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 4.16 (q,  $J = 7.1$  Hz, 2H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H), 1.22 (t,  $J = 7.1$  Hz, 3H).

[0621] 단계 C: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산. THF (40 mL) 중의 에틸 2-(6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트 (700 mg, 2.2 mmol)의 용액에, 물 (10 mL) 중의 LiOH (107 mg, 4.5 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 30분간 교반하였다. 그 다음에 반응 혼합물을 1N HCl로 산성화하여, EtOAc로 추출하였다. 수층의 pH를 pH 6으로 조절하여, 생성물을 침전시켰다. 고체를 여과에 의해 수집하여, 다음 단계에서 그대로 사용하였다 (300 mg, 47%). MS (ESI):  $C_{16}H_{13}FN_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 284.1;  $m/z$  실측치, 285.1  $[M+H]^+$ .

[0622] 단계 D: N-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염. DCM (3 mL) 중의 2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산 (50 mg, 0.18 mmol) 및 BOP (78 mg, 0.18 mmol)의 현탁액에,  $Et_3N$  (73  $\mu$ L, 0.53 mmol), 이어서 사이클로부탄아민 (30  $\mu$ L, 0.36 mmol)을 첨가하였다. 조물질을 HPLC 방법 C로 정제하여, 표제 화합물 (9 mg, 11%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;  $m/z$  실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.88 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.68 (s, 1H), 8.57 (d,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 8.00 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.76 (dd,  $J = 7.4, 2.4$  Hz, 1H), 7.71 – 7.65 (m, 1H), 7.33 (t,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 6.77 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 4.25 – 4.13 (m, 1H), 2.35 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H), 2.21 – 2.11 (m, 2H), 1.99 – 1.89 (m, 2H), 1.71 – 1.56 (m, 2H).

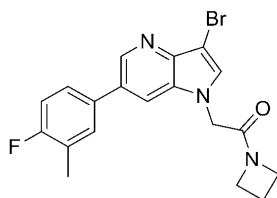
[0623] 실시예 67: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[0624]

[0625] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;  $m/z$  실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.91 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.01 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.80 – 7.75 (m, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 1H), 6.81 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 3.65 – 3.57 (m, 2H), 3.36 – 3.30 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.03 – 1.96 (m, 2H), 1.85 – 1.79 (m, 2H).

[0626] 실시예 68: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

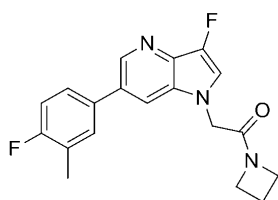


[0627]

[0628] 단계 A: 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 실온에서 DMF (45 mL) 중의 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 66, 단계 A, 1 g, 4.4 mmol)의 용액에, NBS (944 mg, 5.3 mmol)를 첨가하였다. 1시간 후에, 물을 첨가하여, 반응 혼합물을 헥산 중의 60% EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 수세하여,  $MgSO_4$ 로 건조시키고, 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.2 g, 89%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.78 (s, 1H), 8.67 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.98 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.88 (d,  $J = 2.9$  Hz, 1H), 7.72 – 7.63 (m, 1H), 7.62 – 7.53 (m, 1H), 7.25 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

[0629] 단계 B: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 0℃에서 DMF (7 mL) 중의 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (200 mg, 0.66 mmol)의 용액에, NaH (37 mg, 0.92 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반한 다음에, 0℃로 냉각시킨 후, DMF (3 mL) 중의 1-(아제티딘-1-일)-2-브로모에탄온 (140 mg, 0.78 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (178 mg, 68%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>17</sub>BrFN<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 401.1; m/z 실측치, 402.1 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.70 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.18 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.71 – 7.67 (m, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 1H), 7.28 (dd, J = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.24 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t, J = 7.7 Hz, 2H), 2.34 (d, J = 1.9 Hz, 3H), 2.33 – 2.23 (m, 2H).

[0630] 실시예 69: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0631]

[0632] 단계 A: 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 0℃에서 DMF (5 mL) 중의 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 68, 단계 A, 200 mg, 0.66 mmol)의 용액에, NaH (34 mg, 0.85 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반한 다음에, 0℃로 냉각시킨 후, DMF (3 mL) 중의 (2-(클로로메톡시)에틸)트라이메틸실란 (120 mg, 0.72 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (166 mg, 58%)을 얻었다. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.75 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.32 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.73 – 7.69 (m, 1H), 7.64 – 7.59 (m, 1H), 7.32 – 7.25 (m, 1H), 5.65 (s, 2H), 3.52 – 3.44 (m, 2H), 2.34 (d, J = 1.8 Hz, 3H), 0.84 – 0.76 (m, 2H), -0.11 (s, 9H).

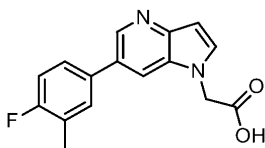
[0633] 단계 B: 3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. -78℃에서 THF (10 mL) 중의 3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (160 mg, 0.34 mmol)의 용액에, tBuLi (0.65 mL, 1.1 mmol, 펜탄 중의 1.7M)를 첨가하여, 반응 혼합물을 -78℃에서 1시간 동안 교반하였다. THF (2 mL) 중의 N-플루오로-N-(페닐설폰일)벤젠설폰아미드 (348 mg, 1.10 mmol)를 적가하여, 반응 혼합물을 -78℃에서 30분간 교반하고, 0℃로 가온시켜, 30분간 교반하였다. 반응 혼합물을 물에 부어, EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (77 mg, 56%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>20</sub>H<sub>24</sub>F<sub>2</sub>N<sub>2</sub>OSi에 대한 질량 계산치, 374.2; m/z 실측치, 375.2 [M+H]<sup>+</sup>.

[0634] 단계 C: 3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. THF (3 mL) 중의 3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-((2-(트라이메틸실릴)에톡시)메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (75 mg, 0.2 mmol)의 용액에, TBAF (0.8 mL, 0.8 mmol, THF 중의 1M)를 첨가하여, 반응 혼합물을 12시간 동안 60℃로 가열하였다. 물을 첨가하고, 반응 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (29 mg, 59%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>14</sub>H<sub>10</sub>F<sub>2</sub>N<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 244.1; m/z 실측치, 245.1 [M+H]<sup>+</sup>.

[0635] 단계 D: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제

화합물을 실시예 68, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.69 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.44 – 7.40 (m, 1H), 7.40 – 7.36 (m, 1H), 7.18 (dd,  $J$  = 2.6, 1.1 Hz, 1H), 7.11 (t,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 4.68 (s, 2H), 4.09 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 3.92 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.37 (s, 3H), 2.31 – 2.24 (m, 2H).

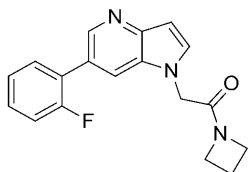
[0636] 실시예 70: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산.



[0637]

[0638] 표제 화합물을 실시예 66 단계 A 내지 단계 C와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}FN_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 284.1;  $m/z$  실측치, 285.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  13.32 (s, 1H), 9.06 (s, 1H), 9.00 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.19 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.85 (dd,  $J$  = 7.3, 2.4 Hz, 1H), 7.79 – 7.71 (m, 1H), 7.36 (dd,  $J$  = 9.6, 8.6 Hz, 1H), 6.89 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 2.35 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H).

[0639] 실시예 71: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

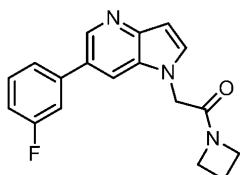


[0640]

[0641] 단계 A: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온. 0°C에서 6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 (1.5 g, 7.6 mmol)의 용액에, NaH (913 mg, 22.8 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 30분간 교반한 다음에, 0°C로 냉각시켜, DMF (10 mL) 중의 1-(아제티딘-1-일)-2-브로모에탄온 (1.6 g, 9.1 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하고, 반응 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 유기물을 합해, 건조시키고, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, DCM 중의 0 내지 30% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (1.39 g, 62%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.38 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.16 (dd,  $J$  = 2.0, 1.0 Hz, 1H), 7.59 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.95 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 – 2.22 (m, 2H).

[0642] 단계 B: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 및 (2-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 59, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$  실측치, 310.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.52 – 8.49 (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.60 (td,  $J$  = 7.8, 1.7 Hz, 1H), 7.48 – 7.42 (m, 1H), 7.39 – 7.32 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.20 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.30 – 2.21 (m, 2H).

[0643] 실시예 72: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



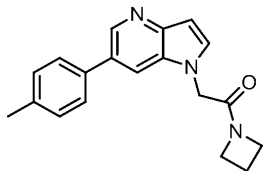
[0644]

[0645] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 및 (3-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$



실측치, 310.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.65 – 7.60 (m, 3H), 7.58 – 7.51 (m, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.21 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.32 – 2.22 (m, 2H).

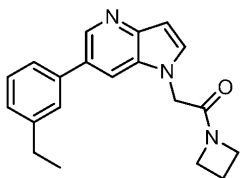
[0646] 실시예 73: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(p-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0647]

[0648] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 및 p-톨릴보론산을 사용하여, 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2; m/z 실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 – 8.60 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.67 – 7.61 (m, 2H), 7.59 – 7.55 (m, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 2H), 6.60 – 6.56 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.20 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.30 – 2.21 (m, 2H).

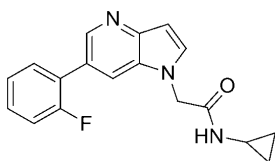
[0649] 실시예 74: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0650]

[0651] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 및 (3-에틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2; m/z 실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.08 (dd,  $J$  = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.61 – 7.52 (m, 3H), 7.41 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.23 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 6.60 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.20 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.70 (q,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.31 – 2.21 (m, 2H), 1.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

[0652] 실시예 75: N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0653]

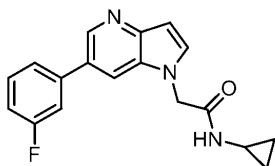
[0654] 단계 A: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드. 0°C에서 DMF (20 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (1 g, 5.0 mmol)의 용액에, NaH (284 mg, 7.1 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 30분간 교반하고, DMF (5 mL) 중의 2-브로모-N-사이클로프로필아세트아미드 (1.08 g, 6.1 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 그 다음에 물을 첨가하여, 반응 혼합물을 헥산 중의 60% EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (1.21 g, 81%)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.38 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 8.31 (d,  $J$  = 4.3 Hz, 1H), 8.12 (dd,  $J$  = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.62 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.81 (s, 2H), 2.69 – 2.60 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.41 (m, 2H).

[0655] 단계 B: N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드. 표제 화합물을 실시



예 59, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$  실측치, 310.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.34 (d,  $J = 4.3$  Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.66 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.60 (td,  $J = 7.8, 1.7$  Hz, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 1H), 7.39 – 7.31 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 2.68 – 2.59 (m, 1H), 0.66 – 0.58 (m, 2H), 0.46 – 0.39 (m, 2H).

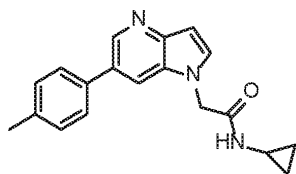
[0656] 실시예 76: N-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0657]

[0658] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$  실측치, 310.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.34 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 8.17 – 8.14 (m, 1H), 7.66 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 2H), 7.58 – 7.50 (m, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 1H), 6.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 2.69 – 2.60 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.41 (m, 2H).

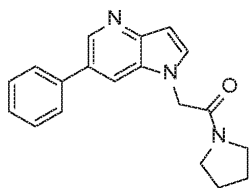
[0659] 실시예 77: N-사이클로프로필-2-[6-(p-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0660]

[0661] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2;  $m/z$  실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.34 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 8.03 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.66 – 7.58 (m, 3H), 7.34 – 7.28 (m, 2H), 6.57 (dd,  $J = 3.2, 0.8$  Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 2.70 – 2.59 (m, 1H), 2.36 (s, 3H), 0.67 – 0.59 (m, 2H), 0.47 – 0.40 (m, 2H).

[0662] 실시예 78: 2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



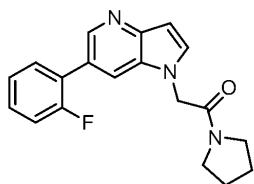
[0663]

[0664] 단계 A: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온. 0°C에서 DMF (20 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (1 g, 5.0 mmol)의 용액에, NaH (284 mg, 7.1 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 30분간 교반하고, DMF (5 mL) 중의 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (1.02 g, 5.3 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물 (1 mL)을 첨가하여, 반응 혼합물을 실리카 겔 상에서 농축시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , EtOAc 중의 0 내지 20% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (정량적 수율)을 얻었다.  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.37 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J = 2.1, 0.8$  Hz, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.58 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 3.56 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.37 – 3.25 (m, 2H), 2.01 – 1.90 (m, 2H), 1.86 – 1.75 (m, 2H).

[0665] 단계 B: 2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온. 표제 화합물을 실시예 59, 단계 B와 유

사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2; m/z 실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.66 – 8.62 (m, 1H), 8.12 – 8.10 (m, 1H), 7.77 – 7.71 (m, 2H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.53 – 7.46 (m, 2H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 6.60 – 6.57 (m, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.62 – 3.56 (m, 2H), 3.35 – 3.30 (m, 2H), 2.01 – 1.92 (m, 2H), 1.85 – 1.76 (m, 2H).

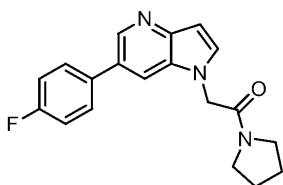
[0666] 실시예 79: 2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0667]

[0668] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.49 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 2H), 6.63 – 6.60 (m, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.61 – 3.53 (m, 2H), 3.34 – 3.30 (m, 2H), 1.98 – 1.92 (m, 2H), 1.83 – 1.76 (m, 2H).

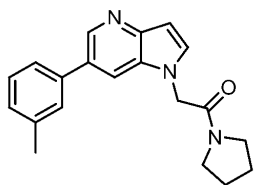
[0669] 실시예 80: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0670]

[0671] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 – 8.61 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.60 – 7.57 (m, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 2H), 6.60 – 6.57 (m, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 3.32 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 2H), 1.99 – 1.93 (m, 2H), 1.84 – 1.77 (m, 2H).

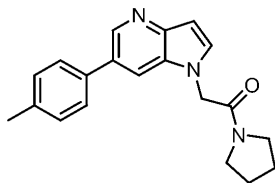
[0672] 실시예 81: 2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온



[0673]

[0674] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2; m/z 실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (dd,  $J$  = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 8.10 – 8.07 (m, 1H), 7.58 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.52 (d,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.38 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 6.58 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 3.33 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.40 (s, 3H), 1.99 – 1.94 (m, 2H), 1.84 – 1.77 (m, 2H).

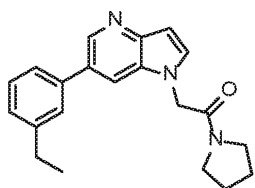
[0675] 실시예 82: 2-[6-(p-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0676]

[0677] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2; m/z 실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 – 8.60 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.65 – 7.61 (m, 2H), 7.56 (dd,  $J$  = 3.2, 1.0 Hz, 1H), 7.30 (d,  $J$  = 8.3 Hz, 2H), 6.58 – 6.55 (m, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 3.32 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 2H), 2.36 (s, 3H), 2.00 – 1.92 (m, 2H), 1.84 – 1.76 (m, 2H).

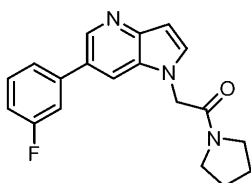
[0678] 실시예 83: 2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0679]

[0680] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{23}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 333.2; m/z 실측치, 334.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 – 8.62 (m, 1H), 8.09 – 8.07 (m, 1H), 7.59 – 7.51 (m, 3H), 7.42 – 7.38 (m, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.1 Hz, 1H), 6.59 – 6.57 (m, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 3.32 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 2H), 2.70 (q,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.00 – 1.94 (m, 2H), 1.84 – 1.77 (m, 2H), 1.27 – 1.22 (m, 3H).

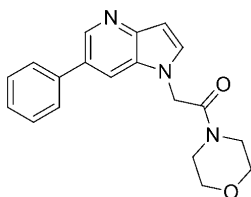
[0681] 실시예 84: 2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[0682]

[0683] 표제 화합물을 실시예 78과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 – 8.68 (m, 1H), 8.20 – 8.17 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 3H), 7.56 – 7.50 (m, 1H), 7.23 – 7.17 (m, 1H), 6.62 – 6.58 (m, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.59 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.33 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.00 – 1.94 (m, 2H), 1.85 – 1.77 (m, 2H).

[0684] 실시예 85: 1-모르폴리노-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



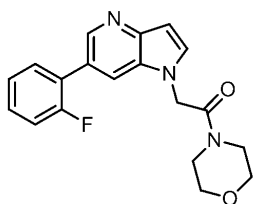
[0685]

[0686] 단계 A: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온. 표제 화합물을 2-브로모-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 대신에 2-브로모-1-모르폴리노에탄온을 사용하여, 실시예 78, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였

다.  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.37 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.69 (t,  $J = 4.8$  Hz, 2H), 3.60 (t,  $J = 4.9$  Hz, 2H), 3.54 (t,  $J = 4.8$  Hz, 2H), 3.44 (t,  $J = 4.8$  Hz, 2H).

[0687] 단계 B: 1-모르폴리노-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온. 표제 화합물을 실시예 78, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 321.1;  $m/z$  실측치, 322.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.65 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.76 – 7.70 (m, 2H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.54 – 7.47 (m, 2H), 7.41 – 7.35 (m, 1H), 6.59 (s, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.70 (s, 2H), 3.59 (s, 4H), 3.44 (s, 2H).

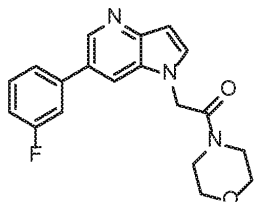
[0688] 실시예 86: 2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0689]

[0690] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.48 (m, 1H), 8.02 – 8.00 (m, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.59 (td,  $J = 7.8, 1.7$  Hz, 1H), 7.48 – 7.42 (m, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J = 3.2, 0.8$  Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.70 – 3.65 (m, 2H), 3.60 – 3.55 (m, 4H), 3.43 (t,  $J = 5.0$  Hz, 2H).

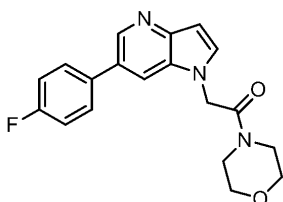
[0691] 실시예 87: 2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0692]

[0693] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (s, 1H), 7.65 – 7.58 (m, 3H), 7.57 – 7.50 (m, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 1H), 6.60 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.75 – 3.68 (m, 2H), 3.62 – 3.56 (m, 4H), 3.47 – 3.41 (m, 2H).

[0694] 실시예 88: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.

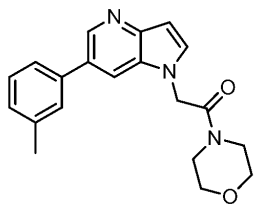


[0695]

[0696] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.2  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (600 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.64 – 8.60 (m, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.60 – 7.57 (m, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.61 – 6.58 (m, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.72 – 3.68

(m, 2H), 3.61 – 3.55 (m, 4H), 3.47 – 3.41 (m, 2H).

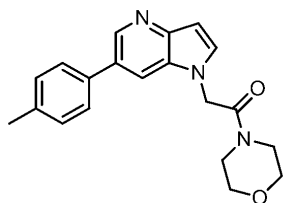
[0697] 실시예 89: 1-모르폴리노-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0698]

[0699] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 335.2; m/z 실측치, 336.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.58 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.52 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.38 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 6.59 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.73 – 3.67 (m, 2H), 3.62 – 3.56 (m, 4H), 3.47 – 3.42 (m, 2H), 2.40 (s, 3H).

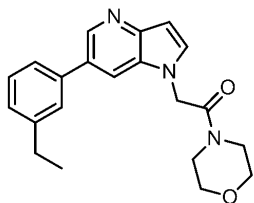
[0700] 실시예 90: 1-모르폴리노-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0701]

[0702] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 335.2; m/z 실측치, 336.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 – 8.60 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.65 – 7.61 (m, 2H), 7.58 – 7.55 (m, 1H), 7.33 – 7.28 (m, 2H), 6.58 (d,  $J$  = 3.1 Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.72 – 3.66 (m, 2H), 3.62 – 3.55 (m, 4H), 3.46 – 3.41 (m, 2H), 2.36 (s, 3H).

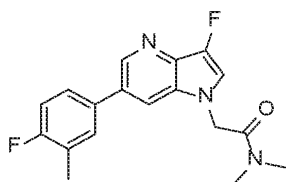
[0703] 실시예 91: 2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0704]

[0705] 표제 화합물을 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{23}N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 349.2; m/z 실측치, 350.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.66 – 8.59 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.60 – 7.51 (m, 3H), 7.41 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.23 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 6.59 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.72 – 3.67 (m, 2H), 3.62 – 3.56 (m, 4H), 3.46 – 3.42 (m, 2H), 2.74 – 2.66 (m, 2H), 1.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

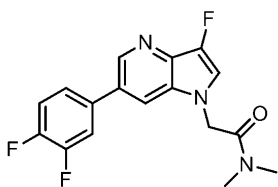
[0706] 실시예 92: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0707]

[0708] 다이옥산 (1mL) 중의 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15, 68 mg, 0.22 mmol)의 용액에, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 (419 mg, 0.27 mmol), Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (16.6 mg, 0.203 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (221 mg, 0.68 mmol)를 첨가하였다. 90℃에서 16시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, EtOAc 중의 0 내지 20% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (37 mg, 50%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>17</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.1 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.66 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.17 – 8.12 (m, 1H), 7.68 (dd, J = 7.6, 2.4 Hz, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 2H), 7.27 (dd, J = 9.6, 8.5 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.33 (d, J = 1.9 Hz, 3H).

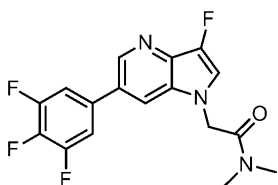
[0709] 실시예 93: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0710]

[0711] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>17</sub>H<sub>14</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.74 – 8.70 (m, 1H), 8.27 – 8.22 (m, 1H), 7.88 (ddd, J = 12.3, 7.8, 2.3 Hz, 1H), 7.68 – 7.52 (m, 3H), 5.20 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

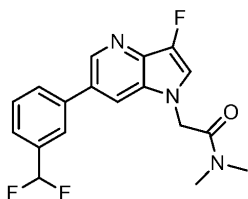
[0712] 실시예 94: 2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0713]

[0714] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 (2,3,4-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>17</sub>H<sub>13</sub>F<sub>4</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.77 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.30 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.85 – 7.79 (m, 2H), 7.67 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[0715] 실시예 95: 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.

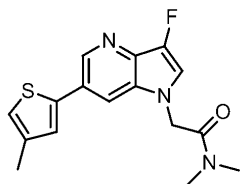


[0716]

[0717] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 (3-(다이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):

C<sub>18</sub>H<sub>16</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.72 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.27 – 8.23 (m, 1H), 7.94 (s, 2H), 7.71 – 7.58 (m, 3H), 7.12 (t, J = 55.8 Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

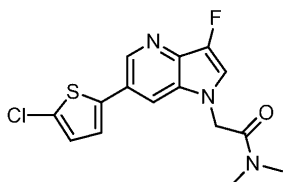
[0718] 실시예 96: 2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0719]

[0720] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>16</sub>H<sub>16</sub>FN<sub>3</sub>OS에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.64 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.13 – 8.09 (m, 1H), 7.59 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.42 (d, J = 1.4 Hz, 1H), 7.18 – 7.14 (m, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.26 (s, 3H).

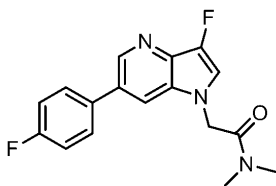
[0721] 실시예 97: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0722]

[0723] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 (5-클로로티오펜-2-일)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>15</sub>H<sub>13</sub>ClFN<sub>3</sub>OS에 대한 질량 계산치, 337.0; m/z 실측치, 338.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.65 (d, J = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.64 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.47 (d, J = 3.9 Hz, 1H), 7.22 (d, J = 4.0 Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

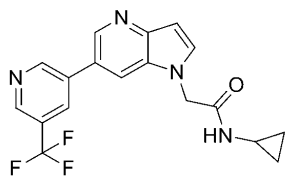
[0724] 실시예 98: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0725]

[0726] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (중간체 15) 및 (4-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>17</sub>H<sub>15</sub>F<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.69 – 8.65 (m, 1H), 8.20 – 8.16 (m, 1H), 7.83 – 7.76 (m, 2H), 7.64 – 7.60 (m, 1H), 7.40 – 7.30 (m, 2H), 5.21 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

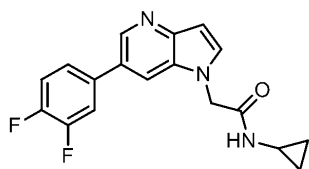
[0727] 실시예 99: N-사이클로프로필-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딘]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0728]

[0729] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1;  $m/z$  실험치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.16 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 8.88 (s, 1H), 8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.24 – 8.22 (m, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.70 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.95 (s, 2H), 2.73 – 2.66 (m, 1H), 0.76 – 0.69 (m, 2H), 0.56 – 0.50 (m, 2H).

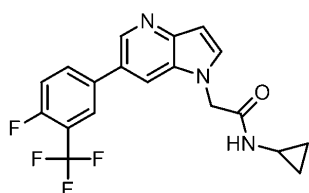
[0730] 실시예 100: N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0731]

[0732] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실험치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.03 – 8.01 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.50 – 7.45 (m, 1H), 7.40 – 7.33 (m, 1H), 6.67 – 6.65 (m, 1H), 4.90 (s, 2H), 2.72 – 2.66 (m, 1H), 0.75 – 0.69 (m, 2H), 0.54 – 0.49 (m, 2H).

[0733] 실시예 101: N-사이클로프로필-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

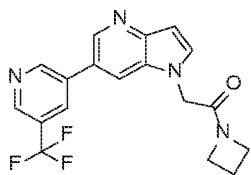


[0734]

[0735] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실험치, 378.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 8.00 – 7.94 (m, 2H), 7.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.45 (t,  $J = 9.6$  Hz, 1H), 6.67 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 2.73 – 2.66 (m, 1H), 0.77 – 0.69 (m, 2H), 0.55 – 0.49 (m, 2H).



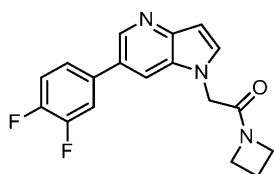
[0736] 실시예 102: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0737]

[0738] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1; m/z 실측치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.16 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.67 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.24 (s, 1H), 7.62 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.69 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.30 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 4.06 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 3.33 – 3.29 (m, 2H).

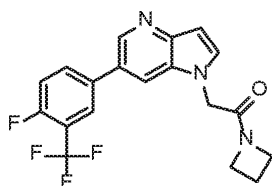
[0739] 실시예 103: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0740]

[0741] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.05 – 8.03 (m, 1H), 7.66 – 7.59 (m, 1H), 7.56 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.51 – 7.46 (m, 1H), 7.39 – 7.32 (m, 1H), 6.66 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.26 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.05 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.40 – 2.31 (m, 2H).

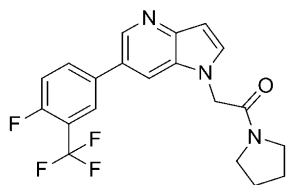
[0742] 실시예 104: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0743]

[0744] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.09 – 8.07 (m, 1H), 7.98 – 7.90 (m, 2H), 7.56 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.45 – 7.39 (m, 1H), 6.66 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.26 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.05 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.40 – 2.30 (m, 2H).

[0745] 실시예 105: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



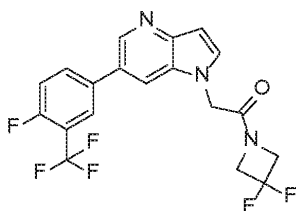
[0746]

[0747]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 10) 및 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. HPLC 방법 A로 정제하여, 표제 화합물 (35 mg, 27%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 391.1; m/z 실측치, 392.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.13 – 8.11 (m, 1H), 8.01 – 7.94 (m, 2H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.48 – 7.40 (m, 1H), 6.68 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.65 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.46 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.12 – 2.02 (m, 2H), 1.97 – 1.87 (m, 2H).

[0748]

실시예 106: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



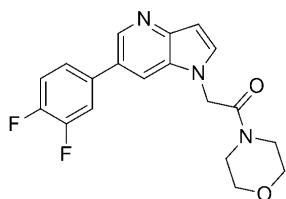
[0749]

[0750]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 12) 및 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}F_6N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 – 8.59 (m, 1H), 8.16 – 8.13 (m, 1H), 8.03 – 7.96 (m, 2H), 7.61 – 7.58 (m, 1H), 7.50 – 7.42 (m, 1H), 6.71 – 6.68 (m, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.67 (t,  $J = 12.0$  Hz, 2H), 4.41 (t,  $J = 12.2$  Hz, 2H).

[0751]

실시예 107: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.

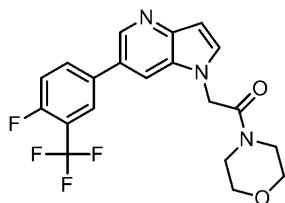


[0752]

[0753]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. HPLC 방법 A로 정제하여, 표제 화합물 (21 mg, 38%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.07 – 8.05 (m, 1H), 7.63 (ddd,  $J = 12.0, 7.6, 2.3$  Hz, 1H), 7.55 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.52 – 7.47 (m, 1H), 7.41 – 7.32 (m, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.80 – 3.74 (m, 2H), 3.72 – 3.63 (m, 4H), 3.61 – 3.55 (m, 2H).

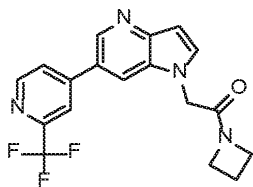
[0754] 실시예 108: 2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0755]

[0756] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11) 및 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{17}F_4N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 407.1; m/z 실측치, 408.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.13 – 8.10 (m, 1H), 8.01 – 7.95 (m, 2H), 7.57 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.49 – 7.41 (m, 1H), 6.69 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.31 (s, 2H), 3.81 – 3.75 (m, 2H), 3.72 – 3.64 (m, 4H), 3.61 – 3.55 (m, 2H).

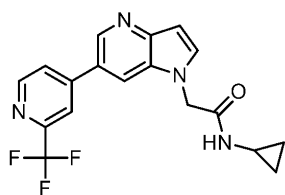
[0757] 실시예 109: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0758]

[0759] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (2-(트라이플루오로메틸)피리딘-4-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1; m/z 실측치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.79 – 8.73 (m, 2H), 8.35 – 8.32 (m, 1H), 8.21 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.03 (dd,  $J$  = 5.2, 1.7 Hz, 1H), 7.66 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.71 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 4.32 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.07 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.44 – 2.34 (m, 2H).

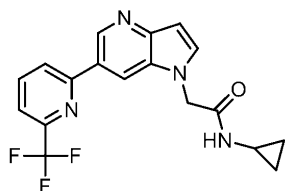
[0760] 실시예 110: N-사이클로프로필-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0761]

[0762] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (2-(트라이플루오로메틸)피리딘-4-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1; m/z 실측치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.80 – 8.74 (m, 2H), 8.33 – 8.30 (m, 1H), 8.21 – 8.19 (m, 1H), 8.03 (dd,  $J$  = 5.1, 1.7 Hz, 1H), 7.67 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.72 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 2.74 – 2.67 (m, 1H), 0.77 – 0.70 (m, 2H), 0.56 – 0.50 (m, 2H).

[0763] 실시예 111: N-사이클로프로필-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



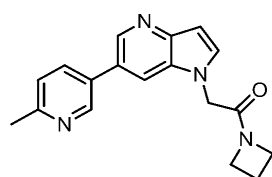
[0764]

[0765]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1;  $m/z$  실측치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.06 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.53 – 8.50 (m, 1H), 8.21 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H), 8.07 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.74 – 7.69 (m, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.68 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 2.74 – 2.67 (m, 1H), 0.76 – 0.70 (m, 2H), 0.58 – 0.53 (m, 2H).

[0766]

실시예 112: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-메틸-3-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



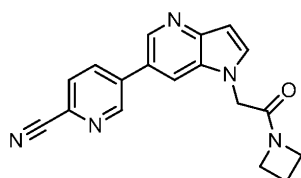
[0767]

[0768]

표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (6-메틸피리딘-3-일)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 306.1;  $m/z$  실측치, 307.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 8.60 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.14 – 8.12 (m, 1H), 8.08 (dd,  $J = 8.1, 2.5$  Hz, 1H), 7.59 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 7.43 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.28 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.60 (s, 3H), 2.42 – 2.32 (m, 2H).

[0769]

실시예 113: 5-[1-[2-(아제티딘-1-일)-2-옥소-에틸]피콜로[3,2-b]피리딘-6-일]피리딘-2-카르보니트릴.



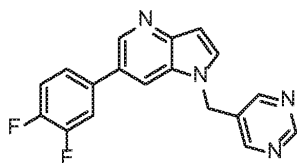
[0770]

[0771]

표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)피콜리노니트릴을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}N_5O$ 에 대한 질량 계산치, 317.1;  $m/z$  실측치, 318.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.10 – 9.07 (m, 1H), 8.69 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.36 – 8.30 (m, 1H), 8.26 – 8.21 (m, 1H), 7.99 – 7.93 (m, 1H), 7.67 – 7.63 (m, 1H), 6.72 – 6.69 (m, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.31 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.9$  Hz, 2H), 2.44 – 2.32 (m, 2H).

[0772]

실시예 114: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리미딘-5-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘.



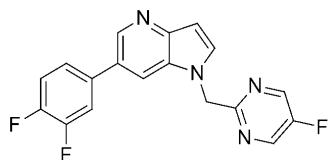
[0773]

[0774]

표제 화합물을 (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트 (중간체 3) 대신에 피리미딘-5-일메틸 메탄설포

네이트를 사용하여, 실시예 115와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}F_2N_4$ 에 대한 질량 계산치, 322.1; m/z 실측치, 323.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.07 (s, 1H), 8.66 (s, 2H), 8.61 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.20 – 8.18 (m, 1H), 7.77 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 1H), 7.50 – 7.46 (m, 1H), 7.39 – 7.33 (m, 1H), 6.74 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.62 (s, 2H).

[0775] 실시예 115: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[(5-플루오로피리미딘-2-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.

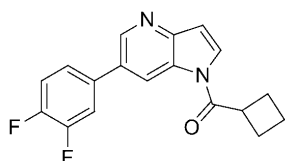


[0776]

[0777] 단계 A: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 106, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{13}H_8F_2N_2$ 에 대한 질량 계산치, 230.1; m/z 실측치, 231.1  $[M+H]^+$ .

[0778] 단계 B: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[(5-플루오로피리미딘-2-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 2-브로모-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 대신에 (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트 (중간체 3)를 사용하여, 실시예 106, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{11}F_3N_4$ 에 대한 질량 계산치, 340.1; m/z 실측치, 341.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 0.8 Hz, 2H), 8.55 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.13 – 8.11 (m, 1H), 7.72 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.49 – 7.43 (m, 1H), 7.39 – 7.31 (m, 1H), 6.66 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.70 (s, 2H).

[0779] 실시예 116: 사이클로부틸-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메탄온.

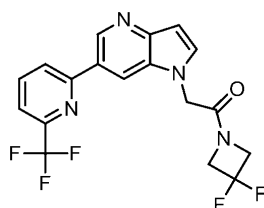


[0780]

[0781] DMF (1 mL) 중의 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (50 mg, 0.22 mmol)의 용액에, 사이클로부탄카르복실산 (25  $\mu$ L, 0.26 mmol), DIPEA (0.11 mL, 0.65 mmol) 및 HATU (91 mg, 0.24 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하여, 물을 첨가하였다. 수상을 DCM으로 3회 추출하여, 합한 유기층을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. HPLC 방법 A로 정제하여, 표제 화합물 (28 mg, 41%)을 얻었다.

MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 312.1; m/z 실측치, 313.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.93 – 8.90 (m, 1H), 8.68 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.97 (d,  $J$  = 3.8 Hz, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 1H), 7.51 – 7.46 (m, 1H), 7.43 – 7.36 (m, 1H), 6.79 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 4.10 – 4.01 (m, 1H), 2.57 – 2.39 (m, 4H), 2.24 – 2.12 (m, 1H), 2.04 – 1.94 (m, 1H).

[0782] 실시예 117: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

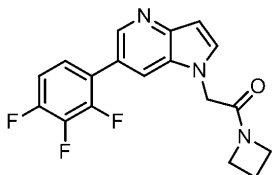


[0783]

[0784] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사

보롤란-2-일)-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_5N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 396.1;  $m/z$  실측치, 397.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.10 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.58 – 8.56 (m, 1H), 8.23 (d,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 8.12 – 8.07 (m, 1H), 7.73 (dd,  $J = 7.7, 0.8$  Hz, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.72 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.17 (s, 2H), 4.69 (t,  $J = 11.9$  Hz, 2H), 4.42 (t,  $J = 12.1$  Hz, 2H).

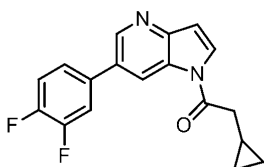
[0785] 실시예 118: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0786]

[0787] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.49 – 8.46 (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.62 (dd,  $J = 3.4, 1.0$  Hz, 1H), 7.42 – 7.35 (m, 1H), 7.29 – 7.21 (m, 1H), 6.71 – 6.68 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.27 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.06 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.41 – 2.31 (m, 2H).

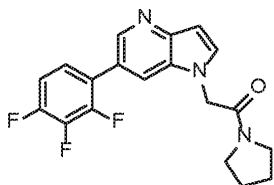
[0788] 실시예 119: 2-사이클로프로필-1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0789]

[0790] 표제 화합물을 실시예 116과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 312.1;  $m/z$  실측치, 313.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.88 (d,  $J = 2.5$  Hz, 1H), 8.67 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.09 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.64 – 7.55 (m, 1H), 7.50 – 7.43 (m, 1H), 7.42 – 7.30 (m, 1H), 6.79 (dd,  $J = 3.8, 0.7$  Hz, 1H), 2.97 (d,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 1.28 – 1.17 (m, 1H), 0.68 – 0.61 (m, 2H), 0.35 – 0.29 (m, 2H).

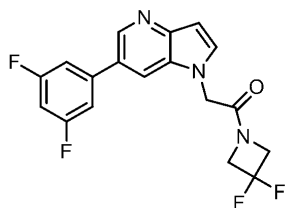
[0791] 실시예 120: 1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0792]

[0793] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 10) 및 (2,3,4-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.47 – 8.43 (m, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.40 – 7.31 (m, 1H), 7.26 – 7.18 (m, 1H), 6.68 (dd,  $J = 3.3, 1.0$  Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 3.62 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 3.44 (t,  $J = 7.0$  Hz, 2H), 2.09 – 2.00 (m, 2H), 1.95 – 1.85 (m, 2H).

[0794] 실시예 121: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



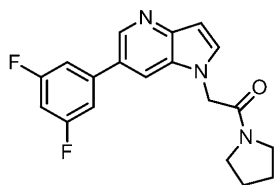
[0795]

[0796]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 12) 및 (3,5-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.15 – 8.12 (m, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 2H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.68 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.66 (t,  $J = 12.0$  Hz, 2H), 4.41 (t,  $J = 12.2$  Hz, 2H).

[0797]

실시예 122: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



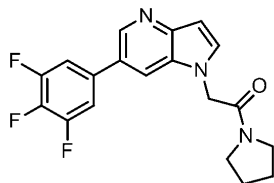
[0798]

[0799]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 10) 및 (3,5-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 8.12 – 8.10 (m, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 2H), 6.96 – 6.91 (m, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.64 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.46 (t,  $J = 7.0$  Hz, 2H), 2.10 – 2.02 (m, 2H), 1.95 – 1.87 (m, 2H).

[0800]

실시예 123: 1-피롤리딘-1-일-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



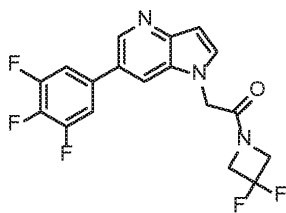
[0801]

[0802]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 10) 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.09 – 8.06 (m, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.53 – 7.44 (m, 2H), 6.65 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 3.64 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.45 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.11 – 2.02 (m, 2H), 1.96 – 1.87 (m, 2H).

[0803]

실시예 124: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



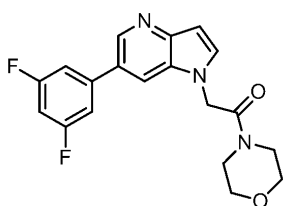
[0804]

[0805]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 12) 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 381.1;  $m/z$  실측치, 382.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.15 – 8.13 (m, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.58 – 7.49 (m, 2H), 6.69 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.68 (t,  $J = 11.9$  Hz, 2H), 4.41 (t,  $J = 12.2$  Hz, 2H).

[0806]

실시예 125: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



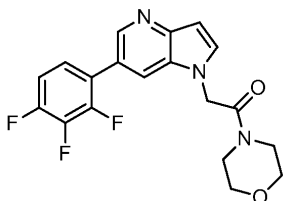
[0807]

[0808]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11) 및 (3,5-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 357.1;  $m/z$  실측치, 358.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.06 – 8.02 (m, 1H), 7.53 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.31 – 7.23 (m, 2H), 6.96 – 6.88 (m, 1H), 6.65 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.77 – 3.73 (m, 2H), 3.69 – 3.64 (m, 2H), 3.63 – 3.53 (m, 4H).

[0809]

실시예 126: 1-모르폴리노-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



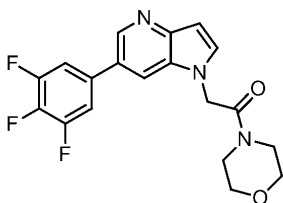
[0810]

[0811]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11) 및 (2,3,4-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 375.1;  $m/z$  실측치, 376.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.47 (t,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.04 – 7.99 (m, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.43 – 7.35 (m, 1H), 7.30 – 7.20 (m, 1H), 6.70 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.79 – 3.73 (m, 2H), 3.72 – 3.62 (m, 4H), 3.61 – 3.55 (m, 2H).

[0812]

실시예 127: 1-모르폴리노-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0813]

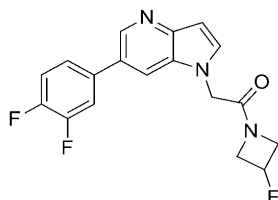
[0814]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 11) 및 (3,4,5-트라이플



루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 375.1;  $m/z$  실측치, 376.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 – 8.04 (m, 1H), 7.55 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.52 – 7.41 (m, 2H), 6.66 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.80 – 3.74 (m, 2H), 3.71 – 3.66 (m, 2H), 3.66 – 3.60 (m, 2H), 3.60 – 3.53 (m, 2H).

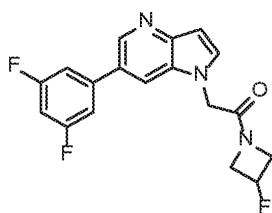
[0815] 실시예 128: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0816]

[0817] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 – 8.06 (m, 1H), 7.67 – 7.60 (m, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.52 – 7.48 (m, 1H), 7.40 – 7.33 (m, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.47 – 5.30 (m, 1H), 5.05 (d,  $J = 3.4$  Hz, 2H), 4.58 – 4.48 (m, 1H), 4.40 – 4.27 (m, 2H), 4.16 – 4.03 (m, 1H).

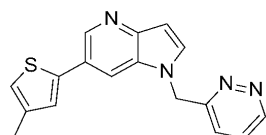
[0818] 실시예 129: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[0819]

[0820] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (3,5-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.13 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.39 – 7.32 (m, 2H), 7.00 – 6.92 (m, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.48 – 5.31 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.2$  Hz, 2H), 4.60 – 4.50 (m, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 2H), 4.15 – 4.05 (m, 1H).

[0821] 실시예 130: 6-(4-메틸-2-티에닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



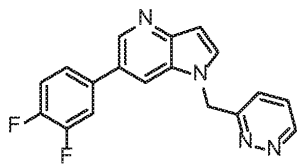
[0822]

[0823] 단계 A: 6-(4-메틸티오펜-2-일)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다iox사보롤란을 사용하여, 실시예 115, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{12}H_{10}N_2S$ 에 대한 질량 계산치, 214.1;  $m/z$  실측치, 215.1  $[M+H]^+$ .

[0824] 단계 B: 6-(4-메틸-2-티에닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 6-(4-메틸티오펜-2-일)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(클로로메틸)피리다진 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 115, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}N_4S$ 에 대한 질량 계산치, 306.1;  $m/z$  실측치, 307.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.10 (dd,  $J = 5.0, 1.6$  Hz, 1H), 8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 (dd,  $J = 1.9,$

0.9 Hz, 1H), 7.74 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.65 (dd,  $J = 8.6, 4.9$  Hz, 1H), 7.45 (dd,  $J = 8.5, 1.6$  Hz, 1H), 7.25 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.4, 1.0$  Hz, 1H), 5.80 (s, 2H), 2.27 (s, 3H).

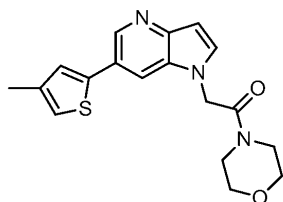
[0825] 실시예 131: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



[0826]

[0827] 표제 화합물을 (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트 (중간체 2) 대신에 3-(클로로메틸)피리다진 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 115와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}F_2N_4$ 에 대한 질량 계산치, 322.1;  $m/z$  실측치, 323.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.10 (dd,  $J = 4.9, 1.6$  Hz, 1H), 8.58 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.17 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.79 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.65 (dd,  $J = 8.5, 5.0$  Hz, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 1H), 7.51 – 7.43 (m, 2H), 7.38 – 7.31 (m, 1H), 6.72 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.83 (s, 2H).

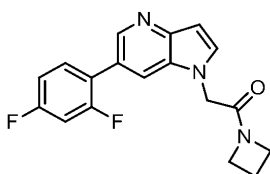
[0828] 실시예 132: 2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[0829]

[0830] 표제 화합물을 페닐보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 85와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3O_2S$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.49 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.26 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.98 – 6.96 (m, 1H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.22 (s, 2H), 3.78 – 3.73 (m, 2H), 3.70 – 3.66 (m, 2H), 3.65 – 3.61 (m, 2H), 3.59 – 3.55 (m, 2H), 2.29 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H).

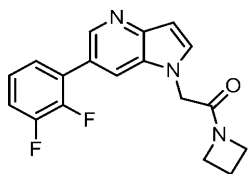
[0831] 실시예 133: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0832]

[0833] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (2,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.46 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 2H), 7.14 – 7.07 (m, 2H), 6.68 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.24 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.05 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.39 – 2.30 (m, 2H).

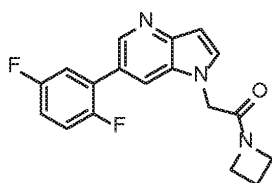
[0834] 실시예 134: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0835]

[0836] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (2,3-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.52 – 8.49 (m, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.40 – 7.35 (m, 1H), 7.34 – 7.25 (m, 2H), 6.70 (dd,  $J = 3.4, 1.0$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.26 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.06 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.40 – 2.31 (m, 2H).

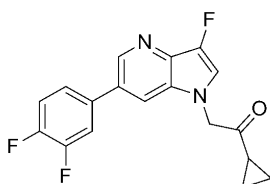
[0837] 실시예 135: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0838]

[0839] 표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 (중간체 14) 및 (2,5-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.53 – 8.51 (m, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.41 – 7.34 (m, 1H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 7.18 – 7.12 (m, 1H), 6.69 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.26 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.06 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.40 – 2.32 (m, 2H).

[0840] 실시예 136: 1-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

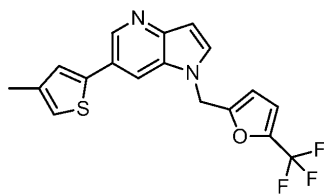


[0841]

[0842] 단계 A: 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-사이클로프로필에탄온. 표제 화합물을 2-브로모-1-사이클로프로필에탄온 및 6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 6)을 사용하여, 중간체 15와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{12}H_{10}BrFN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 296.0;  $m/z$  실측치, 297.0  $[M+H]^+$ .

[0843] 단계 B: 1-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-사이클로프로필에탄온 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_3N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 330.1;  $m/z$  실측치, 331.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.28 – 8.24 (m, 1H), 7.88 (ddd,  $J = 12.3, 7.7, 2.2$  Hz, 1H), 7.69 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.67 – 7.52 (m, 2H), 5.42 (s, 2H), 2.16 – 2.07 (m, 1H), 1.05 – 0.91 (m, 4H).

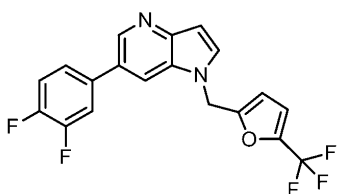
[0844] 실시예 137: 6-(4-메틸-2-티에닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.



[0845]

[0846] 표제 화합물을 실시예 130과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_3N_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 362.1;  $m/z$  실측치, 363.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (s, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.29 (s, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.93 – 6.90 (m, 1H), 6.65 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 6.52 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.55 (s, 2H), 2.30 (s, 3H).

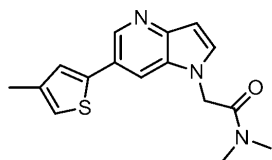
[0847] 실시예 138: 6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.



[0848]

[0849] 표제 화합물을 (5-플루오로피리미딘-2-일)메틸 메탄설포네이트 (중간체 2) 대신에 2-(브로모메틸)-5-(트라이플루오로메틸)푸란을 사용하여, 실시예 115와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{11}F_5N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 378.1;  $m/z$  실측치, 379.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.23 – 8.20 (m, 1H), 7.69 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.66 – 7.59 (m, 1H), 7.52 – 7.46 (m, 1H), 7.41 – 7.33 (m, 1H), 6.92 – 6.89 (m, 1H), 6.68 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.53 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.57 (s, 2H).

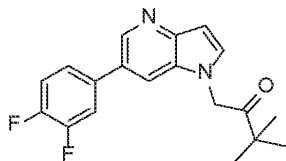
[0850] 실시예 139: N,N-다이메틸-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0851]

[0852] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (실시예 375, 단계 A의 중간체) 및 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 299.1;  $m/z$  실측치, 300.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.97 – 7.94 (m, 1H), 7.47 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.25 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.96 (s, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 2.28 (s, 3H).

[0853] 실시예 140: 1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온.



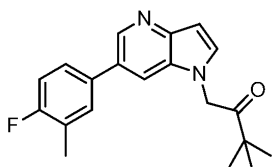
[0854]

[0855] 단계 A: 1-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-3,3-다이메틸부탄-2-온. 표제 화합물을 1-브로모-3,3-다이메틸부탄-2-온 및 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다. MS

(ESI):  $C_{13}H_{15}BrN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 294.0;  $m/z$  실측치, 295.0  $[M+H]^+$ .

[0856] 단계 B: 1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온. 표제 화합물을 1-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-3,3-다이메틸부탄-2-온 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 328.1;  $m/z$  실측치, 329.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 1H), 7.50 – 7.43 (m, 2H), 7.39 – 7.32 (m, 1H), 6.66 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.44 (s, 2H), 1.32 (s, 9H).

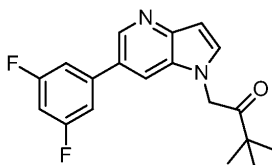
[0857] 실시예 141: 1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온.



[0858]

[0859] 표제 화합물을 실시예 140과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 324.2;  $m/z$  실측치, 325.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.51 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.52 – 7.49 (m, 1H), 7.47 – 7.42 (m, 2H), 7.14 – 7.09 (m, 1H), 6.64 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 2.34 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 1.31 (s, 9H).

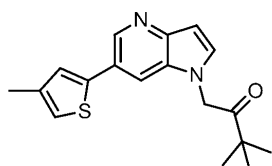
[0860] 실시예 142: 1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온.



[0861]

[0862] 표제 화합물을 실시예 140과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 328.1;  $m/z$  실측치, 329.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.96 – 7.94 (m, 1H), 7.50 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.34 – 7.28 (m, 2H), 6.98 – 6.91 (m, 1H), 6.67 (dd,  $J$  = 3.4, 0.9 Hz, 1H), 5.45 (s, 2H), 1.32 (s, 9H).

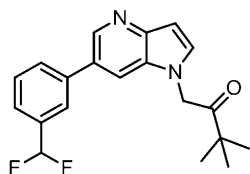
[0863] 실시예 143: 3,3-다이메틸-1-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[0864]

[0865] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 140과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{20}N_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 312.1;  $m/z$  실측치, 313.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.82 – 7.79 (m, 1H), 7.43 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.24 (d,  $J$  = 1.4 Hz, 1H), 6.98 – 6.95 (m, 1H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 2.28 (d,  $J$  = 1.1 Hz, 3H), 1.32 (s, 9H).

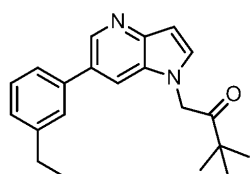
[0866] 실시예 144: 1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온.



[0867]

[0868] 표제 화합물을 실시예 140과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 342.2; m/z 실측치, 343.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (s, 1H), 7.92 (s, 1H), 7.83 – 7.77 (m, 2H), 7.62 – 7.53 (m, 2H), 7.48 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.84 (t,  $J$  = 56.2 Hz, 1H), 6.66 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 1.31 (s, 9H).

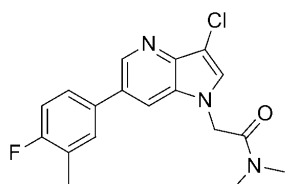
[0869] 실시예 145: 1-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온.



[0870]

[0871] 표제 화합물을 실시예 140과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{24}N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 320.2; m/z 실측치, 321.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.84 (dd,  $J$  = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 7.49 – 7.41 (m, 3H), 7.37 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.21 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 2.72 (q,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 1.31 (s, 9H), 1.28 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

[0872] 실시예 146: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



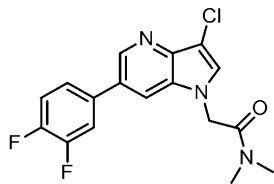
[0873]

[0874] 단계 A: 2-(6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 0°C에서 DMF (60 mL) 중의 6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 5, 500 mg, 2.16 mmol)의 용액에, NaH (121 mg, 3.02 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 30분간 교반한 다음에, 0°C로 냉각시켜, 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드 (430 mg, 2.59 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실리카 겔 상에서 농축시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , DCM 중의 0 내지 30% MeOH)에 의해, 표제 화합물 (282 mg, 41%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{11}H_{11}BrClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.0; m/z 실측치, 316.0  $[M+H]^+$ .

[0875] 단계 B: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드. 다이옥산 (2.9 mL) 중의 2-(6-브로모-3-클로로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 (100 mg, 0.31 mmol)의 용액에, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 (73 mg, 0.47 mmol), Pd(dppf) $Cl_2$  (16 mg, 0.02 mmol),  $Cs_2CO_3$  (205 mg, 0.63 mmol) 및 물 (0.6 mL)을 첨가하였다. 90°C에서 3시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜,  $NaHCO_3$  (aq)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 EtOAc (3 × 60 mL)로 추출하였다. 합한 유기물을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (염기성 HPLC 5 내지 95% ACN)에 의해, 표제 화합물 (36 mg, 33%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500

MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.62 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.41 – 7.33 (m, 2H), 7.31 (s, 1H), 7.09 (t,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 2.35 (d,  $J = 2.0$  Hz, 3H).

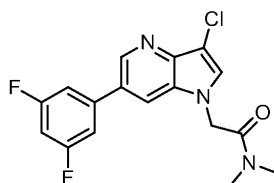
[0876] 실시예 147: 2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0877]

[0878] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{17}\text{H}_{14}\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 349.1;  $m/z$  실험치, 350.0  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.64 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.43 – 7.38 (m, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.35 – 7.30 (m, 1H), 7.29 – 7.23 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.15 (s, 3H), 3.02 (s, 3H).

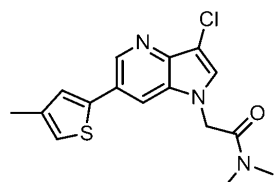
[0879] 실시예 148: 2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0880]

[0881] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{17}\text{H}_{14}\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 349.1;  $m/z$  실험치, 350.0  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.67 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.17 – 7.11 (m, 2H), 6.86 – 6.79 (m, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.15 (s, 3H), 3.03 (s, 3H).

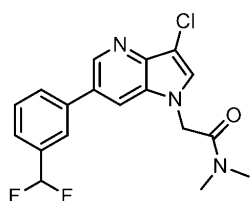
[0882] 실시예 149: 2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0883]

[0884] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{16}\text{H}_{16}\text{ClN}_3\text{OS}$ 에 대한 질량 계산치, 333.1;  $m/z$  실험치, 334.0  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  8.78 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.63 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.30 (s, 1H), 7.15 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.90 (s, 1H), 4.88 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.30 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H).

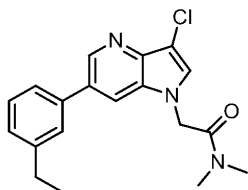
[0885] 실시예 150: 2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0886]

[0887] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.76 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.76 – 7.67 (m, 3H), 7.60 – 7.49 (m, 2H), 7.35 (s, 1H), 6.73 (t,  $J = 56.4$  Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.14 (s, 3H), 3.01 (s, 3H).

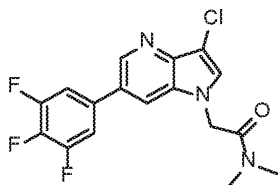
[0888] 실시예 151: 2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0889]

[0890] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.63 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.61 – 7.47 (m, 3H), 7.40 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 7.25 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.74 (q,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.30 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

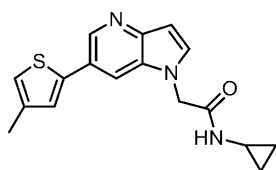
[0891] 실시예 152: 2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[0892]

[0893] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.63 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.25 – 7.20 (m, 2H), 4.94 (s, 2H), 3.16 (s, 3H), 3.03 (s, 3H).

[0894] 실시예 153: N-사이클로프로필-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.

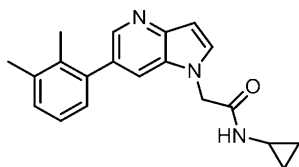


[0895]

[0896] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.88 (s, 1H), 8.60 (s, 1H), 8.41 (d,  $J = 4.3$  Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.27 (s, 1H), 6.79 – 6.75 (m, 1H), 5.04 (s, 2H), 2.69 – 2.62 (m, 1H), 2.29 (t,  $J = 1.3$  Hz, 3H), 0.68 – 0.62 (m, 2H), 0.49 – 0.44 (m, 2H).

[0897] 실시예 154: N-사이클로프로필-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.





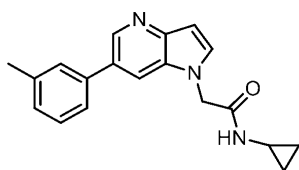
[0898]

[0899]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2;  $m/z$  실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.38 (d,  $J = 4.1$  Hz, 1H), 8.14 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.33 – 7.29 (m, 1H), 7.25 (t,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 7.21 – 7.18 (m, 1H), 6.86 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 2.66 – 2.59 (m, 1H), 2.35 (s, 3H), 2.16 (s, 3H), 0.66 – 0.60 (m, 2H), 0.45 – 0.40 (m, 2H).

[0900]

실시예 155: N-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드. 트라이플루오로아세테이트 염.



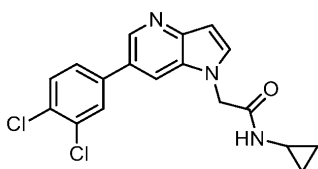
[0901]

[0902]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2;  $m/z$  실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.00 (s, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.43 (d,  $J = 4.1$  Hz, 1H), 8.16 – 8.12 (m, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.66 (d,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.49 – 7.44 (m, 1H), 7.31 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 6.87 – 6.83 (m, 1H), 5.13 (s, 2H), 2.69 – 2.62 (m, 1H), 2.43 (d,  $J = 1.7$  Hz, 3H), 0.68 – 0.61 (m, 2H), 0.49 – 0.43 (m, 2H).

[0903]

실시예 156: N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드. 트라이플루오로아세테이트 염.



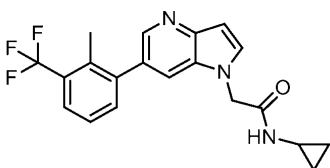
[0904]

[0905]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.99 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.80 (s, 1H), 8.40 (d,  $J = 4.1$  Hz, 1H), 8.17 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 8.05 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.89 – 7.82 (m, 2H), 6.81 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 2.69 – 2.62 (m, 1H), 0.67 – 0.62 (m, 2H), 0.48 – 0.44 (m, 2H).

[0906]

실시예 157: N-사이클로프로필-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드. 트라이플루오로아세테이트 염.



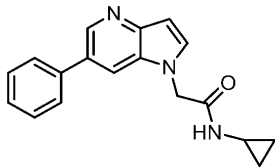
[0907]

[0908]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1;

m/z 실측치, 374.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.67 – 8.64 (m, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.37 – 8.33 (m, 1H), 8.08 – 8.04 (m, 1H), 7.85 – 7.81 (m, 1H), 7.66 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.56 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 6.84 – 6.81 (m, 1H), 5.01 (s, 2H), 2.66 – 2.59 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 0.65 – 0.59 (m, 2H), 0.45 – 0.39 (m, 2H).

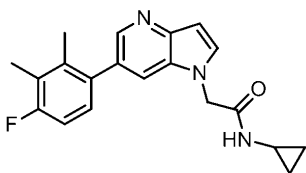
[0909] 실시예 158: N-사이클로프로필-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0910]

[0911] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 291.1; m/z 실측치, 292.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.03 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 8.97 (s, 1H), 8.42 (d,  $J$  = 4.1 Hz, 1H), 8.16 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.90 – 7.85 (m, 2H), 7.62 – 7.57 (m, 2H), 7.53 – 7.48 (m, 1H), 6.87 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 2.68 – 2.62 (m, 1H), 0.67 – 0.61 (m, 2H), 0.48 – 0.43 (m, 2H).

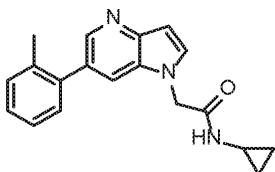
[0912] 실시예 159: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0913]

[0914] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.37 (d,  $J$  = 4.1 Hz, 1H), 8.11 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.27 – 7.15 (m, 2H), 6.84 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.04 (s, 2H), 2.65 – 2.59 (m, 1H), 2.25 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 3H), 2.19 (s, 3H), 0.66 – 0.60 (m, 2H), 0.45 – 0.40 (m, 2H).

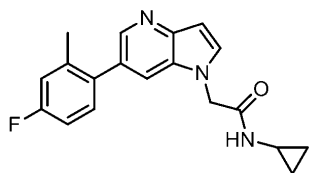
[0915] 실시예 160: N-사이클로프로필-2-[6-(o-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0916]

[0917] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2; m/z 실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.35 – 8.27 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 7.67 – 7.58 (m, 1H), 7.39 – 7.24 (m, 4H), 6.60 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 4.82 (s, 2H), 2.66 – 2.60 (m, 1H), 2.27 (s, 3H), 0.66 – 0.58 (m, 2H), 0.45 – 0.37 (m, 2H).

[0918] 실시예 161: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



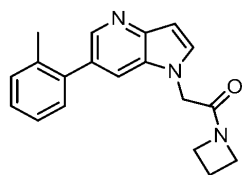
[0919]

[0920]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.64 (s, 1H), 8.38 (d,  $J = 4.4$  Hz, 1H), 8.16 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.42 (dd,  $J = 8.4, 5.9$  Hz, 1H), 7.30 (dd,  $J = 10.2, 3.0$  Hz, 1H), 7.27 – 7.18 (m, 1H), 6.87 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 2.67 – 2.61 (m, 1H), 2.30 (d,  $J = 2.2$  Hz, 3H), 0.69 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.39 (m, 2H).

[0921]

실시예 162: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(*o*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



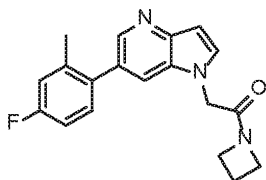
[0922]

[0923]

표제 화합물을 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일)에탄온 및 *o*-톨릴보론산을 사용하여, 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2;  $m/z$  실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.66 (s, 1H), 8.11 – 8.07 (m, 1H), 7.43 – 7.34 (m, 4H), 6.88 – 6.84 (m, 1H), 5.18 (s, 2H), 4.30 – 4.22 (m, 2H), 3.94 – 3.86 (m, 2H), 2.32 – 2.24 (m, 5H).

[0924]

실시예 163: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



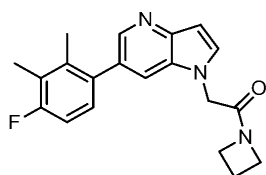
[0925]

[0926]

표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.06 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.41 (dd,  $J = 8.5, 6.0$  Hz, 1H), 7.29 (dd,  $J = 10.1, 2.8$  Hz, 1H), 7.21 (td,  $J = 8.5, 2.9$  Hz, 1H), 6.85 (dd,  $J = 3.3, 0.7$  Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.26 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.24 (m, 5H).

[0927]

실시예 164: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



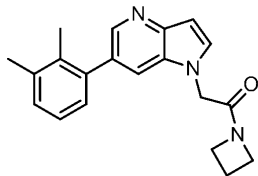
[0928]

[0929]

표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;

m/z 실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.57 (s, 1H), 8.42 (s, 1H), 7.99 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.25 – 7.13 (m, 2H), 6.81 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.31 – 2.22 (m, 5H), 2.17 (s, 3H).

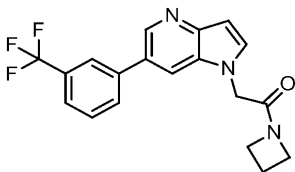
[0930] 실시예 165: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0931]

[0932] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2; m/z 실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 8.59 (s, 1H), 8.07 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.31 (dd,  $J$  = 7.6, 1.5 Hz, 1H), 7.25 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 7.19 (dd,  $J$  = 7.7, 1.6 Hz, 1H), 6.86 (d,  $J$  = 3.1 Hz, 1H), 5.17 (s, 2H), 4.26 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.33 – 2.24 (m, 2H), 2.15 (s, 3H).

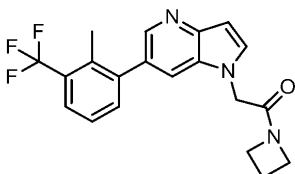
[0933] 실시예 166: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0934]

[0935] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.05 (s, 1H), 8.90 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.18 – 8.14 (m, 1H), 8.05 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.88 – 7.79 (m, 2H), 6.85 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 4.28 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.92 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.36 – 2.25 (m, 2H).

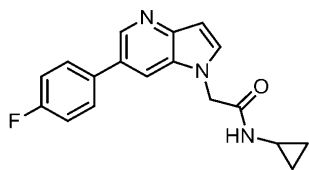
[0936] 실시예 167: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0937]

[0938] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 374.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.07 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.85 (dd,  $J$  = 8.0, 1.3 Hz, 1H), 7.67 (d,  $J$  = 7.2 Hz, 1H), 7.58 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 6.87 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.34 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.33 – 2.24 (m, 2H).

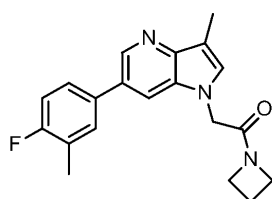
[0939] 실시예 168: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[0940]

[0941] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1; m/z 실측치, 310.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.35 – 8.32 (m, 1H), 8.07 – 8.05 (m, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.63 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 2H), 6.60 – 6.57 (m, 1H), 4.86 (s, 2H), 2.68 – 2.65 (m, 1H), 0.65 – 0.60 (m, 2H), 0.46 – 0.41 (m, 2H).

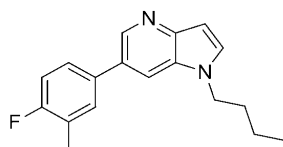
[0942] 실시예 169: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0943]

[0944] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO)  $\delta$  8.59 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 7.2 Hz, 1H), 7.61 – 7.51 (m, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.32 – 7.19 (m, 1H), 4.92 (s, 2H), 4.18 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.31 – 2.18 (m, 5H).

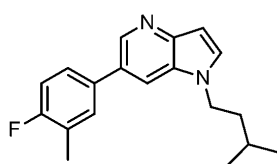
[0945] 실시예 170: 1-부틸-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트레이트 염.



[0946]

[0947] 0℃에서 DMF (1.5 mL) 중의 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (60 mg, 0.26 mmol)의 용액에, NaH (14.8 mg, 0.37 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 30분간 교반한 다음에, 0℃로 냉각시켜, 1-브로모부탄 (0.22 mL, 0.278 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 반응물을 메탄올로 3 mL로 희석시키고, 여과하여, HPLC 방법 C로 정제하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}FN_2$ 에 대한 질량 계산치, 282.2; m/z 실측치, 283.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.95 – 8.88 (m, 2H), 8.19 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.83 (dd,  $J$  = 7.6, 2.5 Hz, 1H), 7.77 – 7.71 (m, 1H), 7.35 (dd,  $J$  = 9.6, 8.5 Hz, 1H), 6.80 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 4.43 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 2H), 2.36 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 1.86 – 1.75 (m, 2H), 1.33 – 1.20 (m, 2H), 0.89 (t,  $J$  = 7.3 Hz, 3H).

[0948] 실시예 171: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-아이소펜틸-피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트레이트 염.

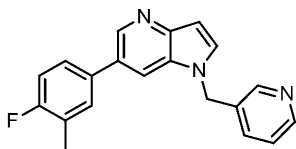


[0949]

[0950] 표제 화합물을 1-브로모-3-메틸부탄 및 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 사용하여, 실시예

170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}FN_2$ 에 대한 질량 계산치, 296.2;  $m/z$  실측치, 297.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.94 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.92 (s, 1H), 8.22 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.86 – 7.81 (m, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.36 (dd,  $J = 9.6, 8.6$  Hz, 1H), 6.82 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 4.50 – 4.41 (m, 2H), 2.36 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H), 1.78 – 1.70 (m, 2H), 1.58 – 1.48 (m, 1H), 0.94 (d,  $J = 6.6$  Hz, 6H).

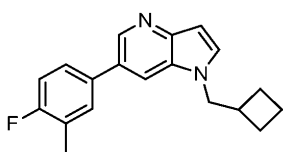
[0951] 실시예 172: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-(3-피리딜메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트이트 염.



[0952]

[0953] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(브로모메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{16}FN_3$ 에 대한 질량 계산치, 317.1;  $m/z$  실측치, 318.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.03 (s, 1H), 8.99 – 8.96 (m, 1H), 8.72 – 8.69 (m, 1H), 8.58 – 8.53 (m, 1H), 8.32 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 2H), 7.75 – 7.69 (m, 1H), 7.49 – 7.45 (m, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 1H), 6.89 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.77 (s, 2H), 2.35 (s, 3H).

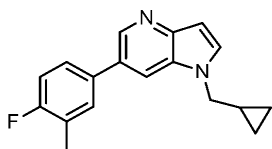
[0954] 실시예 173: 1-(사이클로부틸메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트이트 염.



[0955]

[0956] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 (브로모메틸)사이클로부탄을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}FN_2$ 에 대한 질량 계산치, 294.2;  $m/z$  실측치, 295.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.98 (s, 1H), 8.95 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.20 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.84 (dd,  $J = 7.3, 2.5$  Hz, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.39 – 7.32 (m, 1H), 6.81 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.47 (d,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 2.91 – 2.81 (m, 1H), 2.36 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H), 1.99 – 1.77 (m, 6H).

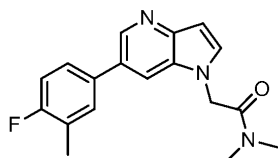
[0957] 실시예 174: 1-(사이클로프로필메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트이트 염.



[0958]

[0959] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 (브로모메틸)사이클로프로판을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}FN_2$ 에 대한 질량 계산치, 280.1;  $m/z$  실측치, 281.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.95 – 8.90 (m, 2H), 8.22 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.84 (dd,  $J = 7.7, 2.5$  Hz, 1H), 7.77 – 7.71 (m, 1H), 7.35 (dd,  $J = 9.6, 8.5$  Hz, 1H), 6.81 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.30 (d,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 2.36 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H), 1.41 – 1.33 (m, 1H), 0.58 – 0.52 (m, 2H), 0.49 – 0.44 (m, 2H).

[0960] 실시예 175: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세트이트 염.



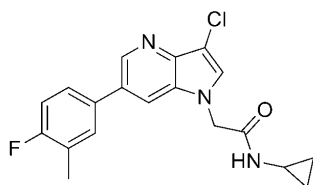
[0961]

[0962]

표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1;  $m/z$  실측치, 312.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.99 (s, 1H), 8.93 (s, 1H), 8.09 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.82 – 7.78 (m, 1H), 7.74 – 7.68 (m, 1H), 7.37 (t,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 6.86 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.87 (s, 3H), 2.36 (s, 3H).

[0963]

실시예 176: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



[0964]

[0965]

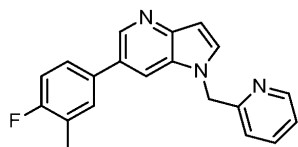
단계 A: 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘.  $-20^\circ C$ 로 냉각된 DMF (5 mL) 중의 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 66, 단계 A의 중간체, 500 mg, 2.2 mmol)의 용액에, NCS (384 mg, 2.9 mmol)를 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 실온에서 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 20분간 교반하였다. 표제 화합물을 여과에 의해 수집하여, 물 (472 mg, 82%)로 세정하였다. 조생성물을 더 이상 정제하지 않고 다음 단계에서 사용하였다.  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  11.68 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.88 – 7.81 (m, 1H), 7.67 (d,  $J = 7.0$  Hz, 1H), 7.61 – 7.52 (m, 1H), 7.26 (t,  $J = 9.2$  Hz, 1H), 2.33 (s, 3H).

[0966]

단계 B: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염. 표제 화합물을 2-브로모-1-사이클로프로필에탄온 대신에 2-브로모-N-사이클로프로필아세트아미드를 사용하여, 실시예 136, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1;  $m/z$  실측치, 358.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.74 – 8.71 (m, 1H), 8.35 – 8.32 (m, 1H), 8.22 – 8.20 (m, 1H), 7.86 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 7.70 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 1H), 7.32 – 7.25 (m, 1H), 4.90 (s, 2H), 2.68 – 2.62 (m, 1H), 2.34 (s, 3H), 0.66 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.41 (m, 2H).

[0967]

실시예 177: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피리딜메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염.



[0968]

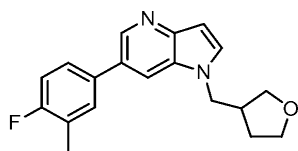
[0969]

표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-(브로모메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{16}FN_3$ 에 대한 질량 계산치, 317.1;  $m/z$  실측치, 318.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.92 (s, 1H), 8.89 – 8.85 (m, 1H), 8.50 – 8.47 (m, 1H), 8.21 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.36 – 7.26 (m, 3H), 6.84 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.79 (s, 2H), 2.33 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H).

[0970]

실시예 178: (R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(테트라하이드로푸란-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플

루오로아세테이트 염.



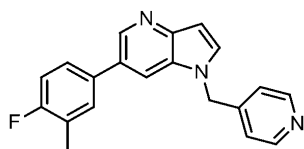
[0971]

[0972]

표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(브로모메틸)테트라하이드로푸란을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.97 – 8.92 (m, 2H), 8.22 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.83 (dd,  $J$  = 7.4, 2.5 Hz, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.39 – 7.31 (m, 1H), 6.83 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 4.50 – 4.37 (m, 2H), 3.88 – 3.80 (m, 1H), 3.70 – 3.60 (m, 2H), 3.51 – 3.43 (m, 1H), 2.92 – 2.81 (m, 1H), 2.36 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 3H), 1.94 – 1.83 (m, 1H), 1.69 – 1.56 (m, 1H).

[0973]

실시예 179: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-피리딜메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염.



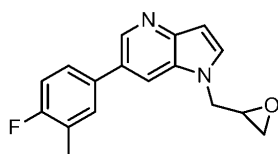
[0974]

[0975]

표제 화합물을 2-(클로로메틸)피리딘 및 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{16}FN_3$ 에 대한 질량 계산치, 317.1; m/z 실측치, 318.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.96 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.63 – 8.58 (m, 2H), 8.24 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.77 (dd,  $J$  = 7.5, 2.4 Hz, 1H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 3H), 6.91 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.84 (s, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H).

[0976]

실시예 180: (R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥시란-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염.



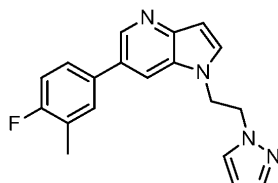
[0977]

[0978]

표제 화합물을 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 282.1; m/z 실측치, 283.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.93 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.10 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.83 – 7.79 (m, 1H), 7.74 – 7.69 (m, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 6.83 – 6.79 (m, 1H), 4.54 (dd,  $J$  = 14.5, 3.5 Hz, 1H), 4.42 – 4.36 (m, 1H), 3.88 – 3.82 (m, 1H), 3.41 (dd,  $J$  = 10.9, 5.2 Hz, 1H), 3.27 (dd,  $J$  = 10.9, 6.4 Hz, 1H), 2.36 (s, 3H).

[0979]

실시예 181: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피라졸-1-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염.



[0980]

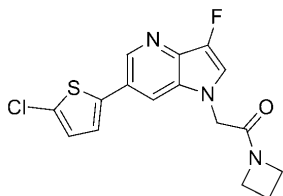
[0981]

표제 화합물을 1-(2-클로로에틸)-1H-피라졸 및 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘을 사용하여,



실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}FN_4$ 에 대한 질량 계산치, 320.1;  $m/z$  실측치, 321.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.87 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 7.81 – 7.72 (m, 2H), 7.70 – 7.63 (m, 1H), 7.42 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.39 – 7.32 (m, 2H), 6.73 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 6.08 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 4.85 (t,  $J = 5.6$  Hz, 2H), 4.59 (dd,  $J = 6.5, 4.5$  Hz, 2H), 2.36 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

[0982] 실시예 182: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

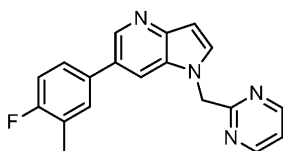


[0983]

[0984] 단계 A: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온. 표제 화합물을 실시예 29, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.43 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.28 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.66 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.22 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.33 – 2.23 (m, 2H).

[0985] 단계 B: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 (5-클로로티오펜-2-일)보론산을 사용하여, 실시예 29, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 349.0;  $m/z$  실측치, 349.9  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.49 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.33 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.04 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.36 – 4.28 (m, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.44 – 2.34 (m, 2H).

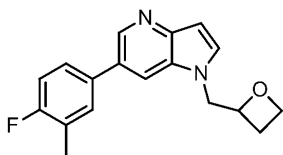
[0986] 실시예 183: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리미딘-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트레이트.



[0987]

[0988] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-(클로로메틸)피리미딘을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}FN_4$ 에 대한 질량 계산치, 318.1;  $m/z$  실측치, 319.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.86 – 8.82 (m, 2H), 8.73 (d,  $J = 5.0$  Hz, 2H), 8.19 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.67 (dd,  $J = 7.2, 2.5$  Hz, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.39 (t,  $J = 4.9$  Hz, 1H), 7.21 (t,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 6.92 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.93 (s, 2H), 2.37 (d,  $J = 2.0$  Hz, 3H).

[0989] 실시예 184: (R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥세탄-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트레이트 염.

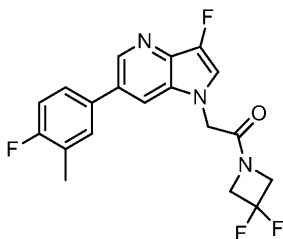


[0990]

[0991] 표제 화합물을 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1;

m/z 실측치, 297.2 [M+H]<sup>+</sup>.

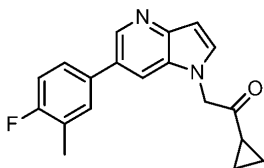
[0992] 실시예 185: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[0993]

[0994] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 16) 및 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>F<sub>4</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.67 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.16 (t, J = 2.2 Hz, 1H), 7.70 – 7.65 (m, 1H), 7.63 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.32 – 7.21 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.73 (t, J = 12.3 Hz, 2H), 4.37 (t, J = 12.6 Hz, 2H), 2.33 (d, J = 1.9 Hz, 3H).

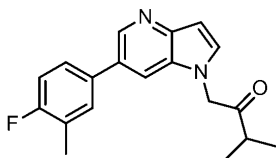
[0995] 실시예 186: 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[0996]

[0997] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-1-사이클로프로필에탄온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>17</sub>FN<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 308.1; m/z 실측치, 309.2 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 13.05 (s, 1H), 9.05 (s, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.33 – 8.28 (m, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 1H), 7.72 – 7.66 (m, 1H), 7.38 (t, J = 9.1 Hz, 1H), 7.02 (s, 1H), 6.12 (s, 2H), 2.41 – 2.31 (m, 4H), 1.18 – 1.11 (m, 2H), 1.08 – 1.00 (m, 2H).

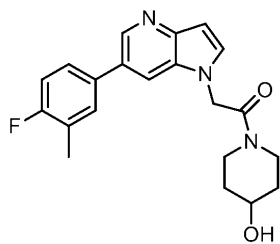
[0998] 실시예 187: 1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염.



[0999]

[1000] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 1-브로모-3-메틸부탄-2-온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.2 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 13.03 (s, 1H), 9.01 (d, J = 1.5 Hz, 1H), 8.87 – 8.84 (m, 1H), 8.32 (t, J = 3.1 Hz, 1H), 7.78 (dd, J = 7.6, 2.4 Hz, 1H), 7.73 – 7.66 (m, 1H), 7.43 – 7.36 (m, 1H), 7.00 – 6.96 (m, 1H), 6.05 (s, 2H), 3.05 – 2.97 (m, 1H), 2.36 (d, J = 1.9 Hz, 3H), 1.21 (d, J = 6.9 Hz, 6H).

[1001] 실시예 188: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



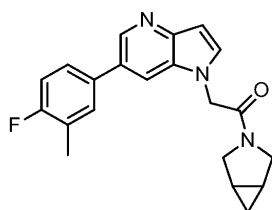
[1002]

[1003]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.2; m/z 실측치, 368.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.97 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.11 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 7.4, 2.5 Hz, 1H), 7.73 – 7.68 (m, 1H), 7.37 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 6.86 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.51 (s, 2H), 3.87 – 3.74 (m, 4H), 3.12 – 3.04 (m, 2H), 2.35 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 3H), 1.92 – 1.85 (m, 1H), 1.76 – 1.68 (m, 1H), 1.58 – 1.50 (m, 1H), 1.35 – 1.26 (m, 1H).

[1004]

실시예 189: (R/S)-1-(3-(4-아자바-이사이클로[3.1.0]헥산-3-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3.2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



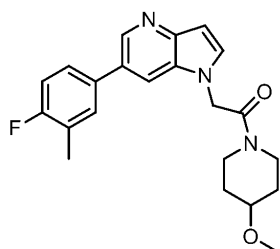
[1005]

[1006]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 349.2; m/z 실측치, 350.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.92 (s, 1H), 8.79 (s, 1H), 8.01 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.76 (dd,  $J$  = 7.2, 2.4 Hz, 1H), 7.71 – 7.65 (m, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 6.81 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.37 (d,  $J$  = 17.3 Hz, 1H), 5.24 (d,  $J$  = 17.2 Hz, 1H), 3.77 – 3.68 (m, 2H), 3.57 (d,  $J$  = 11.6 Hz, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.77 – 1.70 (m, 1H), 1.62 – 1.55 (m, 1H), 0.81 – 0.73 (m, 1H), 0.24 – 0.19 (m, 1H).

[1007]

실시예 190: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3.2-b]피리딘-1-일]-1-(4-메톡시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



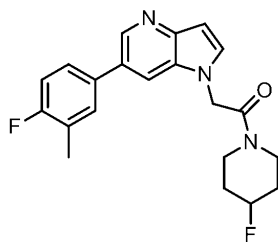
[1008]

[1009]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{24}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.2; m/z 실측치, 382.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.38 – 7.35 (m, 1H), 7.34 – 7.29 (m, 1H), 7.10 (t,  $J$  = 8.8 Hz, 1H), 6.86 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.22 (d,  $J$  = 16.9 Hz, 1H), 5.14 (d,  $J$  = 16.9 Hz, 1H), 3.80 – 3.72 (m, 2H), 3.56 – 3.49 (m, 2H), 3.48 – 3.41 (m, 1H), 3.38 (s, 3H), 2.34 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 1.99 – 1.90 (m, 1H), 1.88 – 1.80 (m, 1H), 1.80 – 1.72 (m, 1H), 1.70 – 1.62 (m, 1H).

[1010]

실시예 191: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3.2-b]피리딘-1-일]-1-(4-플루오로-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



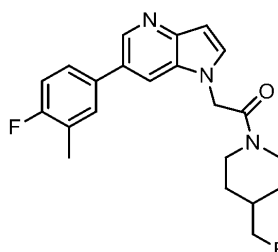
[1011]

[1012]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{21}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 369.2; m/z 실측치, 370.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.56 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.38 (dd,  $J$  = 7.0, 2.4 Hz, 1H), 7.36 – 7.31 (m, 1H), 7.12 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 1H), 6.94 – 6.91 (m, 1H), 5.23 (d,  $J$  = 16.8 Hz, 1H), 5.16 (d,  $J$  = 16.8 Hz, 1H), 5.04 – 4.87 (m, 1H), 4.04 – 3.96 (m, 1H), 3.77 – 3.68 (m, 1H), 3.67 – 3.59 (m, 1H), 3.50 – 3.40 (m, 1H), 2.35 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.11 – 2.02 (m, 1H), 2.01 – 1.87 (m, 2H), 1.86 – 1.78 (m, 1H).

[1013]

실시예 192: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[4-(플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



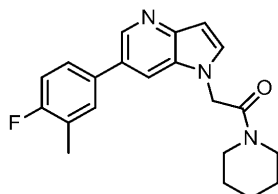
[1014]

[1015]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{23}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.2; m/z 실측치, 384.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.57 (s, 1H), 8.25 (s, 1H), 7.57 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.37 – 7.34 (m, 1H), 7.34 – 7.29 (m, 1H), 7.10 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 1H), 6.82 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.24 (d,  $J$  = 17.0 Hz, 1H), 5.19 (d,  $J$  = 17.0 Hz, 1H), 4.58 (d,  $J$  = 13.5 Hz, 1H), 4.43 – 4.34 (m, 1H), 4.33 – 4.24 (m, 1H), 3.97 (d,  $J$  = 13.8 Hz, 1H), 3.33 – 3.23 (m, 1H), 2.77 – 2.67 (m, 1H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.09 – 1.91 (m, 2H), 1.80 (d,  $J$  = 13.5 Hz, 1H), 1.49 – 1.38 (m, 1H), 1.37 – 1.26 (m, 1H).

[1016]

실시예 193: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



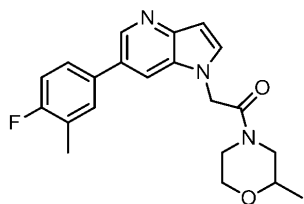
[1017]

[1018]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 351.2; m/z 실측치, 352.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.95 min.

[1019]

실시예 194: (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(2-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



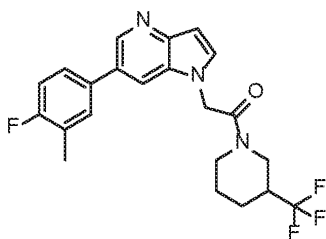
[1020]

[1021]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.2;  $m/z$  실측치, 368.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 ( $3\ \mu m$ ,  $50 \times 3\ mm$ ), 2.2 mL/min의 유량 (온도 =  $50^\circ C$ )에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.89\ min$ .

[1022]

실시예 195: (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(트라이플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



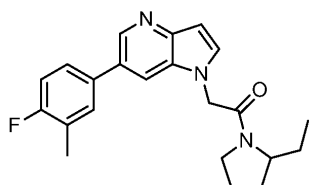
[1023]

[1024]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{21}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 419.2;  $m/z$  실측치, 420.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 ( $3\ \mu m$ ,  $50 \times 3\ mm$ ), 2.2 mL/min의 유량 (온도 =  $50^\circ C$ )에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 1.03\ min$ .

[1025]

실시예 196: (R/S)-1-(2-에틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



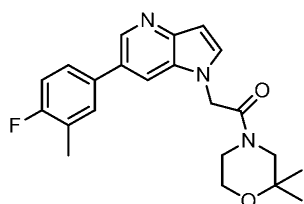
[1026]

[1027]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{24}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.2;  $m/z$  실측치, 366.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 ( $3\ \mu m$ ,  $50 \times 3\ mm$ ), 2.2 mL/min의 유량 (온도 =  $50^\circ C$ )에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.99\ min$ .

[1028]

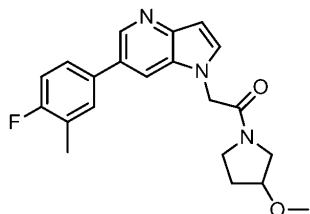
실시예 197: 1-(2,2-다이메틸모르폴린-4-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1029]

[1030] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{24}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.2; m/z 실측치, 382.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.91 min.

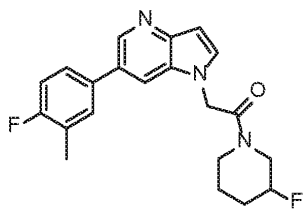
[1031] 실시예 198: (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시피롤리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1032]

[1033] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.2; m/z 실측치, 368.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.88 min.

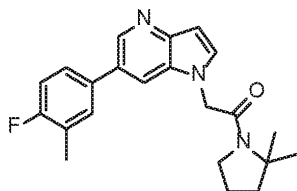
[1034] 실시예 199: (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1035]

[1036] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 369.2; m/z 실측치, 370.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.92 min.

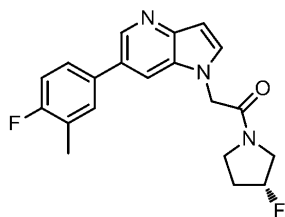
[1037] 실시예 200: 1-(2,2-다이메틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1038]

[1039] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{24}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.2; m/z 실측치, 366.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 1.00 min.

[1040] 실시예 201: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



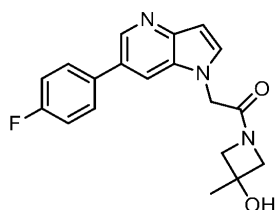
[1041]

[1042]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 1.31 min.

[1043]

실시예 202: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시-3-메틸-아제티딘-1-일)에탄온.



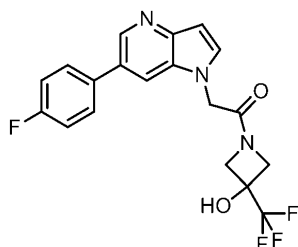
[1044]

[1045]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.11 – 8.08 (m, 1H), 7.82 – 7.75 (m, 2H), 7.61 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.39 – 7.30 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.2, 1.0 Hz, 1H), 5.69 (s, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.07 – 3.99 (m, 2H), 3.80 – 3.69 (m, 2H), 1.40 (s, 3H).

[1046]

실시예 203: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-하이드록시-3-(트라이플루오로메틸)아제티딘-1-일]에탄온.



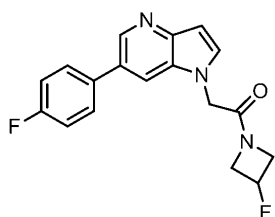
[1047]

[1048]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 393.1; m/z 실측치, 394.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.11 – 8.08 (m, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.63 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.47 (d,  $J$  = 10.0 Hz, 1H), 4.24 (d,  $J$  = 9.9 Hz, 1H), 4.14 (d,  $J$  = 10.8 Hz, 1H), 3.91 (d,  $J$  = 10.8 Hz, 1H).

[1049]

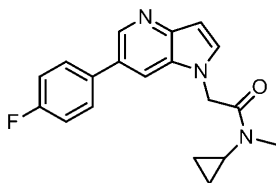
실시예 204: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1050]

[1051] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.12 – 8.08 (m, 1H), 7.81 – 7.74 (m, 2H), 7.60 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.55 – 5.35 (m, 1H), 5.07 (d,  $J$  = 2.3 Hz, 2H), 4.61 – 4.45 (m, 1H), 4.38 – 4.17 (m, 2H), 4.04 – 3.88 (m, 1H).

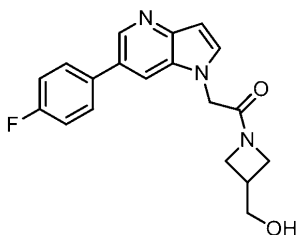
[1052] 실시예 205: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[1053]

[1054] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.82 – 7.74 (m, 2H), 7.62 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 2H), 6.58 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 3.00 – 2.95 (m, 1H), 2.83 (s, 3H), 1.02 – 0.95 (m, 2H), 0.93 (dd,  $J$  = 7.0, 4.6 Hz, 2H).

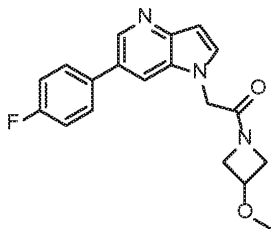
[1055] 실시예 206: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(하이드록시메틸)아제티딘-1-일]에탄온.



[1056]

[1057] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 – 8.61 (m, 1H), 8.10 – 8.06 (m, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.61 – 7.58 (m, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.59 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.83 (t,  $J$  = 5.1 Hz, 1H), 4.20 (t,  $J$  = 8.3 Hz, 1H), 3.96 – 3.86 (m, 2H), 3.65 – 3.60 (m, 1H), 3.57 – 3.51 (m, 2H), 2.77 – 2.67 (m, 1H).

[1058] 실시예 207: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온.

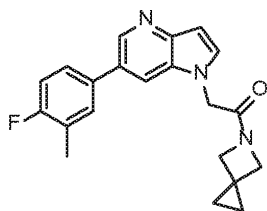


[1059]

[1060] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 – 8.61 (m, 1H), 8.11 – 8.06 (m, 1H), 7.82 – 7.74 (m, 2H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.61 – 6.58 (m, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.41 – 4.34 (m, 1H), 4.29 – 4.22 (m, 1H), 4.11 – 4.02 (m, 2H), 3.75 – 3.68 (m, 1H), 3.23 (s, 3H).

[1061] 실시예 208: 1-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.





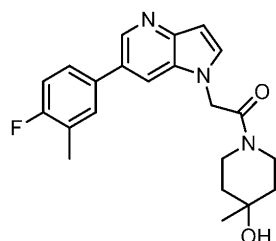
[1062]

[1063]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 349.2;  $m/z$  실측치, 350.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.00 (s, 1H), 8.96 (s, 1H), 8.11 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.83 – 7.79 (m, 1H), 7.75 – 7.69 (m, 1H), 7.38 (t,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 6.87 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.35 (s, 2H), 3.99 (s, 2H), 2.36 (s, 3H), 0.74 – 0.65 (m, 4H).

[1064]

실시예 209: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-4-메틸-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



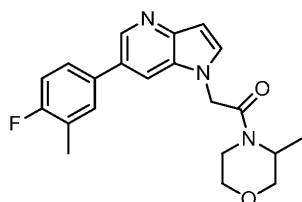
[1065]

[1066]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{24}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 381.2;  $m/z$  실측치, 382.2  $[M+H]^+$ .

[1067]

실시예 210: (R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



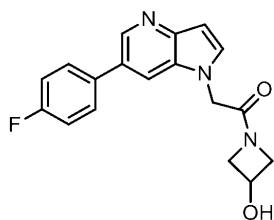
[1068]

[1069]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 367.2;  $m/z$  실측치, 368.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ , 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.88$  min.

[1070]

실시예 211: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온.



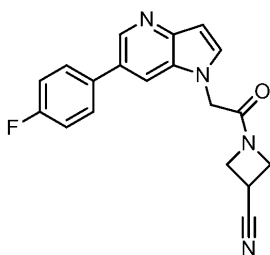
[1071]

[1072]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;  $m/z$  실측치, 326.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.10 – 8.08 (m, 1H),

7.80 – 7.76 (m, 2H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.36 – 7.31 (m, 2H), 6.61 – 6.59 (m, 1H), 5.78 (d,  $J = 5.7$  Hz, 1H), 5.03 (d,  $J = 2.8$  Hz, 2H), 4.55 – 4.47 (m, 1H), 4.38 – 4.33 (m, 1H), 4.12 – 4.07 (m, 1H), 3.96 – 3.91 (m, 1H), 3.65 – 3.61 (m, 1H).

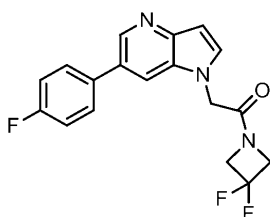
[1073] 실시예 212: 1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]아제티딘-3-카르보니트릴.



[1074]

[1075] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}FN_4O$ 에 대한 질량 계산치, 334.1;  $m/z$  실측치, 335.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.11 – 8.08 (m, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.52 – 4.36 (m, 1H), 4.23 – 4.16 (m, 1H), 4.12 – 4.01 (m, 2H), 3.91 – 3.81 (m, 1H).

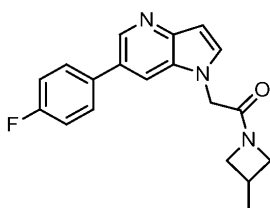
[1076] 실시예 213: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1077]

[1078] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.12 – 8.10 (m, 1H), 7.80 – 7.75 (m, 2H), 7.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.14 (s, 2H), 4.75 – 4.68 (m, 2H), 4.41 – 4.33 (m, 2H).

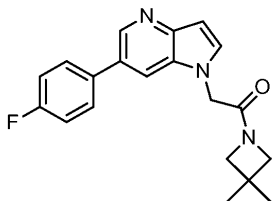
[1079] 실시예 214: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸아제티딘-1-일)에탄온.



[1080]

[1081] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.10 – 8.08 (m, 1H), 7.80 – 7.76 (m, 2H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.31 (m, 2H), 6.60 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.30 (t,  $J = 8.4$  Hz, 1H), 4.01 (t,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 3.76 (dd,  $J = 8.4, 5.6$  Hz, 1H), 3.46 (dd,  $J = 9.5, 5.6$  Hz, 1H), 2.77 – 2.68 (m, 1H), 1.21 (d,  $J = 6.9$  Hz, 3H).

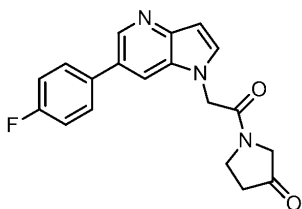
[1082] 실시예 215: 1-(3,3-다이메틸아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1083]

[1084] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.62 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.60 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 3.88 (s, 2H), 3.59 (s, 2H), 1.25 (s, 6H).

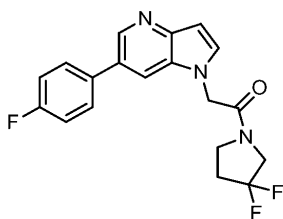
[1085] 실시예 216: 1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]피롤리딘-3-온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1086]

[1087] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 337.1; m/z 실측치, 338.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.75 min.

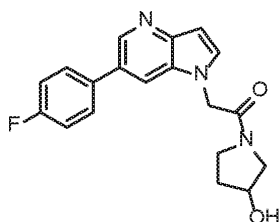
[1088] 실시예 217: 1-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1089]

[1090] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.60 – 7.56 (m, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.62 – 6.58 (m, 1H), 5.26 (s, 1H), 5.19 (s, 1H), 4.13 (t,  $J$  = 13.2 Hz, 1H), 3.90 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 3.74 (t,  $J$  = 13.2 Hz, 1H), 3.57 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 2.64 – 2.53 (m, 1H), 2.46 – 2.38 (m, 1H).

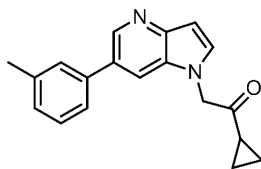
[1091] 실시예 218: (R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시피롤리딘-1-일)에탄온.



[1092]

[1093] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1; m/z 실측치, 340.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu$ m, 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.72 min.

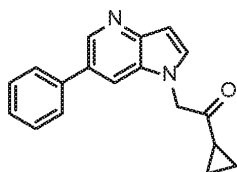
[1094] 실시예 219: 1-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1095]

[1096] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 290.1; m/z 실측치, 291.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.08 – 8.05 (m, 1H), 7.60 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.52 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.37 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.19 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 6.60 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.40 (s, 3H), 2.13 – 2.06 (m, 1H), 1.01 – 0.91 (m, 4H).

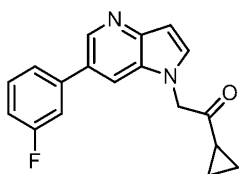
[1097] 실시예 220: 1-사이클로프로필-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[1098]

[1099] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 276.1; m/z 실측치, 277.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.10 – 8.08 (m, 1H), 7.77 – 7.71 (m, 2H), 7.61 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.53 – 7.47 (m, 2H), 7.41 – 7.35 (m, 1H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.14 – 2.06 (m, 1H), 1.02 – 0.91 (m, 4H).

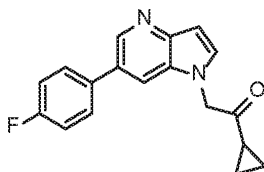
[1100] 실시예 221: 1-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1101]

[1102] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 294.1; m/z 실측치, 295.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.19 – 8.17 (m, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 3H), 7.56 – 7.50 (m, 1H), 7.23 – 7.17 (m, 1H), 6.62 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.48 (s, 2H), 2.14 – 2.07 (m, 1H), 1.02 – 0.96 (m, 2H), 0.96 – 0.91 (m, 2H).

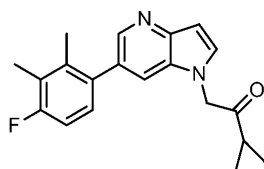
[1103] 실시예 222: 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1104]

[1105] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 294.1;  $m/z$  실측치, 295.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.10 – 8.07 (m, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.35 – 7.30 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.47 (s, 2H), 2.13 – 2.06 (m, 1H), 1.01 – 0.96 (m, 2H), 0.96 – 0.92 (m, 2H).

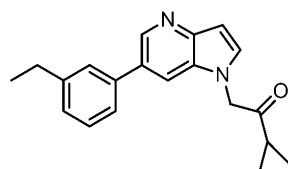
[1106] 실시예 223: 1-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1107]

[1108] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 324.2;  $m/z$  실측치, 325.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.24 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.70 – 7.67 (m, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.15 – 7.05 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.36 (s, 2H), 2.84 – 2.75 (m, 1H), 2.22 (d,  $J = 2.1$  Hz, 3H), 2.15 (s, 3H), 1.10 (d,  $J = 7.0$  Hz, 6H).

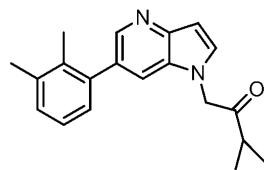
[1109] 실시예 224: 1-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1110]

[1111] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{22}N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 306.2;  $m/z$  실측치, 307.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.02 – 8.00 (m, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.56 – 7.54 (m, 1H), 7.54 – 7.50 (m, 1H), 7.40 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.24 – 7.20 (m, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 2.88 – 2.79 (m, 1H), 2.69 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.24 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H), 1.13 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

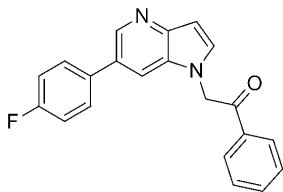
[1112] 실시예 225: 1-[6-(2,3-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1113]

[1114] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{22}N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 306.2;  $m/z$  실측치, 307.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.28 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.23 – 7.14 (m, 2H), 7.09 (dd,  $J = 7.3, 1.8$  Hz, 1H), 6.64 – 6.62 (m, 1H), 5.38 (s, 2H), 2.84 – 2.75 (m, 1H), 2.31 (s, 3H), 2.12 (s, 3H), 1.10 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

[1115] 실시예 226: 2-[6-(4-플루오로페닐)-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-페닐-에탄온.



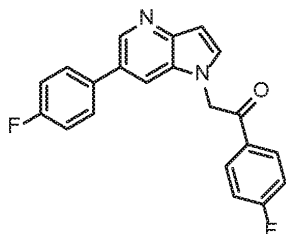
[1116]

[1117] 단계 A: 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 다이옥산 (100 mL) 중의 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (5 g, 25 mmol)의 용액에, 4-플루오로페닐보론산 (4.26 g, 30.5 mmol), Pd(dppf)Cl<sub>2</sub> (1.86 g, 2.54 mmol), Cs<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (24.8 g, 76.1 mmol) 및 물 (10 mL)을 첨가하였다. 90℃에서 16시간 후에, 반응 혼합물을 냉각시켜, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (5.3 g, 98%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>13</sub>H<sub>9</sub>FN<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 212.1; m/z 실측치, 213.1 [M+H]<sup>+</sup>.

[1118] 단계 B: 2-[6-(4-플루오로페닐)-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-페닐-에탄온.

[1119] 0℃에서 아르곤 하에 무수 DMF (5 mL) 중의 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (100 mg, 0.471 mmol)의 용액에, NaH (60% 분산액, 26 mg, 0.66 mmol)를 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반하였다. 반응 혼합물을 0℃로 냉각시켜, 혼합물에 2-브로모아세트페논 (98 mg, 0.495 mmol)을 조금씩 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 연속 교반하였다. 물을 반응 혼합물에 첨가하여, 반응물을 EtOAc로 추출하였다. 유기층을 합해, 건조시키고, 여과하여, 농축시켰다. HPLC 방법 C로 정제하여, 표제 화합물을 얻었다. MS (ESI): C<sub>21</sub>H<sub>15</sub>FN<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 330.1; m/z 실측치, 331.2 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.70 – 8.60 (s, 1H), 8.28 – 8.18 (s, 1H), 8.14 – 7.98 (m, 2H), 7.83 – 7.70 (m, 3H), 7.70 – 7.57 (m, 3H), 7.36 – 7.19 (m, 2H), 6.72 – 6.57 (d, J = 3.4 Hz, 1H), 6.11 – 5.94 (s, 1H).

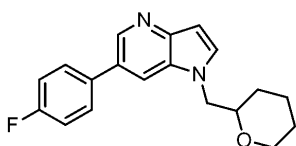
[1120] 실시예 227: 1-(4-플루오로페닐)-2-[6-(4-플루오로페닐)-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1121]

[1122] 표제 화합물을 실시예 226과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>21</sub>H<sub>14</sub>F<sub>2</sub>N<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.1 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 8.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.22 – 8.20 (m, 1H), 8.20 – 8.17 (m, 2H), 7.79 – 7.75 (m, 2H), 7.65 (d, J = 3.3 Hz, 1H), 7.49 – 7.44 (m, 2H), 7.32 – 7.27 (m, 2H), 6.65 (dd, J = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 6.02 (s, 2H).

[1123] 실시예 228: (R/S)-6-(4-플루오로페닐)-1-(테트라하이드로피란-2-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염.

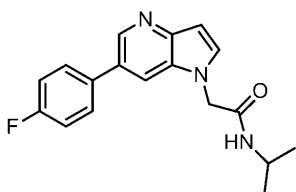


[1124]

[1125] 표제 화합물을 실시예 226과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>19</sub>FN<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.2 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-d<sub>6</sub>) δ 9.01 (br. s, 1H), 8.86 (s, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.95

— 7.89 (m, 2H), 7.47 — 7.39 (m, 2H), 6.80 (s, 1H), 4.50 (dd,  $J = 14.6, 3.5$  Hz, 1H), 4.41 (dd,  $J = 14.6, 7.8$  Hz, 1H), 3.84 — 3.79 (m, 1H), 3.70 — 3.63 (m, 1H), 3.30 — 3.22 (m, 1H), 1.78 (d,  $J = 12.2$  Hz, 1H), 1.70 — 1.64 (m, 1H), 1.52 — 1.36 (m, 3H), 1.25 — 1.13 (m, 1H).

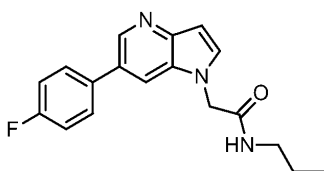
[1126] 실시예 229: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소프로필-아세트아미드.



[1127]

[1128] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (s, 1H), 8.16 (d,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.81 — 7.72 (m, 2H), 7.63 (s, 1H), 7.34 (t,  $J = 8.4$  Hz, 2H), 6.59 (s, 1H), 4.87 (s, 2H), 3.88 — 3.79 (m, 1H), 1.08 (d,  $J = 6.6$  Hz, 6H).

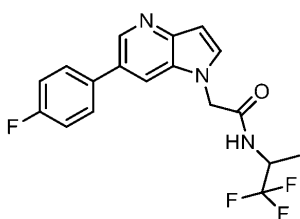
[1129] 실시예 230: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-프로필-아세트아미드.



[1130]

[1131] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (t,  $J = 5.6$  Hz, 1H), 8.08 — 8.06 (m, 1H), 7.80 — 7.73 (m, 2H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 — 7.31 (m, 2H), 6.59 (d,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 3.05 (q,  $J = 6.6$  Hz, 2H), 1.47 — 1.38 (m, 2H), 0.83 (t,  $J = 7.4$  Hz, 3H).

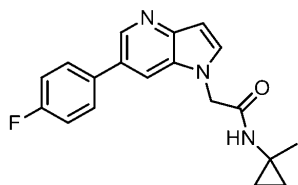
[1132] 실시예 231: (R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2,2,2-트라이플루오로-1-메틸-에틸)아세트아미드.



[1133]

[1134] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.91 (d,  $J = 8.8$  Hz, 1H), 8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.05 — 8.03 (m, 1H), 7.79 — 7.73 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.38 — 7.30 (m, 2H), 6.60 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.65 — 4.53 (m, 1H), 1.28 (d,  $J = 7.0$  Hz, 3H).

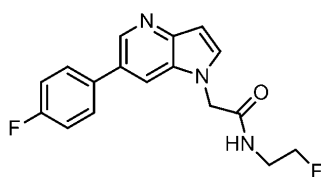
[1135] 실시예 232: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(1-메틸사이클로프로필)아세트아미드.



[1136]

[1137] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.05 – 8.02 (m, 1H), 7.79 – 7.73 (m, 2H), 7.62 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.38 – 7.31 (m, 2H), 6.59 (dd,  $J = 3.3$ , 0.9 Hz, 1H), 4.82 (s, 2H), 1.26 (s, 3H), 0.65 – 0.60 (m, 2H), 0.55 – 0.51 (m, 2H).

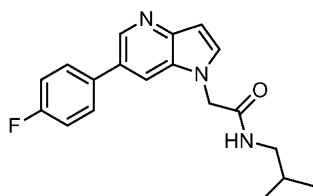
[1138] 실시예 233: N-(2-플루오로에틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1139]

[1140] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.64 (s, 1H), 8.50 (t,  $J = 5.7$  Hz, 1H), 8.10 – 8.06 (m, 1H), 7.81 – 7.74 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.62 – 6.59 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 4.50 (t,  $J = 5.0$  Hz, 1H), 4.39 (t,  $J = 4.9$  Hz, 1H), 3.47 – 3.41 (m, 2H).

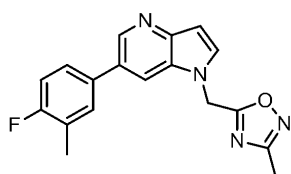
[1141] 실시예 234: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소부틸아세트아미드.



[1142]

[1143] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.19 (t,  $J = 5.8$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 1.9$ , 0.8 Hz, 1H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 2H), 6.59 (dd,  $J = 3.2$ , 0.9 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 2.92 (t,  $J = 6.3$  Hz, 2H), 1.75 – 1.63 (m, 1H), 0.83 (d,  $J = 6.7$  Hz, 6H).

[1144] 실시예 235: 5-[[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸.



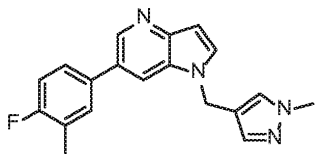
[1145]

[1146] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 5-(클로로메틸)-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}FN_4O$ 에 대한 질량 계산치, 322.1;



m/z 실측치, 323.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.29 – 8.25 (m, 1H), 7.79 (d,  $J$  = 3.5 Hz, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 6.68 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.96 (s, 2H), 2.32 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.27 (s, 3H).

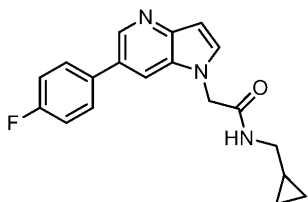
[1147] 실시예 236: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.



[1148]

[1149] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 4-(클로로메틸)-1-메틸-1H-피라졸을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}FN_4$ 에 대한 질량 계산치, 320.1; m/z 실측치, 321.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.22 – 8.19 (m, 1H), 7.72 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.70 – 7.66 (m, 1H), 7.61 – 7.55 (m, 2H), 7.26 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 6.57 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 6.14 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.33 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 3H).

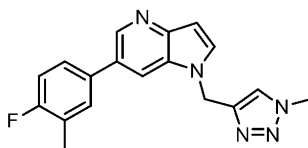
[1150] 실시예 237: N-(사이클로프로필메틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1151]

[1152] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 – 8.62 (m, 1H), 8.31 (t,  $J$  = 5.8 Hz, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.81 – 7.74 (m, 2H), 7.66 – 7.63 (m, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.61 – 6.58 (m, 1H), 4.93 (s, 2H), 3.00 – 2.95 (m, 2H), 0.95 – 0.86 (m, 1H), 0.42 – 0.36 (m, 2H), 0.17 – 0.12 (m, 2H).

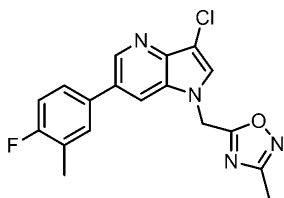
[1153] 실시예 238: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-[(1-메틸트리아졸-4-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.



[1154]

[1155] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 4-(클로로메틸)-1-메틸-1H-1,2,3-트리아졸을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_5$ 에 대한 질량 계산치, 321.1; m/z 실측치, 322.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.29 – 8.26 (m, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.75 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.72 – 7.67 (m, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 1H), 7.27 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.56 (s, 2H), 3.97 (s, 3H), 2.34 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H).

[1156] 실시예 239: 5-[[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸.



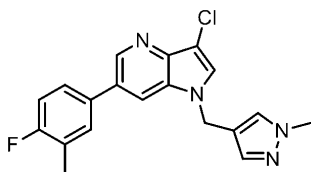
[1157]

[1158]

표제 화합물을 실시예 176과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClFN_4O$ 에 대한 질량 계산치, 356.1;  $m/z$  실측치, 357.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.39 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.73 – 7.69 (m, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 1H), 7.28 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 5.96 (s, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.26 (s, 3H).

[1159]

실시예 240: 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘.



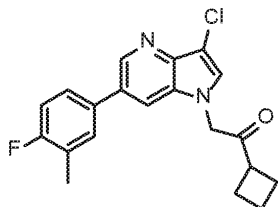
[1160]

[1161]

표제 화합물을 실시예 176과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClFN_4$ 에 대한 질량 계산치, 354.1;  $m/z$  실측치, 355.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.31 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.72 – 7.68 (m, 1H), 7.63 – 7.57 (m, 2H), 7.28 (t,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 6.19 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.34 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 3H).

[1162]

실시예 241: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로부틸-에탄온.



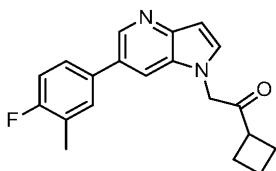
[1163]

[1164]

표제 화합물을 실시예 176과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}ClFN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 356.1;  $m/z$  실측치, 357.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 1.28 min.

[1165]

실시예 242: 1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



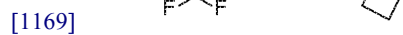
[1166]

[1167]

표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-1-사이클로부틸에탄온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 322.1;  $m/z$  실측치, 323.2  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한

애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.99$  min.

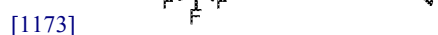
- [1168] 실시예 243: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



- [1170] 단계 A: 3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일]-1H-피콜로[3,2-b]피리딘. 표제 화합물을 (4-플루오로페닐)보론산 대신에 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산을 사용하여, 실시예 27, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  11.87 (s, 1H), 9.29 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 9.01 – 8.97 (m, 1H), 8.84 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.60 – 8.56 (m, 1H), 8.26 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.95 (s, 1H).

- [1171] 단계 B: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염. 표제 화합물을 실시예 68, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{ClF}_3\text{N}_4\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 394.1;  $m/z$  실측치, 395.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.33 (s, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.90 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.59 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 8.48 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.88 (s, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.25 (m, 2H).

- [1172] 실시예 244: 2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



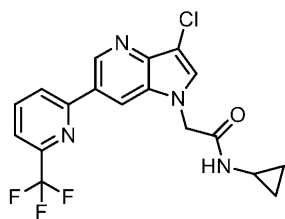
- [1174] 표제 화합물을 실시예 243과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{ClF}_3\text{N}_4\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 394.1;  $m/z$  실측치, 395.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.33 (s, 1H), 9.01 (s, 1H), 8.92 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.61 – 8.57 (m, 1H), 8.49 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.34 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 7.94 (s, 1H), 4.93 (s, 2H), 2.69 – 2.61 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.49 – 0.41 (m, 2H).

- [1175] 실시예 245: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



- [1177] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 243과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{ClF}_3\text{N}_4\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 394.1;  $m/z$  실측치, 395.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.17 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.59 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.40 (d,  $J = 8.1$  Hz, 1H), 8.24 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.90 (s, 2H), 5.07 (s, 2H), 4.28 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.92 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.35 – 2.25 (m, 2H).

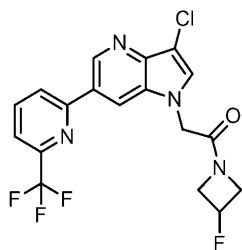
[1178] 실시예 246: 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드.



[1179]

[1180] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 243과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 394.1;  $m/z$  실측치, 395.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.18 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.55 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.44 – 8.39 (m, 2H), 8.23 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.89 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 2.69 – 2.61 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.49 – 0.43 (m, 2H).

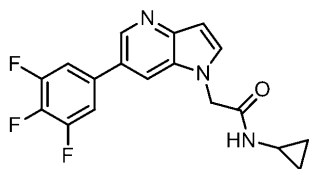
[1181] 실시예 247: 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아세트딘-1-일)에탄온.



[1182]

[1183] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 243과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_4N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 412.1;  $m/z$  실측치, 413.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.16 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.60 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.25 (d,  $J$  = 8.0 Hz, 1H), 8.12 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.76 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.71 (s, 1H), 5.54 – 5.32 (m, 1H), 5.11 (s, 2H), 4.70 – 4.56 (m, 1H), 4.51 – 4.27 (m, 2H), 4.19 – 4.04 (m, 1H).

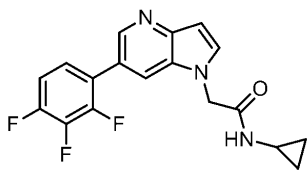
[1184] 실시예 248: N-사이클로프로필-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1185]

[1186] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.32 (d,  $J$  = 4.3 Hz, 1H), 8.23 – 8.20 (m, 1H), 7.84 – 7.76 (m, 2H), 7.68 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 4.88 (s, 2H), 2.69 – 2.61 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.41 (m, 2H).

[1187] 실시예 249: N-사이클로프로필-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

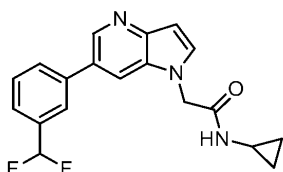


[1188]

[1189] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (2,3,4-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다.

MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.34 (d,  $J = 4.1$  Hz, 1H), 8.01 – 7.98 (m, 1H), 7.70 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.51 – 7.45 (m, 2H), 6.63 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 2.67 – 2.60 (m, 1H), 0.63 (td,  $J = 7.0, 4.7$  Hz, 2H), 0.46 – 0.40 (m, 2H).

[1190] 실시예 250: N-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

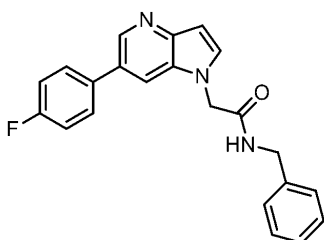


[1191]

[1192] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (3-(다이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다.

MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.35 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 8.15 – 8.13 (m, 1H), 7.95 – 7.90 (m, 2H), 7.69 – 7.63 (m, 2H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.12 (t,  $J = 55.8$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 4.89 (s, 2H), 2.70 – 2.61 (m, 1H), 0.66 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.42 (m, 2H).

[1193] 실시예 251: N-벤질-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

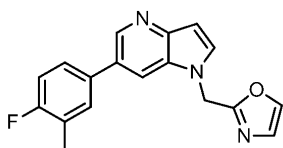


[1194]

[1195] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{22}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;

$m/z$  실측치, 360.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (t,  $J = 5.9$  Hz, 1H), 8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.77 – 7.71 (m, 2H), 7.68 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 7.28 – 7.19 (m, 5H), 6.60 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.31 (d,  $J = 5.9$  Hz, 2H).

[1196] 실시예 252: 2-[[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]옥사졸.

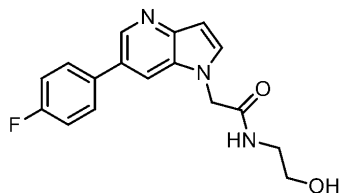


[1197]

[1198] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-(클로로메틸)옥사졸을 사용하여, 실시

예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.1; m/z 실측치, 308.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.21 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 8.06 (d,  $J = 1.0$  Hz, 1H), 7.77 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.69 – 7.65 (m, 1H), 7.60 – 7.54 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 7.17 (d,  $J = 0.9$  Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.74 (s, 2H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

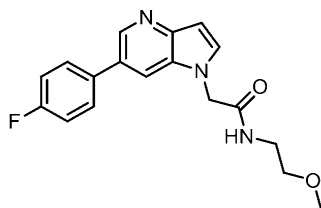
[1199] 실시예 253: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-하이드록시에틸)아세트아미드.



[1200]

[1201] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.25 – 8.20 (m, 1H), 8.12 – 8.09 (m, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 2H), 7.66 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.60 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.74 – 4.70 (m, 1H), 3.46 – 3.40 (m, 2H), 3.19 – 3.13 (m, 2H).

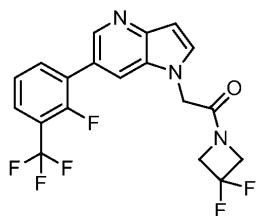
[1202] 실시예 254: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-메톡시에틸)아세트아미드.



[1203]

[1204] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.32 (t,  $J = 5.5$  Hz, 1H), 8.09 – 8.07 (m, 1H), 7.81 – 7.74 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.30 (m, 2H), 6.59 (dd,  $J = 3.4, 0.8$  Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.38 – 3.31 (m, 2H), 3.28 – 3.23 (m, 2H), 3.21 (s, 3H).

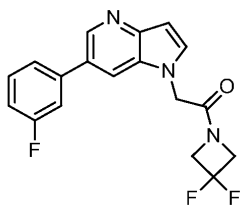
[1205] 실시예 255: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1206]

[1207] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}F_6N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.82 (s, 1H), 8.63 (s, 1H), 8.04 – 7.98 (m, 2H), 7.92 (t,  $J = 6.8$  Hz, 1H), 7.62 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 6.85 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 4.76 (t,  $J = 12.3$  Hz, 2H), 4.38 (t,  $J = 12.5$  Hz, 2H).

[1208] 실시예 256: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



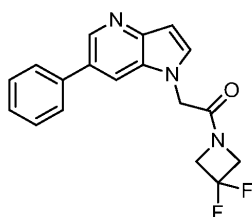
[1209]

[1210]

표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.01 – 8.93 (m, 2H), 8.09 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.68 – 7.57 (m, 3H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 6.94 (dd,  $J$  = 3.3, 1.0 Hz, 1H), 5.38 (s, 2H), 4.84 – 4.77 (m, 2H), 4.50 – 4.39 (m, 2H).

[1211]

실시예 257: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



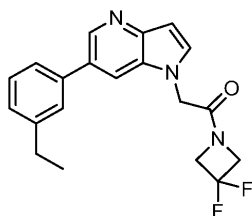
[1212]

[1213]

표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.97 (s, 1H), 8.91 (s, 1H), 8.07 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.85 – 7.79 (m, 2H), 7.62 – 7.55 (m, 2H), 7.54 – 7.49 (m, 1H), 6.94 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.38 (s, 2H), 4.81 (t,  $J$  = 11.9 Hz, 2H), 4.45 (t,  $J$  = 12.1 Hz, 2H).

[1214]

실시예 258: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



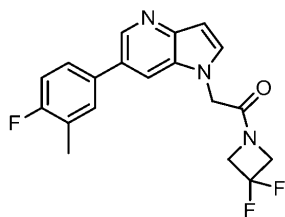
[1215]

[1216]

표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.96 – 8.94 (m, 1H), 8.90 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 8.06 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.67 – 7.65 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.49 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.39 – 7.35 (m, 1H), 6.93 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 4.81 (t,  $J$  = 12.0 Hz, 2H), 4.45 (t,  $J$  = 12.1 Hz, 2H), 2.78 (q,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 1.32 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

[1217]

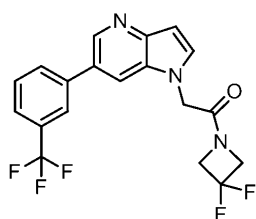
실시예 259: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1218]

[1219] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.99 (s, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.06 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 7.3, 2.4 Hz, 1H), 7.73 – 7.67 (m, 1H), 7.41 – 7.34 (m, 1H), 6.87 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 4.79 (t,  $J$  = 12.4 Hz, 2H), 4.39 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 2.36 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H).

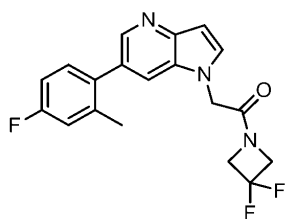
[1220] 실시예 260: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1221]

[1222] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.97 (s, 2H), 8.15 (s, 1H), 8.10 – 8.09 (m, 1H), 8.08 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.85 – 7.76 (m, 2H), 6.94 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.38 (s, 2H), 4.80 (t,  $J$  = 11.8 Hz, 2H), 4.45 (t,  $J$  = 12.1 Hz, 2H).

[1223] 실시예 261: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.

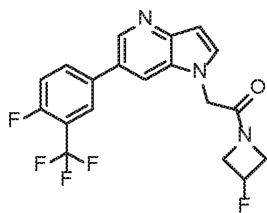


[1224]

[1225] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.68 – 8.65 (m, 1H), 8.63 – 8.60 (m, 1H), 8.09 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.39 (dd,  $J$  = 8.5, 5.8 Hz, 1H), 7.17 (dd,  $J$  = 9.8, 2.7 Hz, 1H), 7.13 – 7.07 (m, 1H), 6.96 (dd,  $J$  = 3.4, 1.0 Hz, 1H), 5.33 (s, 2H), 4.77 (t,  $J$  = 11.9 Hz, 2H), 4.42 (t,  $J$  = 12.1 Hz, 2H), 2.31 (s, 3H).

[1226] 실시예 262: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.





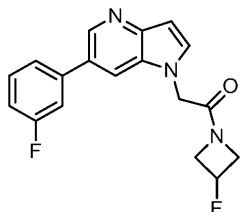
[1227]

[1228]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ , 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.93$  min.

[1229]

실시예 263: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



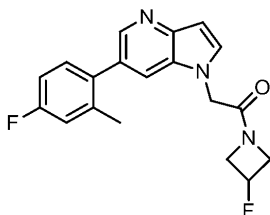
[1230]

[1231]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (4-플루오로-2-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.96 – 8.91 (m, 2H), 8.08 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.69 – 7.56 (m, 3H), 7.29 – 7.21 (m, 1H), 6.93 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.57 – 5.37 (m, 1H), 5.32 (d,  $J = 3.5$  Hz, 2H), 4.78 – 4.64 (m, 1H), 4.56 – 4.44 (m, 1H), 4.44 – 4.32 (m, 1H), 4.20 – 4.07 (m, 1H).

[1232]

실시예 264: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



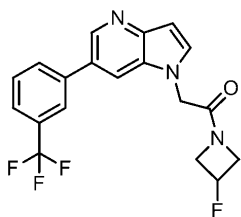
[1233]

[1234]

표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (4-플루오로-2-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.65 (t,  $J = 1.2$  Hz, 1H), 8.61 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 8.09 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.39 (dd,  $J = 8.5, 5.7$  Hz, 1H), 7.17 (dd,  $J = 9.8, 2.7$  Hz, 1H), 7.13 – 7.06 (m, 1H), 6.95 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.54 – 5.34 (m, 1H), 5.28 (d,  $J = 4.2$  Hz, 2H), 4.74 – 4.62 (m, 1H), 4.53 – 4.41 (m, 1H), 4.41 – 4.30 (m, 1H), 4.17 – 4.05 (m, 1H), 2.32 (s, 3H).

[1235]

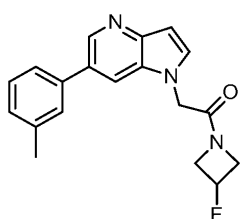
실시예 265: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1236]

[1237] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.04 (s, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.21 – 8.12 (m, 2H), 8.03 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.88 – 7.79 (m, 2H), 6.85 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.58 – 5.41 (m, 1H), 5.27 (s, 2H), 4.67 – 4.56 (m, 1H), 4.43 – 4.32 (m, 1H), 4.31 – 4.21 (m, 1H), 4.04 – 3.93 (m, 1H).

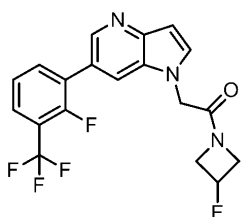
[1238] 실시예 266: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1239]

[1240] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 m-톨릴보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.00 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.93 – 8.91 (m, 1H), 8.08 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.67 – 7.63 (m, 1H), 7.51 – 7.44 (m, 1H), 7.35 – 7.28 (m, 1H), 6.89 – 6.86 (m, 1H), 5.61 – 5.40 (m, 1H), 5.30 (s, 2H), 4.70 – 4.56 (m, 1H), 4.46 – 4.33 (m, 1H), 4.32 – 4.20 (m, 1H), 4.07 – 3.92 (m, 1H), 2.44 (s, 3H).

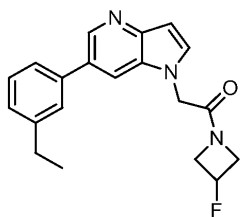
[1241] 실시예 267: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1242]

[1243] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;  $m/z$  실측치, 396.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (s, 1H), 8.54 (s, 1H), 8.04 – 7.97 (m, 1H), 7.95 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.61 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 6.81 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.59 – 5.37 (m, 1H), 5.20 (d,  $J = 2.6$  Hz, 2H), 4.66 – 4.52 (m, 1H), 4.42 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.18 (m, 1H), 4.03 – 3.91 (m, 1H).

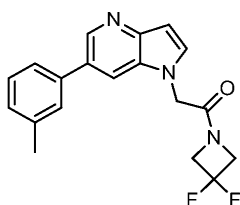
[1244] 실시예 268: 2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온. 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1245]

[1246] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 (3-에틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;  $m/z$  실측치, 338.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.96 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.80 (s, 1H), 8.02 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.72 – 7.61 (m, 2H), 7.49 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.34 (d,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 6.84 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 5.61 – 5.39 (m, 1H), 5.27 (d,  $J = 1.9$  Hz, 2H), 4.68 – 4.54 (m, 1H), 4.47 – 4.32 (m, 1H), 4.33 – 4.20 (m, 1H), 4.04 – 3.91 (m, 1H), 2.73 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.27 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

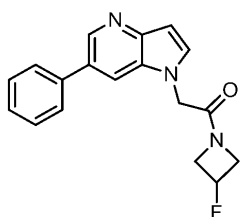
[1247] 실시예 269: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1248]

[1249] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 12) 및 *m*-톨릴보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.88$  min.

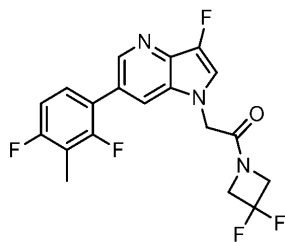
[1250] 실시예 270: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[1251]

[1252] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 13) 및 페닐 보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$  실측치, 310.1  $[M+H]^+$ .

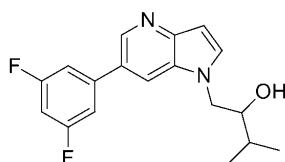
[1253] 실시예 271: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1254]

[1255] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 16) 및 (2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.52 – 8.47 (m, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.50 – 7.42 (m, 1H), 7.27 – 7.18 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.72 (t,  $J$  = 12.3 Hz, 2H), 4.42 – 4.30 (m, 2H), 2.25 (s, 3H).

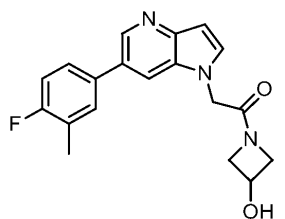
[1256] 실시예 272: (R/S)-1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-올.



[1257]

[1258] 0℃로 냉각된 THF (2.5 mL)와 MeOH (2.5 mL)의 혼합물 중의 화합물 1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온 (실시예 364, 60 mg, 0.19 mmol)의 용액에,  $NaBH_4$  (14 mg, 0.38 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 0℃에서 30분간 교반하였다. 휘발성 물질을 증발시켜, 잔류물을 EtOAc 및 물에 용해시켰다. 수상을 EtOAc로 2회 추출하였다. 합한 유기층을 수세하여, 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (39 mg, 64%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 316.1;  $m/z$  실측치, 317.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ , 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50℃)에서의 1.6 분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 0.93 min.

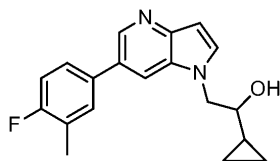
[1259] 실시예 273: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온.



[1260]

[1261] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.70 (dd,  $J$  = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 7.42 – 7.38 (m, 1H), 7.39 – 7.34 (m, 1H), 7.28 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.08 (t,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 6.70 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.76 (s, 2H), 4.59 – 4.53 (m, 1H), 4.28 – 4.20 (m, 1H), 3.94 – 3.85 (m, 2H), 3.69 – 3.64 (m, 1H), 2.35 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.16 (br. s, 1H).

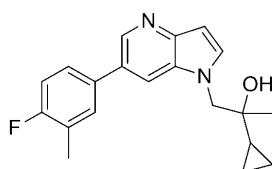
[1262] 실시예 274: (R/S)-1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올.



[1263]

[1264] 표제 화합물을 실시예 272와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.13 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.71 – 7.65 (m, 2H), 7.62 – 7.55 (m, 1H), 7.29 – 7.22 (m, 1H), 6.55 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 4.92 (d,  $J$  = 5.0 Hz, 1H), 4.33 (dd,  $J$  = 14.2, 4.3 Hz, 1H), 4.24 (dd,  $J$  = 14.3, 7.1 Hz, 1H), 3.29 – 3.24 (m, 1H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 0.84 – 0.75 (m, 1H), 0.37 – 0.22 (m, 3H), 0.18 – 0.11 (m, 1H).

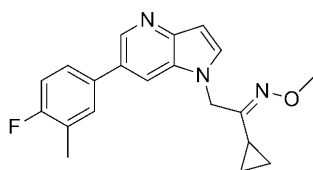
[1265] 실시예 275: (R/S)-2-사이클로프로필-1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]프로판-2-올 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1266]

[1267] 0℃로 냉각된 THF (4 mL) 중의 화합물 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올 (실시예 186, 35 mg, 0.11 mmol)의 용액에,  $Et_2O$  중의 3M  $CH_3MgBr$  용액 (114  $\mu L$ , 0.34 mmol)을 서서히 첨가하였다. 반응 혼합물을 0℃에서 3시간 동안 교반하여, 물을 첨가하였다. 수상을  $EtOAc$ 로 2회 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. HPLC 방법 C로 정제하여, 표제 화합물 (4 mg, 8%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 324.2; m/z 실측치, 325.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.90 (s, 2H), 8.08 – 8.02 (m, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 1H), 7.73 – 7.66 (m, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 6.79 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 4.44 (s, 2H), 2.35 (s, 3H), 1.09 (s, 3H), 0.94 – 0.84 (m, 1H), 0.29 – 0.14 (m, 2H), 0.06 – -0.09 (m, 2H).

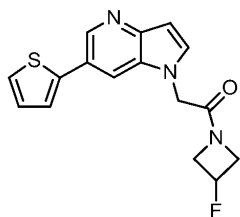
[1268] 실시예 276: 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메톡시-에탄아민.



[1269]

[1270]  $EtOH$  (5.7 mL) 중의 화합물 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올 (실시예 186, 35 mg, 0.11 mmol)의 용액에, O-메틸하이드록실아민 하이드로클로라이드 (19 mg, 0.23 mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 10분간 교반하고,  $NaHCO_3$  (19 mg, 0.23 mmol)를 첨가하였다. 2시간 후에, 물을 첨가하여, 수상을  $EtOAc$ 로 추출하였다. 그 다음에 유기상을  $MgSO_4$ 로 건조시키고, 여과하여, 증발시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , hexan 중의 0 내지 100%  $EtOAc$ )에 의해, 표제 화합물 (6 mg, 15%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.15 – 8.11 (m, 1H), 7.73 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.71 – 7.68 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.30 – 7.22 (m, 1H), 6.65 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.84 (s, 3H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 0.88 – 0.83 (m, 1H), 0.56 – 0.50 (m, 2H), 0.40 – 0.34 (m, 2H).

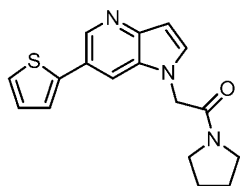
[1271] 실시예 277: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1272]

[1273] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 315.1;  $m/z$  실측치, 316.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.58 – 7.53 (m, 2H), 7.18 (dd,  $J = 5.1, 3.7$  Hz, 1H), 6.60 (dd,  $J = 3.2, 1.0$  Hz, 1H), 5.57 – 5.36 (m, 1H), 5.06 (d,  $J = 2.5$  Hz, 2H), 4.61 – 4.49 (m, 1H), 4.37 – 4.20 (m, 2H), 4.04 – 3.91 (m, 1H).

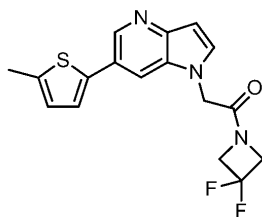
[1274] 실시예 278: 1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1275]

[1276] 표제 화합물을 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 311.1;  $m/z$  실측치, 312.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 – 8.06 (m, 1H), 7.54 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.47 (dd,  $J = 3.6, 1.2$  Hz, 1H), 7.42 (dd,  $J = 5.1, 1.2$  Hz, 1H), 7.13 (dd,  $J = 5.1, 3.6$  Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.66 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.47 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.13 – 2.04 (m, 2H), 1.98 – 1.89 (m, 2H).

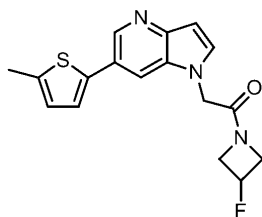
[1277] 실시예 279: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1278]

[1279] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;  $m/z$  실측치, 348.0  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ , 50  $\times$  3 mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.87$  min.

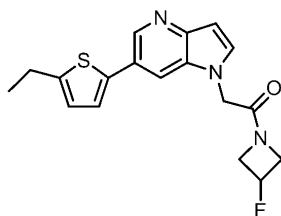
[1280] 실시예 280: 1-(3-플루오로아세트딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1281]

[1282] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 329.1;  $m/z$  실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.01 – 7.97 (m, 1H), 7.52 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.25 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.82 – 6.77 (m, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.49 – 5.28 (m, 1H), 5.04 (d,  $J = 2.0$  Hz, 2H), 4.58 – 4.46 (m, 1H), 4.42 – 4.26 (m, 2H), 4.17 – 4.03 (m, 1H), 2.52 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H).

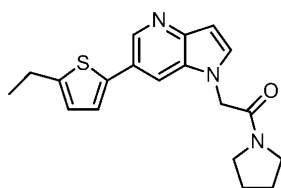
[1283] 실시예 281: 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아세트딘-1-일)에탄온.



[1284]

[1285] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 5-에틸티오펜-2-보론산을 사용하여, 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.01 – 7.99 (m, 1H), 7.52 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.27 (d,  $J = 3.7$  Hz, 1H), 6.83 (dd,  $J = 3.7, 1.0$  Hz, 1H), 6.66 – 6.62 (m, 1H), 5.48 – 5.28 (m, 1H), 5.04 (d,  $J = 1.8$  Hz, 2H), 4.59 – 4.45 (m, 1H), 4.41 – 4.26 (m, 2H), 4.11 (dd,  $J = 24.7, 11.6$  Hz, 1H), 2.89 (q,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 1.38 – 1.31 (m, 3H).

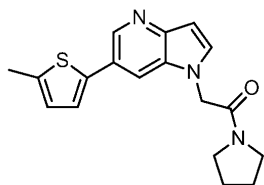
[1286] 실시예 282: 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1287]

[1288] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 5-에틸티오펜-2-보론산을 사용하여, 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.01 – 7.99 (m, 1H), 7.52 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.26 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.85 – 6.81 (m, 1H), 6.63 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.66 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 3.47 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.93 – 2.84 (m, 2H), 2.13 – 2.03 (m, 2H), 1.97 – 1.89 (m, 2H), 1.34 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

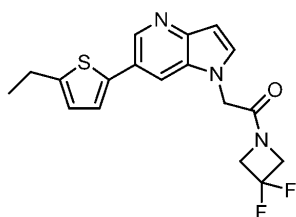
[1289] 실시예 283: 2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1290]

[1291] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다.  $^1\text{H}$  NMR (400 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.00 – 7.97 (m, 1H), 7.51 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.24 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.81 – 6.77 (m, 1H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.15 (s, 2H), 3.66 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.47 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.51 (s, 3H), 2.12 – 2.03 (m, 2H), 1.99 – 1.89 (m, 2H).

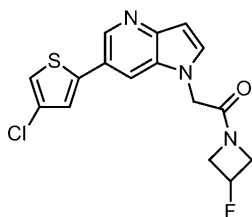
[1292] 실시예 284: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1293]

[1294] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{18}\text{H}_{17}\text{F}_2\text{N}_3\text{OS}$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;  $m/z$  실측치, 362.0  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.02 – 7.99 (m, 1H), 7.56 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.35 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.89 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.72 (t,  $J = 11.5$  Hz, 2H), 4.42 – 4.34 (m, 2H), 2.89 – 2.81 (m, 2H), 1.28 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

[1295] 실시예 285: 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

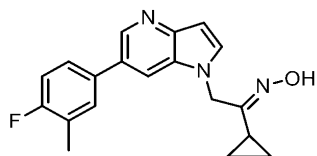


[1296]

[1297] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{ClFN}_3\text{OS}$ 에 대한 질량 계산치, 349.0;  $m/z$  실측치, 350.0  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 MHz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.12 – 8.10 (m, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.42 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 7.31 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.49 – 5.32 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.2$  Hz, 2H), 4.62 – 4.52 (m, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 2H), 4.16 – 4.05 (m, 1H).

[1298] 실시예 286: 1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 옥심 트라이플루오로아세테이트 염.



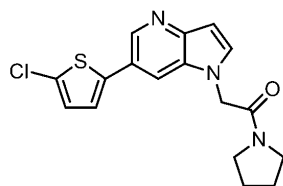


[1299]

[1300] 표제 화합물을 0-메틸하이드록실아민 하이드로클로라이드 대신에 하이드록실아민 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 276과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.89 – 8.85 (m, 2H), 8.17 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.71 – 7.67 (m, 1H), 7.65 – 7.58 (m, 1H), 7.29 – 7.18 (m, 1H), 6.91 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.43 (s, 2H), 2.39 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 3H), 1.23 – 1.14 (m, 1H), 0.60 – 0.47 (m, 4H).

[1301]

실시예 287: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

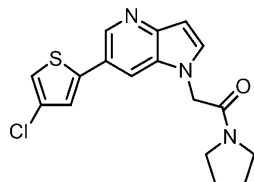


[1302]

[1303] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 5-클로로티오펜-2-보론산을 사용하여, 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.04 – 8.00 (m, 1H), 7.56 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.28 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 7.01 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 6.65 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.66 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.47 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.13 – 2.03 (m, 2H), 1.98 – 1.88 (m, 2H).

[1304]

실시예 288: 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

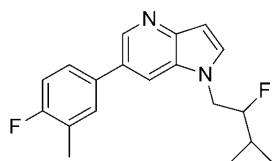


[1305]

[1306] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.58 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.30 (s, 1H), 6.66 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.67 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.47 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.13 – 2.04 (m, 2H), 1.98 – 1.89 (m, 2H).

[1307]

실시예 289: (R/S)-1-(2-사이클로프로필-2-플루오로-에틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘.

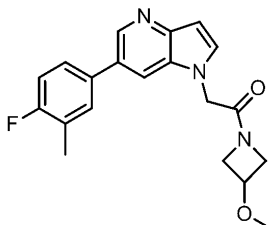


[1308]

[1309] 0°C로 냉각된 DCM (1 mL) 중의 화합물 (R/S)-1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올 (실시예 274, 14 mg, 0.05 mmol)의 용액에, DAST (29  $\mu$ L, 0.22 mmol)를 첨가하였다. 반응

혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분 후에 포화  $\text{NaHCO}_3$  수용액을 첨가하였다. 유기상을 분리하여,  $\text{MgSO}_4$ 로 건조시키고, 여과하여, 증발시켜, 표제 화합물 (6.5 mg, 47%)을 얻었다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{F}_2\text{N}_2$ 에 대한 질량 계산치, 312.1; m/z 실측치, 313.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (500 Mhz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.19 – 8.15 (m, 1H), 7.72 – 7.66 (m, 2H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.2, 0.8$  Hz, 1H), 4.66 – 4.56 (m, 2H), 4.32 – 4.15 (m, 1H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H), 1.05 – 0.96 (m, 1H), 0.57 – 0.48 (m, 2H), 0.45 – 0.34 (m, 2H).

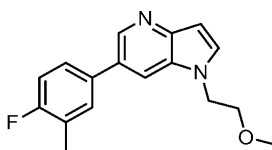
[1310] 실시예 290: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온.



[1311]

[1312] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{FN}_3\text{O}_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.2; m/z 실측치, 354.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 Mhz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.64 – 8.60 (m, 1H), 8.07 (s, 1H), 7.66 (dd,  $J = 7.7, 2.4$  Hz, 1H), 7.61 – 7.54 (m, 2H), 7.26 (t,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 6.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.41 – 4.35 (m, 1H), 4.31 – 4.22 (m, 1H), 4.13 – 4.00 (m, 2H), 3.75 – 3.68 (m, 1H), 3.23 (s, 3H), 2.33 (s, 3H).

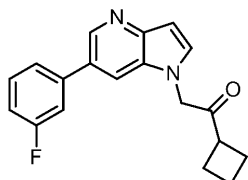
[1313] 실시예 291: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-메톡시에틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세트이트 염.



[1314]

[1315] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 1-브로모-2-메톡시에탄을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{17}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 284.1; m/z 실측치, 285.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 Mhz,  $\text{DMSO}-d_6$ )  $\delta$  8.88 (s, 1H), 8.76 (s, 1H), 8.04 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.81 (dd,  $J = 7.6, 2.4$  Hz, 1H), 7.74 – 7.68 (m, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 1H), 6.76 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 4.58 (t,  $J = 5.1$  Hz, 2H), 3.71 (t,  $J = 5.1$  Hz, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.35 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

[1316] 실시예 292: 1-사이클로부틸-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

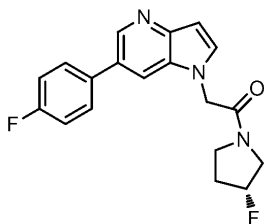


[1317]

[1318] 표제 화합물을 6-(3-플루오로-페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-1-사이클로부틸에탄온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{FN}_2\text{O}$ 에 대한 질량 계산치, 308.1; m/z 실측치, 309.1  $[\text{M}+\text{H}]^+$ .  $^1\text{H}$  NMR (400 Mhz,  $\text{CD}_3\text{OD}$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.58 – 7.42 (m, 4H), 7.15 – 7.08 (m, 1H), 6.69 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.58 – 3.45 (m, 1H), 2.38 – 2.25 (m, 2H), 2.24 – 2.13 (m, 2H), 2.10 – 1.97 (m, 1H), 1.92 – 1.80 (m, 1H).

[1319] 실시예 293: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이

플루오로아세테이트 염.



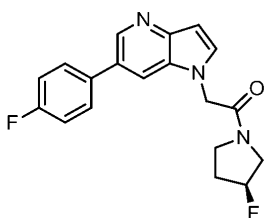
[1320]

[1321]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 엑스브리지 C18 컬럼 ( $4.6 \times 100$  mm,  $5 \mu m$ ), 1 mL/min의 유량 (온도 =  $45^\circ C$ )에서의 8분간에 걸친 20 mM  $NH_4OH$  중의 10 내지 100% ACN, 그 다음에 100% ACN에서 3분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 5.62$  min.

[1322]

실시예 294: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3S)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



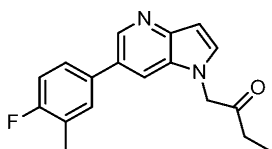
[1323]

[1324]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 엑스브리지 C18 컬럼 ( $4.6 \times 100$  mm,  $5 \mu m$ ), 1 mL/min의 유량 (온도 =  $45^\circ C$ )에서의 8분간에 걸친 20 mM  $NH_4OH$  중의 10 내지 100% ACN, 그 다음에 100% ACN에서 3분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 5.63$  min.

[1325]

실시예 295: 1-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염.



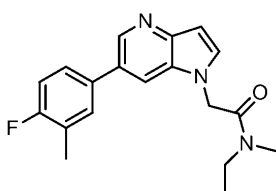
[1326]

[1327]

표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 1-브로모부탄-2-온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 296.1;  $m/z$  실측치, 297.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.86 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.81 (s, 1H), 8.00 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.72 – 7.67 (m, 1H), 7.65 – 7.59 (m, 1H), 7.26 – 7.20 (m, 1H), 6.91 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 2.72 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 2.39 (d,  $J = 2.1$  Hz, 3H), 1.13 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

[1328]

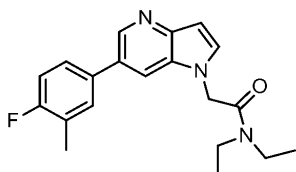
실시예 296: N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[1329]

[1330] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2;  $m/z$  실측치, 326.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 엑스브리지 C18 컬럼 ( $4.6 \times 100$  mm, 5  $\mu$ m), 1 mL/min의 유량 (온도 = 45°C)에서의 8분간에 걸친 20 mM  $NH_4OH$  중의 10 내지 100% ACN, 그 다음에 100% ACN에서 3분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 6.12 min.

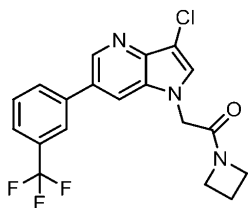
[1331] 실시예 297: N,N-다이에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1332]

[1333] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.2;  $m/z$  실측치, 340.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.02 – 8.00 (m, 1H), 7.65 (dd,  $J$  = 7.6, 2.4 Hz, 1H), 7.60 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.58 – 7.53 (m, 1H), 7.28 – 7.23 (m, 1H), 6.57 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.47 (q,  $J$  = 7.1 Hz, 2H), 3.30 – 3.26 (m, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 1.24 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 3H), 1.03 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 3H).

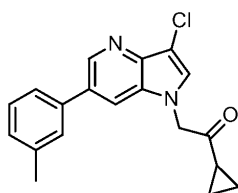
[1334] 실시예 298: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1335]

[1336] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 393.1;  $m/z$  실측치, 394.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.80 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.34 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.12 – 8.06 (m, 2H), 7.83 (s, 1H), 7.79 – 7.75 (m, 2H), 5.04 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.34 – 2.24 (m, 2H).

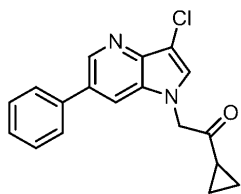
[1337] 실시예 299: 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온.



[1338]

[1339] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 324.1;  $m/z$  실측치, 325.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.19 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 7.39 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.16 – 2.09 (m, 1H), 1.04 – 0.98 (m, 2H), 0.97 – 0.92 (m, 2H).

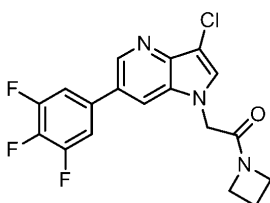
[1340] 실시예 300: 2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-사이클로프로필-에탄온.



[1341]

[1342] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.74 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.22 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.78 – 7.73 (m, 2H), 7.55 – 7.47 (m, 2H), 7.45 – 7.37 (m, 1H), 5.50 (s, 2H), 2.18 – 2.09 (m, 1H), 1.04 – 0.97 (m, 2H), 0.97 – 0.92 (m, 2H).

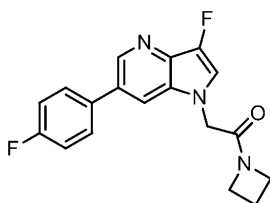
[1343] 실시예 301: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1344]

[1345] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.80 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.87 – 7.79 (m, 3H), 5.01 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.33 – 2.24 (m, 2H).

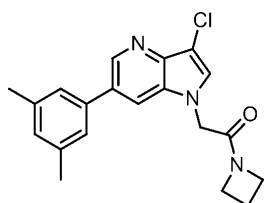
[1346] 실시예 302: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1347]

[1348] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.18 – 8.16 (m, 1H), 7.83 – 7.77 (m, 2H), 7.65 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.39 – 7.33 (m, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H).

[1349] 실시예 303: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

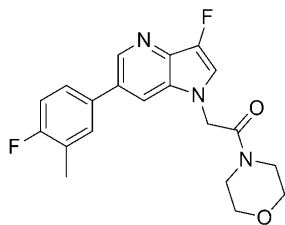


[1350]

[1351] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1;

$m/z$  실측치, 354.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.05 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.29 (s, 2H), 7.04 (s, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.30 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 4.09 – 4.01 (m, 2H), 2.44 – 2.31 (m, 8H).

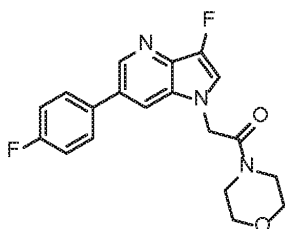
[1352] 실시예 304: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[1353]

[1354] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 19) 및 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 371.1;  $m/z$  실측치, 372.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.69 – 7.66 (m, 1H), 7.63 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.61 – 7.55 (m, 1H), 7.31 – 7.24 (m, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.72 – 3.67 (m, 2H), 3.62 – 3.53 (m, 4H), 3.45 – 3.40 (m, 2H), 2.33 (s, 3H).

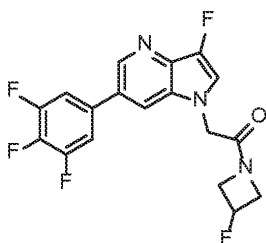
[1355] 실시예 305: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.



[1356]

[1357] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노에탄온 (중간체 19) 및 (4-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 357.1;  $m/z$  실측치, 358.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.19 – 8.16 (m, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 2H), 7.63 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 2H), 5.24 (s, 2H), 3.72 – 3.67 (m, 2H), 3.61 – 3.53 (m, 4H), 3.45 – 3.41 (m, 2H).

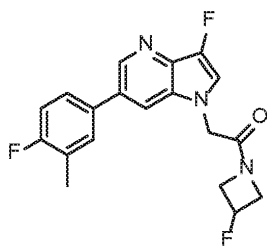
[1358] 실시예 306: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1359]

[1360] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 381.1;  $m/z$  실측치, 382.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.64 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.25 – 7.20 (m, 3H), 5.40 – 5.19 (m, 1H), 4.73 (s, 2H), 4.42 – 4.29 (m, 1H), 4.27 – 4.03 (m, 3H).

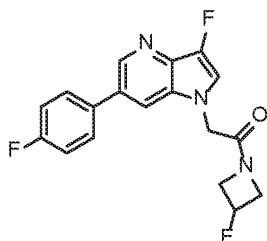
[1361] 실시예 307: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1362]

[1363] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.15 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.68 (dd,  $J$  = 7.5, 2.4 Hz, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.62 – 7.56 (m, 1H), 7.31 – 7.25 (m, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.01 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 2H), 4.60 – 4.49 (m, 1H), 4.38 – 4.18 (m, 2H), 4.03 – 3.91 (m, 1H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H).

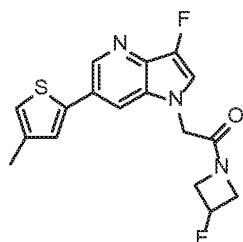
[1364] 실시예 308: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1365]

[1366] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 (4-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.17 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.82 – 7.77 (m, 2H), 7.65 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 2H), 5.54 – 5.38 (m, 1H), 5.01 (d,  $J$  = 3.1 Hz, 2H), 4.60 – 4.50 (m, 1H), 4.37 – 4.19 (m, 2H), 4.02 – 3.91 (m, 1H).

[1367] 실시예 309: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

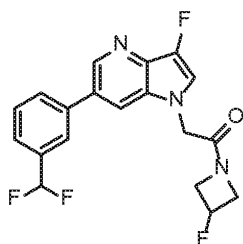


[1368]

[1369] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.66 (s, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.17 (s, 1H), 5.58 – 5.37 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.63 – 4.50 (m, 1H), 4.40 – 4.18 (m, 2H), 4.04 – 3.90 (m, 1H), 2.26 (s, 3H).

[1370] 실시예 310: 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-

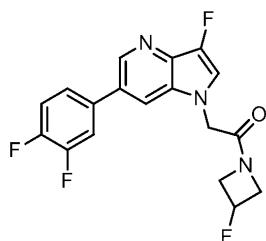
1-일)에탄온.



[1371]

[1372] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 (3-(다이플루오로메틸)페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.25 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.96 – 7.91 (m, 2H), 7.72 – 7.57 (m, 3H), 7.12 (t,  $J = 55.8$  Hz, 1H), 5.58 – 5.36 (m, 1H), 5.04 (s, 2H), 4.62 – 4.49 (m, 1H), 4.39 – 4.18 (m, 2H), 4.04 – 3.87 (m, 1H).

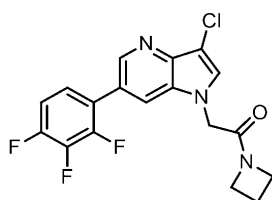
[1373] 실시예 311: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1374]

[1375] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 17) 및 (3,4-다이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1;  $m/z$  실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.24 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.92 – 7.85 (m, 1H), 7.68 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.65 – 7.54 (m, 2H), 5.57 – 5.36 (m, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.62 – 4.48 (m, 1H), 4.39 – 4.19 (m, 2H), 4.03 – 3.90 (m, 1H).

[1376] 실시예 312: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

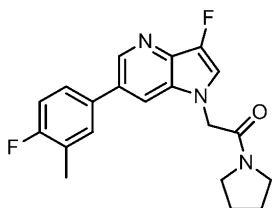


[1377]

[1378] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1;  $m/z$  실측치, 379.9  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (s, 1H), 8.08 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.46 – 7.35 (m, 1H), 7.33 – 7.22 (m, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.33 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 4.06 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.47 – 2.31 (m, 2H).



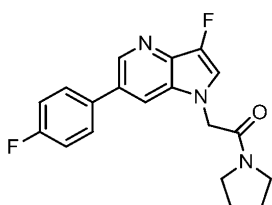
[1379] 실시예 313: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1380]

[1381] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 18) 및 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.09 – 8.04 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.54 – 7.48 (m, 1H), 7.46 (d,  $J$  = 2.4 Hz, 1H), 7.14 (t,  $J$  = 9.0 Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.65 (t,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 3.51 – 3.42 (m, 2H), 2.35 (s, 3H), 2.13 – 2.02 (m, 2H), 1.98 – 1.87 (m, 2H).

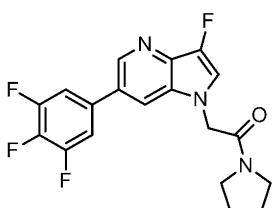
[1382] 실시예 314: 2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1383]

[1384] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 18) 및 (4-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 엑스브리지 C18 컬럼 ( $4.6 \times 100$  mm, 5  $\mu$ m), 1 mL/min의 유량 (온도 = 45°C)에서의 8분간에 걸친 20 mM  $NH_4OH$  중의 10 내지 100% ACN, 그 다음에 100% ACN에서 3분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t$  = 5.92 min.

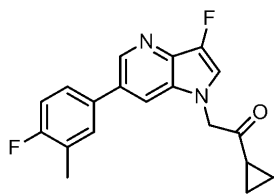
[1385] 실시예 315: 2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1386]

[1387] 표제 화합물을 2-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(피롤리딘-1-일)에탄온 (중간체 18) 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.59 – 7.49 (m, 3H), 5.14 (s, 2H), 3.65 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.45 (t,  $J$  = 6.9 Hz, 2H), 2.13 – 2.02 (m, 2H), 1.92 (p,  $J$  = 6.9 Hz, 2H).

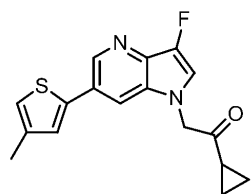
[1388] 실시예 316: 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1389]

[1390] 표제 화합물을 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 326.1; m/z 실측치, 327.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.69 – 7.66 (m, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.60 – 7.56 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.12 – 2.07 (m, 1H), 1.01 – 0.97 (m, 2H), 0.95 – 0.91 (m, 2H).

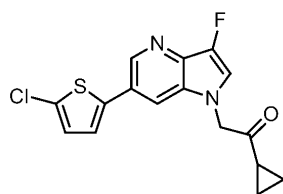
[1391] 실시예 317: 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1392]

[1393] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}FN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 314.1; m/z 실측치, 315.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.16 (s, 1H), 5.41 (s, 2H), 2.26 (s, 3H), 2.16 – 2.06 (m, 1H), 1.09 – 0.90 (m, 4H).

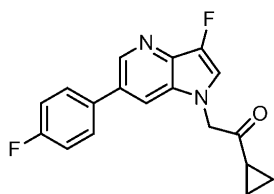
[1394] 실시예 318: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온.



[1395]

[1396] 표제 화합물을 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{12}ClFN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 334.0; m/z 실측치, 335.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.47 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 7.21 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 5.41 (s, 2H), 2.15 – 2.06 (m, 1H), 1.04 – 0.97 (m, 2H), 0.97 – 0.90 (m, 2H).

[1397] 실시예 319: 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

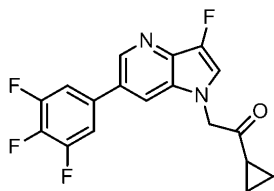


[1398]

[1399] 표제 화합물을 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 312.1;

m/z 실측치, 313.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.59 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 7.99 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 7.73 – 7.67 (m, 2H), 7.46 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.27 – 7.19 (m, 2H), 5.35 (s, 2H), 2.16 – 2.08 (m, 1H), 1.08 – 1.02 (m, 4H).

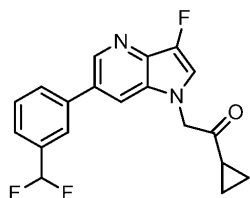
[1400] 실시예 320: 1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1401]

[1402] 표제 화합물을 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>12</sub>F<sub>4</sub>N<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 348.1; m/z 실측치, 349.0 [M+H]<sup>+</sup>.

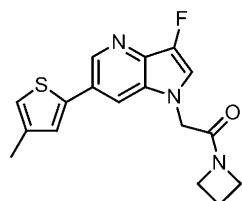
[1403] 실시예 321: 1-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1404]

[1405] 표제 화합물을 실시예 136과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>15</sub>F<sub>3</sub>N<sub>2</sub>O에 대한 질량 계산치, 344.1; m/z 실측치, 345.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.65 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.08 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 7.87 – 7.83 (m, 2H), 7.65 – 7.56 (m, 2H), 7.49 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 6.86 (t, J = 56.2 Hz, 1H), 5.38 (s, 2H), 2.16 – 2.10 (m, 1H), 1.08 – 1.02 (m, 4H).

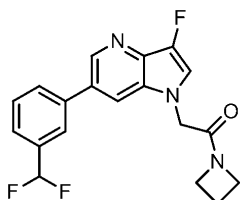
[1406] 실시예 322: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1407]

[1408] 표제 화합물을 (5-클로로티오펜-2-일)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>17</sub>H<sub>16</sub>FN<sub>3</sub>OS에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.61 (d, J = 1.8 Hz, 1H), 8.03 (t, J = 2.1 Hz, 1H), 7.44 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.32 (d, J = 1.3 Hz, 1H), 7.02 (t, J = 1.2 Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 4.32 – 4.28 (m, 2H), 4.07 (t, J = 7.8 Hz, 2H), 2.42 – 2.34 (m, 2H), 2.30 (d, J = 1.1 Hz, 3H).

[1409] 실시예 323: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



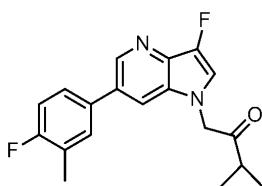
[1410]

[1411]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.15 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.90 – 7.85 (m, 2H), 7.66 – 7.57 (m, 2H), 7.51 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 6.87 (t,  $J = 56.2$  Hz, 1H), 4.97 (s, 2H), 4.31 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.43 – 2.34 (m, 2H).

[1412]

실시예 324: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1413]

[1414]

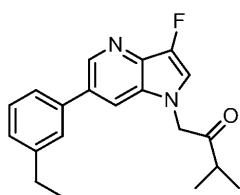
단계 A: 1-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-3-메틸부탄-2-온. 표제 화합물을 6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 6) 및 1-브로모-3-메틸부탄-2-온을 사용하여, 중간체 15와 유사한 방법으로 제조하였다.

[1415]

단계 B: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온. 표제 화합물을 1-(6-브로모-3-플루오로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-3-메틸부탄-2-온 및 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 328.1; m/z 실측치, 329.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.92 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.57 – 7.52 (m, 1H), 7.50 – 7.45 (m, 1H), 7.41 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.14 (dd,  $J = 9.6, 8.4$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 2.90 – 2.82 (m, 1H), 2.35 (d,  $J = 2.0$  Hz, 3H), 1.20 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

[1416]

실시예 325: 1-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.

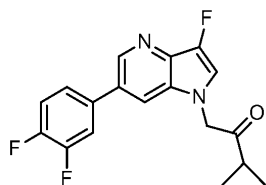


[1417]

[1418]

표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 324.2; m/z 실측치, 325.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.96 – 7.92 (m, 1H), 7.51 – 7.48 (m, 1H), 7.48 – 7.44 (m, 1H), 7.41 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 7.39 – 7.35 (m, 1H), 7.26 – 7.22 (m, 1H), 5.28 (s, 2H), 2.92 – 2.81 (m, 1H), 2.73 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.29 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H), 1.20 (d,  $J = 7.2$  Hz, 6H).

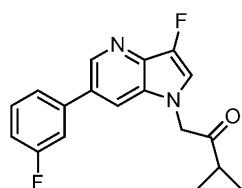
[1419] 실시예 326: 1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1420]

[1421] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실측치, 333.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.99 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.67 – 7.59 (m, 1H), 7.52 – 7.47 (m, 1H), 7.45 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.43 – 7.33 (m, 1H), 5.29 (s, 2H), 2.92 – 2.83 (m, 1H), 1.21 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

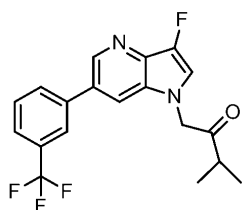
[1422] 실시예 327: 1-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1423]

[1424] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 314.1; m/z 실측치, 315.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.54 – 7.47 (m, 2H), 7.48 – 7.40 (m, 2H), 7.18 – 7.08 (m, 1H), 5.29 (s, 2H), 2.93 – 2.81 (m, 1H), 1.21 (d,  $J = 7.0$  Hz, 6H).

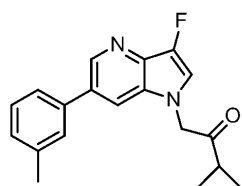
[1425] 실시예 328: 1-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1426]

[1427] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_4N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 364.1; m/z 실측치, 365.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.09 – 8.05 (m, 1H), 8.01 – 7.93 (m, 2H), 7.73 – 7.68 (m, 2H), 7.47 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 2.93 – 2.82 (m, 1H), 1.21 (d,  $J = 6.8$  Hz, 6H).

[1428] 실시예 329: 1-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.

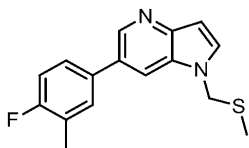


[1429]

[1430] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 310.1; m/z 실측치, 311.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.94 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.50 – 7.48 (m, 1H), 7.47 – 7.43 (m, 1H), 7.42 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.36 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H),

7.21 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 2.92 – 2.81 (m, 1H), 2.43 (s, 3H), 1.20 (d,  $J = 7.0$  Hz, 6H).

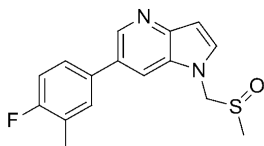
[1431] 실시예 330: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



[1432]

[1433] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 클로로메틸 메틸 설파이드를 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}FN_2S$ 에 대한 질량 계산치, 286.1;  $m/z$  실측치, 287.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.30 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.78 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.71 – 7.68 (m, 1H), 7.63 – 7.58 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.49 (s, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

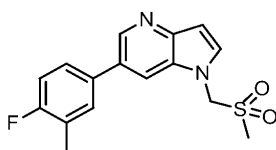
[1434] 실시예 331: (R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



[1435]

[1436] 0°C로 냉각된 DCM (3 mL) 중의 화합물 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 330, 155 mg, 0.54 mmol)의 용액에, HCl 4M (0.16 mL, 0.65 mmol)을 첨가하였다. 5분 후에, MCPBA (140 mg, 0.81 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 0°C에서 10분간 교반하였다. 포화  $NaHCO_3$  수용액을 혼합물에 첨가하여, 수상을 DCM으로 2회 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 ( $MgSO_4$ ), 여과하여, 증발시켰다. HPLC 방법 A로 정제하여, 화합물 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설폰닐메틸)피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 332) (14 mg, 8%)과 함께, 표제 화합물 (24 mg, 14%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}FN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 302.1;  $m/z$  실측치, 303.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.34 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.71 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.69 – 7.66 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.27 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.70 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.69 (d,  $J = 13.5$  Hz, 1H), 5.45 (d,  $J = 13.5$  Hz, 1H), 2.57 (s, 3H), 2.33 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H).

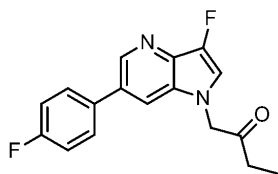
[1437] 실시예 332: 6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설폰닐메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



[1438]

[1439] 표제 화합물을 실시예 331에 기재된 바와 같이 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}FN_2O_2S$ 에 대한 질량 계산치, 318.1;  $m/z$  실측치, 319.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.39 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.75 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.69 (dd,  $J = 7.6, 2.4$  Hz, 1H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.31 – 7.25 (m, 1H), 6.75 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.91 (s, 2H), 2.95 (s, 3H), 2.33 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H).

[1440] 실시예 333: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



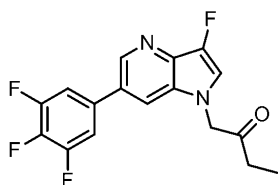
[1441]

[1442] 단계 A: 1-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)부탄-2-온. 표제 화합물을 6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘 (중간체 6) 및 1-브로모부탄-2-온을 사용하여, 중간체 15와 유사한 방법으로 제조하였다.

[1443] 단계 B: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온. 표제 화합물을 1-(6-브로모-3-플루오로-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)부탄-2-온 및 (4-플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 300.1; m/z 실측치, 301.0  $[M+H]^+$ .

$^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.16 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.61 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.38 – 7.30 (m, 2H), 5.22 (s, 2H), 2.60 – 2.53 (m, 2H), 0.98 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

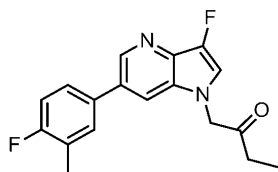
[1444] 실시예 334: 1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1445]

[1446] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{12}F_4N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 336.1; m/z 실측치, 337.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.28 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.84 – 7.77 (m, 2H), 7.68 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 5.22 (s, 2H), 2.56 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 0.99 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

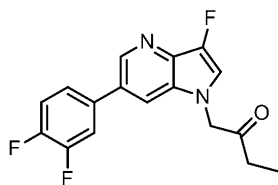
[1447] 실시예 335: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1448]

[1449] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 314.1; m/z 실측치, 315.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.16 – 8.13 (m, 1H), 7.67 (dd,  $J = 7.8, 2.1$  Hz, 1H), 7.63 – 7.54 (m, 2H), 7.27 (t,  $J = 9.1$  Hz, 1H), 5.22 (s, 2H), 2.55 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 0.98 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

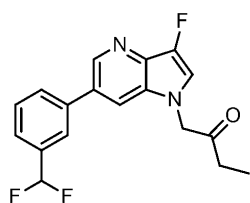
[1450] 실시예 336: 1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1451]

[1452] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{13}F_3N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 318.1; m/z 실측치, 319.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.22 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.90 – 7.84 (m, 1H), 7.64 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.63 – 7.60 (m, 1H), 7.60 – 7.53 (m, 1H), 5.22 (s, 2H), 2.56 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 0.98 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

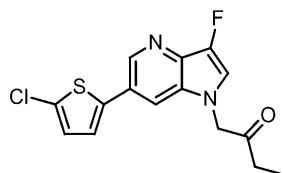
[1453] 실시예 337: 1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1454]

[1455] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_3N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 332.1; m/z 실측치, 333.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.09 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.88 – 7.82 (m, 2H), 7.65 – 7.55 (m, 2H), 7.46 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 6.85 (t,  $J = 56.2$  Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 2.62 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 1.09 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

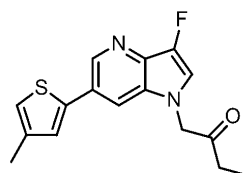
[1456] 실시예 338: 1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1457]

[1458] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{12}ClFN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 322.0; m/z 실측치, 323.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.98 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.43 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.30 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.02 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 2.61 (q,  $J = 7.3$  Hz, 2H), 1.10 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

[1459] 실시예 339: 1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



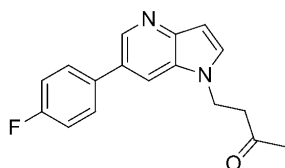
[1460]

[1461] 표제 화합물을 실시예 333과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}FN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 302.1; m/z 실측치, 303.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.97 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.40 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.31 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 7.03 – 6.99 (m, 1H), 5.15 (s, 2H), 2.61 (q,



$J = 7.3$  Hz, 2H), 2.29 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H), 1.09 (t,  $J = 7.3$  Hz, 3H).

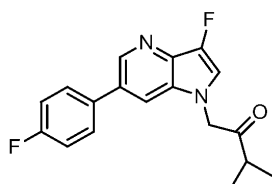
[1462] 실시예 340: 4-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온.



[1463]

[1464] DCE (1.5 mL) 중의 화합물 6-(4-플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (실시예 27, 단계 A, 30 mg, 0.14 mmol), 염화금(III) (2 mg, 0.007 mmol) 및 트라이플루오로메탄설폰산은 (4 mg, 0.014 mmol)의 용액에, 메틸 비닐 케톤 (35  $\mu$ L, 0.42 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 100°C로 가열하였다. 1시간 후에, 반응 혼합물을 실온으로 냉각시켜, 고체를 여과하였다. 그 후에 용매를 증발시키고, 조생성물을 HPLC 방법 A로 정제하여, 표제 화합물 (1 mg, 2%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 282.1;  $m/z$  실측치, 283.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.16 – 8.14 (m, 1H), 7.76 – 7.72 (m, 2H), 7.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.26 – 7.21 (m, 2H), 6.60 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.52 (t,  $J = 6.5$  Hz, 2H), 3.09 (t,  $J = 6.4$  Hz, 2H), 2.12 (s, 3H).

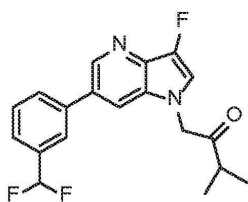
[1465] 실시예 341: 1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1466]

[1467] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 314.1;  $m/z$  실측치, 315.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.12 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 2H), 7.63 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 2H), 5.36 (s, 2H), 2.86 – 2.78 (m, 1H), 1.12 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

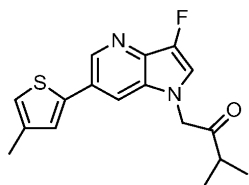
[1468] 실시예 342: 1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1469]

[1470] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_3N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 346.1;  $m/z$  실측치, 347.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.19 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.94 – 7.89 (m, 2H), 7.69 – 7.63 (m, 2H), 7.62 – 7.58 (m, 1H), 7.11 (t,  $J = 55.8$  Hz, 1H), 5.38 (s, 2H), 2.87 – 2.77 (m, 1H), 1.12 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

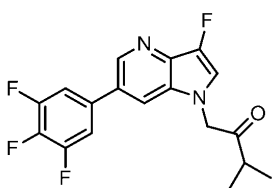
[1471] 실시예 343: 1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1472]

[1473] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}FN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 316.1;  $m/z$  실측치, 317.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.04 (s, 1H), 7.61 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.40 (s, 1H), 7.16 (s, 1H), 5.35 (s, 2H), 2.87 – 2.78 (m, 1H), 2.26 (s, 3H), 1.13 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

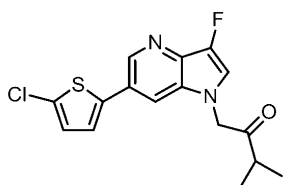
[1474] 실시예 344: 1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1475]

[1476] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_4N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 350.1;  $m/z$  실측치, 351.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.25 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.84 – 7.76 (m, 2H), 7.69 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 5.35 (s, 2H), 2.87 – 2.79 (m, 1H), 1.13 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

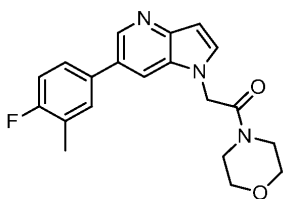
[1477] 실시예 345: 1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.



[1478]

[1479] 표제 화합물을 실시예 324와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}ClFN_2OS$ 에 대한 질량 계산치, 336.0;  $m/z$  실측치, 337.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.92 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.44 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.30 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.02 (d,  $J = 3.8$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 2.93 – 2.82 (m, 1H), 1.21 (d,  $J = 7.0$  Hz, 6H).

[1480] 실시예 346: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온.

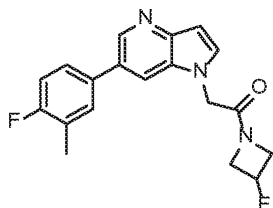


[1481]

[1482] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O_2$ 에 대한 질량 계산치, 353.2;  $m/z$  실측치, 354.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.69 – 7.62 (m, 1H), 7.61 – 7.52 (m, 2H), 7.26 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J =$

3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.74 – 3.66 (m, 2H), 3.63 – 3.56 (m, 4H), 3.48 – 3.42 (m, 2H), 2.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H).

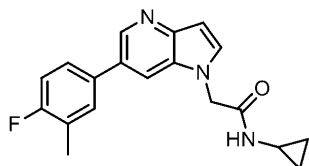
[1483] 실시예 347: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1484]

[1485] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.69 – 7.64 (m, 1H), 7.62 – 7.54 (m, 2H), 7.30 – 7.22 (m, 1H), 6.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.54 – 5.38 (m, 1H), 5.06 (d,  $J = 5.3$  Hz, 2H), 4.59 – 4.47 (m, 1H), 4.36 – 4.19 (m, 2H), 4.03 – 3.91 (m, 1H), 2.33 (s, 3H).

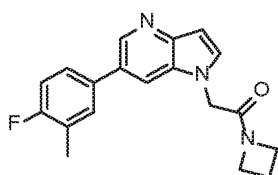
[1486] 실시예 348: N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1487]

[1488] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (600 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.32 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 8.06 – 8.01 (m, 1H), 7.66 (dd,  $J = 7.5, 2.5$  Hz, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.59 – 7.54 (m, 1H), 7.29 – 7.23 (m, 1H), 6.58 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 2.69 – 2.62 (m, 1H), 2.33 (s, 3H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.42 (m, 2H).

[1489] 실시예 349: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

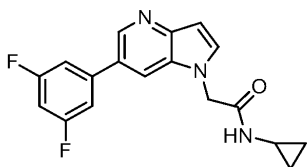


[1490]

[1491] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;  $m/z$  실측치, 324.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.68 (dd,  $J = 7.6, 2.3$  Hz, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 2H), 7.27 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.20 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.34 (d,  $J = 1.9$  Hz, 3H), 2.31 – 2.21 (m, 2H).

[1492] 실시예 349의 화합물은 또한 실온에서  $H_2$  분위기 하에 메탄올 중의 10 중량% Pd/C의 존재 하에 실시예 68의 화합물로부터 제조될 수 있다.

[1493] 실시예 350: N-사이클로프로필-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



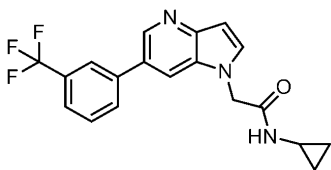
[1494]

[1495]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.03 (s, 1H), 8.89 (s, 1H), 8.43 – 8.36 (m, 1H), 8.11 – 8.06 (m, 1H), 7.72 – 7.65 (m, 2H), 7.40 – 7.32 (m, 1H), 6.87 – 6.78 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 2.70 – 2.59 (m, 1H), 0.67 – 0.59 (m, 2H), 0.49 – 0.42 (m, 2H).

[1496]

실시예 351: N-사이클로프로필-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



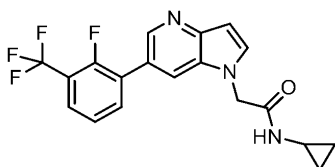
[1497]

[1498]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.05 – 9.01 (m, 1H), 8.85 (s, 1H), 8.42 (d,  $J$  = 4.2 Hz, 1H), 8.21 – 8.14 (m, 2H), 8.07 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.87 – 7.79 (m, 2H), 6.83 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 2.70 – 2.62 (m, 1H), 0.68 – 0.61 (m, 2H), 0.49 – 0.43 (m, 2H).

[1499]

실시예 352: N-사이클로프로필-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



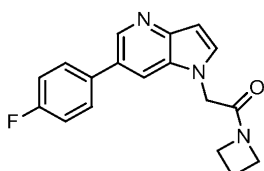
[1500]

[1501]

표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실측치, 378.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.79 (s, 1H), 8.56 (s, 1H), 8.39 (d,  $J$  = 4.2 Hz, 1H), 8.06 – 7.98 (m, 2H), 7.90 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 1H), 7.61 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 6.81 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 2.68 – 2.60 (m, 1H), 0.67 – 0.60 (m, 2H), 0.47 – 0.41 (m, 2H).

[1502]

실시예 353: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

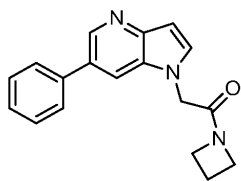


[1503]

[1504]

표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1;  $m/z$  실측치, 310.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.09 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.83 – 7.75 (m, 2H), 7.60 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.39 – 7.31 (m, 2H), 6.60 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.25 – 4.17 (m, 2H), 3.94 – 3.88 (m, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H).

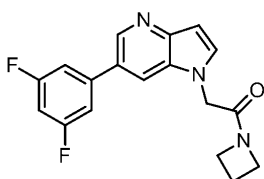
[1505] 실시예 354: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[1506]

[1507] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 291.1; m/z 실측치, 292.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.11 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.77 – 7.73 (m, 2H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.54 – 7.48 (m, 2H), 7.42 – 7.36 (m, 1H), 6.60 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.21 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.32 – 2.20 (m, 2H).

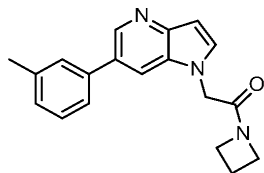
[1508] 실시예 355: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1509]

[1510] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.74 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.25 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.60 – 7.52 (m, 2H), 7.28 – 7.19 (m, 1H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.22 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.33 – 2.22 (m, 2H).

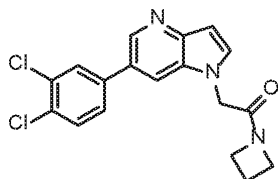
[1511] 실시예 356: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



[1512]

[1513] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 305.2; m/z 실측치, 306.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.97 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.06 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.69 – 7.61 (m, 2H), 7.47 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.31 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.85 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.23 (s, 2H), 4.29 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.93 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.37 – 2.25 (m, 2H).

[1514] 실시예 357: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.

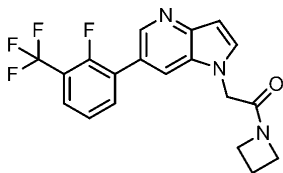


[1515]

[1516] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;

$m/z$  실측치, 360.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  9.00 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.84 (s, 1H), 8.17 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.02 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.91 – 7.81 (m, 2H), 6.83 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 4.28 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.93 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.37 – 2.25 (m, 2H).

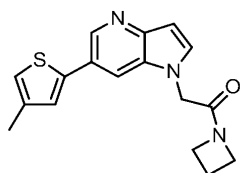
[1517] 실시예 358: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



[1518]

[1519] 표제 화합물을 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실측치, 378.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.84 (s, 1H), 8.67 (s, 1H), 8.07 – 7.99 (m, 2H), 7.92 (t,  $J$  = 7.2 Hz, 1H), 7.62 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 6.85 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.17 (s, 2H), 4.27 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.92 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.36 – 2.24 (m, 2H).

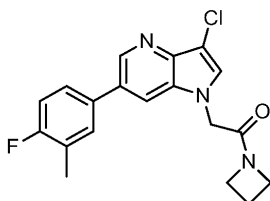
[1520] 실시예 359: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염.



[1521]

[1522] 표제 화합물을 (2-플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 71과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 311.1;  $m/z$  실측치, 312.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.86 (s, 1H), 8.58 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.56 – 7.50 (m, 1H), 7.29 – 7.23 (m, 1H), 6.76 (s, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.28 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.93 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.37 – 2.25 (m, 5H).

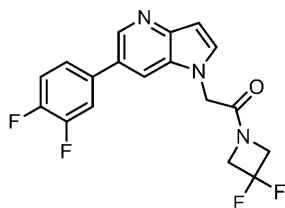
[1523] 실시예 360: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1524]

[1525] 표제 화합물을 실시예 176과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1;  $m/z$  실측치, 358.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.19 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.72 – 7.66 (m, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 1H), 7.28 (dd,  $J$  = 9.7, 8.5 Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.34 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 3H), 2.32 – 2.24 (m, 2H).

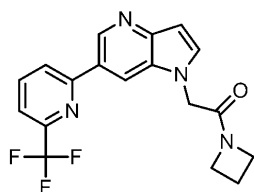
[1526] 실시예 361: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1527]

[1528] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1;  $m/z$  실험치, 364.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 – 8.57 (m, 1H), 8.10 (dd,  $J$  = 1.9, 1.0 Hz, 1H), 7.68 – 7.61 (m, 1H), 7.58 (dd,  $J$  = 3.4, 0.9 Hz, 1H), 7.54 – 7.48 (m, 1H), 7.42 – 7.33 (m, 1H), 6.70 – 6.66 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.66 (t,  $J$  = 11.9 Hz, 2H), 4.41 (t,  $J$  = 12.2 Hz, 2H).

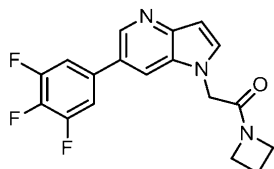
[1529] 실시예 362: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1530]

[1531] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)-6-(트라이플루오로메틸)피리딘을 사용하여, 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 360.1;  $m/z$  실험치, 361.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.08 (dd,  $J$  = 1.9, 0.9 Hz, 1H), 8.53 (s, 1H), 8.22 (d,  $J$  = 8.1 Hz, 1H), 8.08 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.72 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.63 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 6.69 (dd,  $J$  = 3.2, 1.0 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.30 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.07 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.43 – 2.30 (m, 2H).

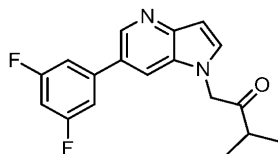
[1532] 실시예 363: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1533]

[1534] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실험치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.57 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.10 – 8.06 (m, 1H), 7.58 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.56 – 7.46 (m, 2H), 6.67 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.28 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.06 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.42 – 2.31 (m, 2H).

[1535] 실시예 364: 1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온.

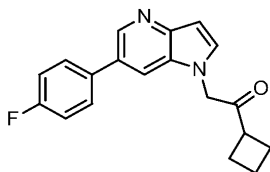


[1536]

[1537] 표제 화합물을 실시예 75와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_2N_2O$ 에 대한 질량 계산치, 314.1;  $m/z$  실험치, 315.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.20 (dd,  $J$  = 2.2, 0.9 Hz, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.60 – 7.51 (m, 2H), 7.28 – 7.19 (m, 1H), 6.64 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9

Hz, 1H), 5.42 (s, 2H), 2.91 – 2.78 (m, 1H), 1.14 (d,  $J = 6.9$  Hz, 6H).

[1538] 실시예 365: 1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

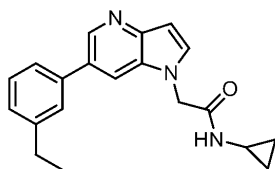


[1539]

[1540] 표제 화합물을 6-(4-플루오로-페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-1-사이클로부틸에탄온을 사용하여, 실시예 170과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}FN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 308.1;  $m/z$  실측치, 309.2

$[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.94 – 7.89 (m, 1H), 7.72 – 7.64 (m, 2H), 7.51 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.25 – 7.16 (m, 2H), 6.67 (dd,  $J = 3.4, 1.0$  Hz, 1H), 5.21 – 5.13 (m, 2H), 3.55 – 3.43 (m, 1H), 2.37 – 2.23 (m, 2H), 2.22 – 2.11 (m, 2H), 2.09 – 1.95 (m, 1H), 1.91 – 1.79 (m, 1H).

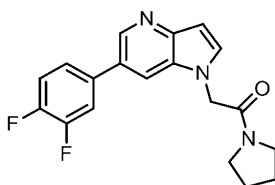
[1541] 실시예 366: N-사이클로프로필-2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1542]

[1543] 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필아세트아미드 (실시예 75, 단계 A의 중간체) 및 (3-에틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2;  $m/z$  실측치, 320.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.37 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 8.04 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.63 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.59 – 7.51 (m, 2H), 7.41 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.23 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.59 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 4.87 (s, 2H), 2.75 – 2.61 (m, 3H), 1.26 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H), 0.67 – 0.59 (m, 2H), 0.48 – 0.41 (m, 2H).

[1544] 실시예 367: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

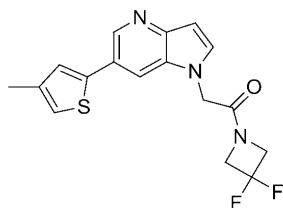


[1545]

[1546] 표제 화합물을 실시예 105와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.53 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.03 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.60 (ddd,  $J = 12.0, 7.6, 2.3$  Hz, 1H), 7.54 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.49 – 7.43 (m, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 1H), 6.65 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.62 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.44 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.10 – 2.00 (m, 2H), 1.95 – 1.85 (m, 2H).



[1547] 실시예 368: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



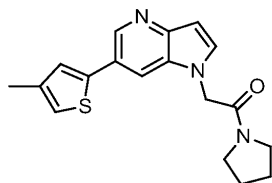
[1548]

[1549] 단계 A: 에틸 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세테이트. 표제 화합물을 실시예 66, 단계 B와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{11}H_{11}BrN_2O_2$ 에 대한 질량 계산치, 282.0;  $m/z$  실측치, 283.0  $[M+H]^+$ .

[1550] 단계 B: 2-(6-(4-메틸티오펜-2-일)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트산. 표제 화합물을 실시예 66, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{14}H_{12}N_2O_2S$ 에 대한 질량 계산치, 272.1;  $m/z$  실측치, 273.1  $[M+H]^+$ .

[1551] 단계 C: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온. 표제 화합물을 실시예 31, 단계 D와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;  $m/z$  실측치, 348.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.03 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.52 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.28 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.99 – 6.97 (m, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.64 (t,  $J = 11.9$  Hz, 2H), 4.40 (t,  $J = 12.2$  Hz, 2H), 2.29 (s, 3H).

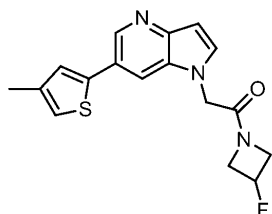
[1552] 실시예 369: 2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[1553]

[1554] 표제 화합물을 실시예 368과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;  $m/z$  실측치, 326.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.00 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.51 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.27 (d,  $J = 1.3$  Hz, 1H), 6.97 (s, 1H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 3.63 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.46 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 2.28 (s, 3H), 2.13 – 2.00 (m, 2H), 1.97 – 1.86 (m, 2H).

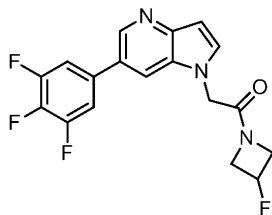
[1555] 실시예 370: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1556]

[1557] 표제 화합물을 실시예 368과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 329.1;  $m/z$  실측치, 330.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.01 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.52 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.28 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 6.98 (s, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.51 – 5.26 (m, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.60 – 4.42 (m, 1H), 4.41 – 4.22 (m, 2H), 4.18 – 4.00 (m, 1H), 2.29 (s, 3H).

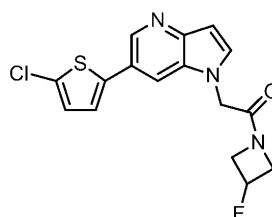
[1558] 실시예 371: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1559]

[1560] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.2  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.56 – 7.48 (m, 2H), 6.68 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.51 – 5.29 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.5$  Hz, 2H), 4.64 – 4.48 (m, 1H), 4.42 – 4.27 (m, 2H), 4.16 – 4.02 (m, 1H).

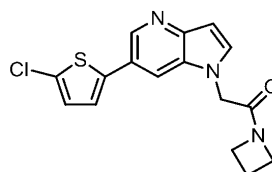
[1561] 실시예 372: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1562]

[1563] 표제 화합물을 실시예 130과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 349.0; m/z 실측치, 350.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.06 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.43 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.20 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.4, 0.8$  Hz, 1H), 5.59 – 5.35 (m, 1H), 5.06 (s, 2H), 4.65 – 4.47 (m, 1H), 4.40 – 4.16 (m, 2H), 4.07 – 3.88 (m, 1H).

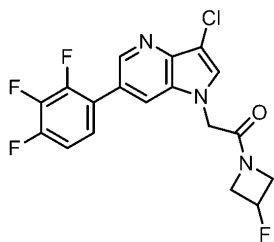
[1564] 실시예 373: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1565]

[1566] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.06 (dd,  $J = 2.1, 0.8$  Hz, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.44 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.20 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 6.60 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.23 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.92 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.22 (m, 2H).

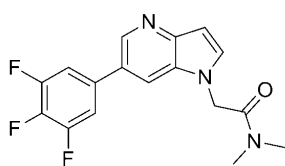
[1567] 실시예 374: 2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1568]

[1569] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{12}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 397.1;  $m/z$  실측치, 398.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.58 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.58 – 7.43 (m, 2H), 5.62 – 5.31 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.68 – 4.47 (m, 1H), 4.46 – 4.14 (m, 2H), 4.07 – 3.88 (m, 1H).

[1570] 실시예 375: N,N-다이메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

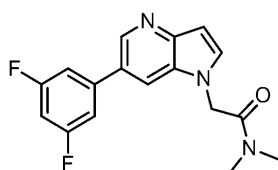


[1571]

[1572] 단계 A: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 표제 화합물을 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드를 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{11}H_{12}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1;  $m/z$  실측치, 282.0  $[M+H]^+$ .

[1573] 단계 B: N,N-다이메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드. 표제 화합물을 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드 및 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산을 사용하여, 실시예 1, 단계 A와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 333.1;  $m/z$  실측치, 334.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.55 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.53 – 7.46 (m, 2H), 6.66 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

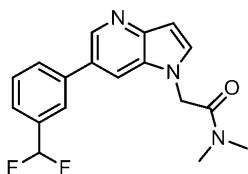
[1574] 실시예 376: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1575]

[1576] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1;  $m/z$  실측치, 316.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.09 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.56 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 2H), 6.97 – 6.90 (m, 1H), 6.66 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

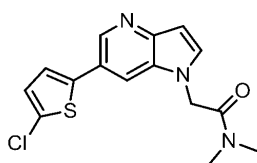
[1577] 실시예 377: 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1578]

[1579] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.06 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.87 – 7.77 (m, 2H), 7.61 – 7.50 (m, 3H), 6.84 (t,  $J = 56.2$  Hz, 1H), 6.66 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.96 (s, 3H).

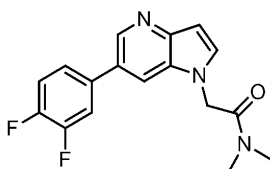
[1580] 실시예 378: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1581]

[1582] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.52 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.99 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.53 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.27 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.00 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

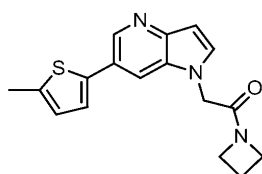
[1583] 실시예 379: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1584]

[1585] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.05 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.64 (ddd,  $J = 11.9, 7.7, 2.3$  Hz, 1H), 7.54 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.53 – 7.47 (m, 1H), 7.40 – 7.32 (m, 1H), 6.66 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

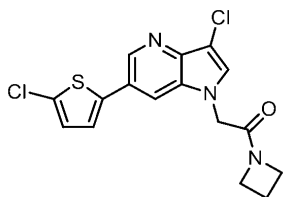
[1586] 실시예 380: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1587]

[1588] 표제 화합물을 실시예 130과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.98 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.34 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.86 (dd,  $J = 3.5, 1.3$  Hz, 1H), 6.57 (d,  $J = 2.9$  Hz, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.21 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.39 – 2.17 (m, 2H).

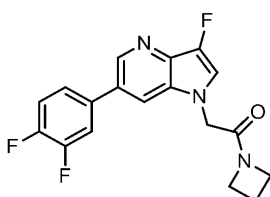
[1589] 실시예 381: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1590]

[1591] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}Cl_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 365.0; m/z 실측치, 365.8  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.16 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.49 (d,  $J = 4.0$  Hz, 1H), 7.22 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.92 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.25 (m, 2H).

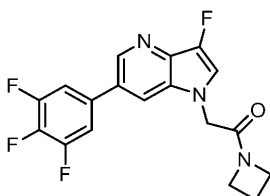
[1592] 실시예 382: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1593]

[1594] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.26 – 8.22 (m, 1H), 7.89 (ddd,  $J = 12.4, 7.8, 2.2$  Hz, 1H), 7.71 – 7.53 (m, 3H), 4.95 (s, 2H), 4.22 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.32 – 2.21 (m, 2H).

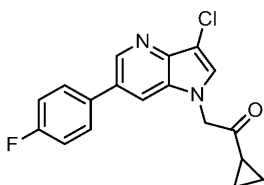
[1595] 실시예 383: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1596]

[1597] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.33 – 8.27 (m, 1H), 7.86 – 7.79 (m, 2H), 7.70 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 4.95 (s, 2H), 4.22 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.23 (m, 2H).

[1598] 실시예 384: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온.

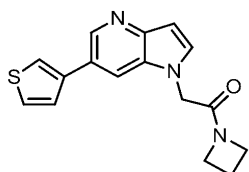


[1599]

[1600] 표제 화합물을 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClFN_2O$ 에 대한 질량 계산치, 328.1; m/z 실측치, 328.9  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.22 (d,  $J = 2.0$  Hz,

1H), 7.87 – 7.74 (m, 3H), 7.35 (t,  $J = 8.9$  Hz, 2H), 5.49 (s, 2H), 2.19 – 2.08 (m, 1H), 1.07 – 0.89 (m, 4H).

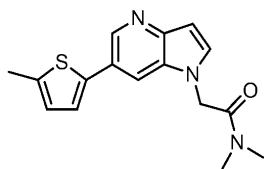
[1601] 실시예 385: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트.



[1602]

[1603] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 297.1;  $m/z$  실측치, 298.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.04 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.88 (s, 1H), 8.17 – 8.11 (m, 1H), 8.03 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.80 (dd,  $J = 5.0, 2.9$  Hz, 1H), 7.76 (dd,  $J = 5.0, 1.4$  Hz, 1H), 6.82 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 4.29 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.94 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.37 – 2.28 (m, 2H).

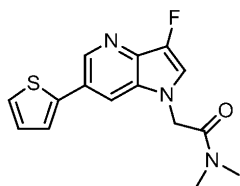
[1604] 실시예 386: N,N-다이메틸-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1605]

[1606] 표제 화합물을 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{17}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 299.1;  $m/z$  실측치, 300.0  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.79$  min.

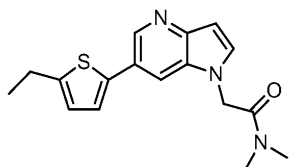
[1607] 실시예 387: 2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1608]

[1609] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 303.1;  $m/z$  실측치, 304.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.14 (t, 1H), 7.61 – 7.57 (m, 3H), 7.21 – 7.16 (m, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[1610] 실시예 388: 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염.



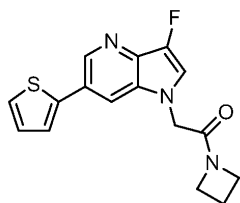
[1611]

[1612]

표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 313.1;  $m/z$  실측치, 314.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.76 (s, 1H), 8.37 (br. s, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 1H), 7.45 (d,  $J$  = 3.6 Hz, 1H), 6.93 (d,  $J$  = 3.7 Hz, 1H), 6.71 – 6.65 (m, 1H), 5.34 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.87 (d,  $J$  = 6.1 Hz, 5H), 1.29 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 3H).

[1613]

실시예 389: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



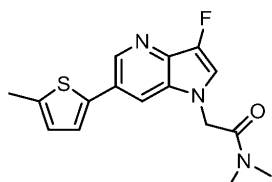
[1614]

[1615]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 315.1;  $m/z$  실측치, 316.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.15 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.63 – 7.59 (m, 2H), 7.22 – 7.15 (m, 1H), 4.95 (s, 2H), 4.23 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.35 – 2.22 (m, 2H).

[1616]

실시예 390: 2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



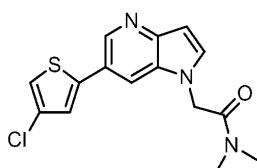
[1617]

[1618]

표제 화합물을 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{16}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 317.1;  $m/z$  실측치, 318.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.21 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.64 – 7.60 (m, 2H), 5.20 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.07 (s, 3H).

[1619]

실시예 391: 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염.



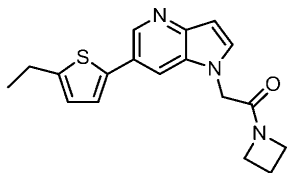
[1620]

[1621]

표제 화합물을 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한

질량 계산치, 319.1;  $m/z$  실측치, 320.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.84 (s, 1H), 8.52 (s, 1H), 7.85 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.68 (s, 2H), 6.73 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.36 (s, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.88 (s, 3H).

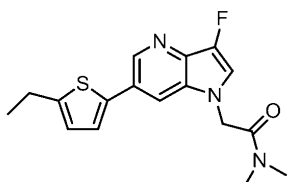
[1622] 실시예 392: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.



[1623]

[1624] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;  $m/z$  실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.79 (s, 1H), 8.40 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.47 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.94 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.71 (d,  $J = 3.1$  Hz, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.26 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.93 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.88 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.36 – 2.24 (m, 2H), 1.30 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

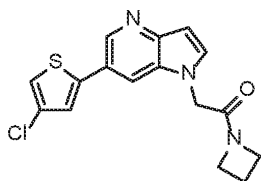
[1625] 실시예 393: 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1626]

[1627] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{18}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;  $m/z$  실측치, 332.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.58 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.39 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.90 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.91 – 2.80 (m, 5H), 1.28 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

[1628] 실시예 394: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.

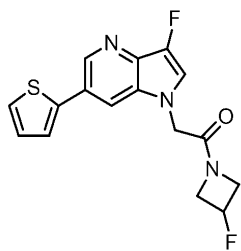


[1629]

[1630] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;  $m/z$  실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.08 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.00 – 7.98 (m, 1H), 7.22 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.80 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 6.68 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 6.08 (dd,  $J = 3.5, 1.0$  Hz, 1H), 4.42 (s, 2H), 3.61 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.29 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 1.69 – 1.59 (m, 2H).

[1631] 실시예 395: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염.

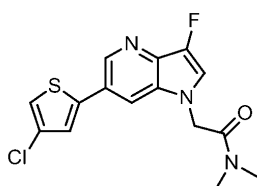




[1632]

[1633] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 333.1;  $m/z$  실측치, 334.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.17 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.66 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 2H), 7.19 (dd,  $J = 5.1, 3.6$  Hz, 1H), 5.56 – 5.38 (m, 1H), 5.02 (d,  $J = 2.8$  Hz, 2H), 4.65 – 4.50 (m, 1H), 4.41 – 4.18 (m, 2H), 4.05 – 3.92 (m, 1H).

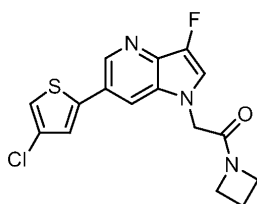
[1634] 실시예 396: 2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1635]

[1636] 표제 화합물을 (5-클로로티오펜-2-일)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{13}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 337.0;  $m/z$  실측치, 338.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.05 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.58 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.37 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.86 (dd,  $J = 3.6, 1.2$  Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

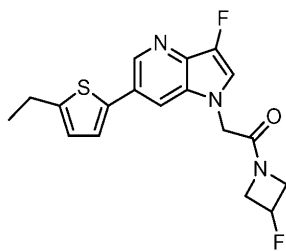
[1637] 실시예 397: 1-(아세트티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1638]

[1639] 표제 화합물을 (5-클로로티오펜-2-일)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 349.0;  $m/z$  실측치, 350.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.21 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.68 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.64 (s, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.23 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.33 – 2.24 (m, 2H).

[1640] 실시예 398: 2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아세트티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.

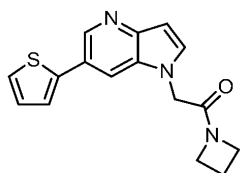


[1641]

[1642] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 1.14$  min.

[1643]

실시예 399: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

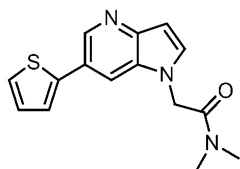


[1644]

[1645] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 – 8.05 (m, 1H), 7.55 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.48 (dd,  $J = 3.6, 1.2$  Hz, 1H), 7.43 (dd,  $J = 5.1, 1.2$  Hz, 1H), 7.14 (dd,  $J = 5.2, 3.6$  Hz, 1H), 6.68 – 6.62 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.27 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.43 – 2.31 (m, 2H).

[1646]

실시예 400: N,N-다이메틸-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

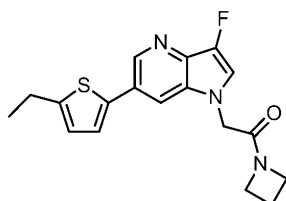


[1647]

[1648] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{15}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 285.1; m/z 실측치, 286.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 – 8.02 (m, 1H), 7.51 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.46 (dd,  $J = 3.6, 1.1$  Hz, 1H), 7.42 (dd,  $J = 5.1, 1.1$  Hz, 1H), 7.13 (dd,  $J = 5.1, 3.6$  Hz, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.99 (s, 3H).

[1649]

실시예 401: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

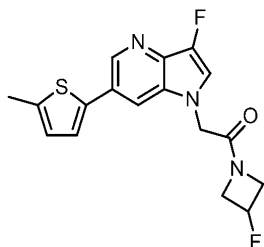


[1650]

[1651] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.01 (t,  $J = 2.1$  Hz,

1H), 7.44 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 7.30 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.87 – 6.83 (m, 1H), 4.92 (s, 2H), 4.34 – 4.26 (m, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.94 – 2.84 (m, 2H), 2.44 – 2.33 (m, 2H), 1.35 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

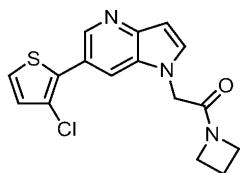
[1652] 실시예 402: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염.



[1653]

[1654] 표제 화합물을 (5-클로로티오펜-2-일)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;  $m/z$  실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.34 (s, 1H), 7.67 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.36 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 6.85 (d,  $J = 3.6$  Hz, 1H), 5.54 – 5.31 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 3.1$  Hz, 2H), 4.71 – 4.55 (m, 1H), 4.49 – 4.28 (m, 2H), 4.19 – 4.02 (m, 1H), 2.54 (s, 3H).

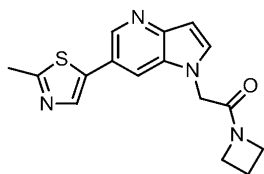
[1655] 실시예 403: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1656]

[1657] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;  $m/z$  실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.08 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.55 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 7.11 (d,  $J = 5.4$  Hz, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.31 – 4.24 (m, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.41 – 2.31 (m, 2H).

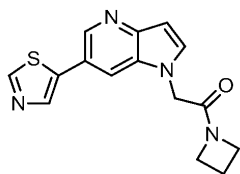
[1658] 실시예 404: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-메틸티아졸-5-일)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1659]

[1660] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 2-메틸-5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)티아졸을 사용하여, 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{16}N_4OS$ 에 대한 질량 계산치, 312.1;  $m/z$  실측치, 313.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.32 – 4.25 (m, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.75 (s, 3H), 2.43 – 2.34 (m, 2H).

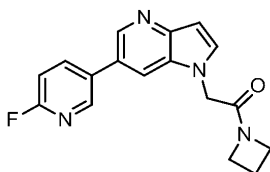
[1661] 실시예 405: 1-(아제티딘-1-일)-2-(6-티아졸-5-일피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[1662]

[1663] 표제 화합물을 (5-(트라이플루오로메틸)피리딘-3-일)보론산 대신에 5-(4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란-2-일)티아졸을 사용하여, 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}N_4OS$ 에 대한 질량 계산치, 298.1;  $m/z$  실측치, 299.0  $[M+H]^+$ .

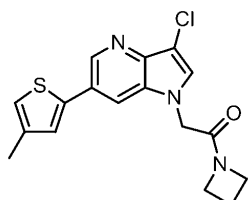
[1664] 실시예 406: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-플루오로-3-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1665]

[1666] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}FN_4O$ 에 대한 질량 계산치, 310.1;  $m/z$  실측치, 311.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.56 – 8.53 (m, 1H), 8.32 – 8.27 (m, 1H), 8.14 (dd,  $J$  = 2.0, 0.9 Hz, 1H), 7.61 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.23 – 7.18 (m, 1H), 6.70 (dd,  $J$  = 3.4, 0.9 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.32 – 4.25 (m, 2H), 4.07 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.42 – 2.33 (m, 2H).

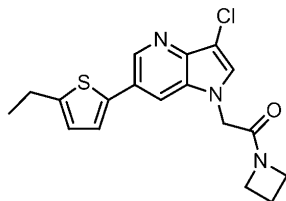
[1667] 실시예 407: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1668]

[1669] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.14 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.44 (d,  $J$  = 1.4 Hz, 1H), 7.18 (t,  $J$  = 1.3 Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.25 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.95 – 3.89 (m, 2H), 2.33 – 2.25 (m, 5H).

[1670] 실시예 408: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

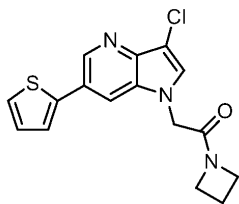


[1671]

[1672] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.05 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.31 (d,  $J$  = 3.6 Hz, 1H), 6.87 – 6.84 (m, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.36 – 4.29 (m, 2H),

4.08 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.94 – 2.86 (m, 2H), 2.45 – 2.35 (m, 2H), 1.35 (t,  $J = 7.5$  Hz, 3H).

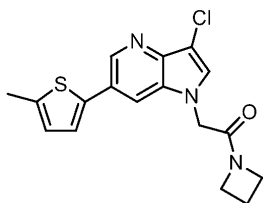
[1673] 실시예 409: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1674]

[1675] 표제 화합물을 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;  $m/z$  실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.74 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.17 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 2H), 7.20 (dd,  $J = 5.0, 3.6$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.92 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.25 (m, 2H).

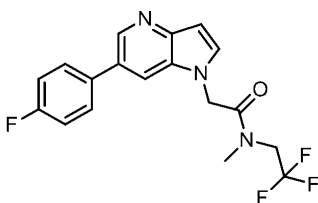
[1676] 실시예 410: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1677]

[1678] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;  $m/z$  실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.03 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.29 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.84 – 6.79 (m, 1H), 4.98 (s, 2H), 4.37 – 4.28 (m, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.53 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H), 2.44 – 2.34 (m, 2H).

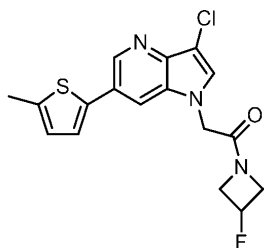
[1679] 실시예 411: 2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드.



[1680]

[1681] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1;  $m/z$  실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.01 – 7.99 (m, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 2H), 7.54 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 2H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.37 (s, 2H), 4.16 (q,  $J = 9.3$  Hz, 2H), 3.33 (s, 3H).

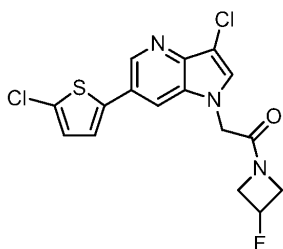
[1682] 실시예 412: 2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1683]

[1684] 표제 화합물을 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드 대신에 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 2)을 사용하고, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.05 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.59 (s, 1H), 7.29 (d,  $J = 3.5$  Hz, 1H), 6.83 – 6.80 (m, 1H), 5.50 – 5.33 (m, 1H), 5.04 (d,  $J = 3.5$  Hz, 2H), 4.64 – 4.54 (m, 1H), 4.45 – 4.30 (m, 2H), 4.16 – 4.06 (m, 1H), 2.52 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H).

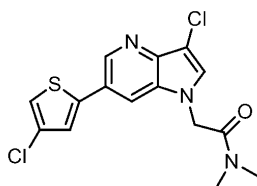
[1685] 실시예 413: 2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1686]

[1687] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{12}Cl_2FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 383.0; m/z 실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.09 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.63 (s, 1H), 7.33 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 7.04 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 5.51 – 5.34 (m, 1H), 5.05 (d,  $J = 4.0$  Hz, 2H), 4.66 – 4.57 (m, 1H), 4.46 – 4.31 (m, 2H), 4.16 – 4.06 (m, 1H).

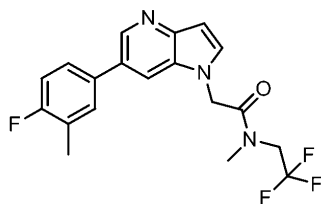
[1688] 실시예 414: 2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1689]

[1690] 표제 화합물을 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  7.84 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.33 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 6.80 (s, 1H), 6.62 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 6.52 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 4.46 (s, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.17 (s, 3H).

[1691] 실시예 415: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드.



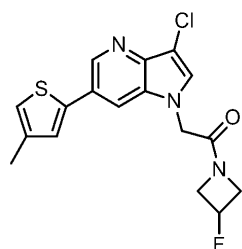
[1692]

[1693]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1;  $m/z$  실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.05 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.63 (dd,  $J = 7.6, 2.4$  Hz, 1H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.57 – 7.53 (m, 1H), 7.26 (dd,  $J = 9.7, 8.5$  Hz, 1H), 6.59 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.39 (s, 2H), 4.19 (q,  $J = 9.6$  Hz, 2H), 3.26 (s, 3H), 2.33 (d,  $J = 1.8$  Hz, 3H).

[1694]

실시예 416: 2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



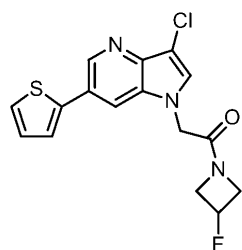
[1695]

[1696]

표제 화합물을 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드 대신에 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 2)을 사용하고, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(4-메틸티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 363.1;  $m/z$  실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.15 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.77 (s, 1H), 7.43 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 7.18 (t,  $J = 1.2$  Hz, 1H), 5.56 – 5.40 (m, 1H), 5.06 (d,  $J = 3.2$  Hz, 2H), 4.63 – 4.54 (m, 1H), 4.40 – 4.31 (m, 1H), 4.31 – 4.21 (m, 1H), 4.04 – 3.93 (m, 1H), 2.27 (d,  $J = 1.1$  Hz, 3H).

[1697]

실시예 417: 2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



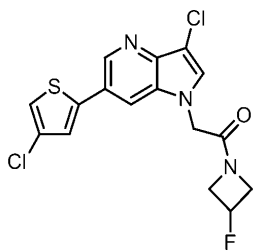
[1698]

[1699]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 349.0;  $m/z$  실측치, 350.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  9.58 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 9.01 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.61 (s, 1H), 8.47 – 8.39 (m, 2H), 8.03 (dd,  $J = 5.1, 3.6$  Hz, 1H), 6.40 – 6.21 (m, 1H), 5.90 (d,  $J = 2.9$  Hz, 2H), 5.48 – 5.35 (m, 1H), 5.28 – 5.14 (m, 1H), 5.14 – 5.03 (m, 1H), 4.88 – 4.75 (m, 1H).

[1700]

실시예 418: 2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



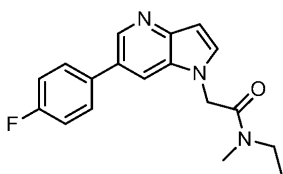
[1701]

[1702]

표제 화합물을 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드 대신에 2-브로모-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 (중간체 2)을 사용하고, (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{12}Cl_2FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 383.0;  $m/z$  실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.24 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.67 – 7.61 (m, 2H), 5.59 – 5.39 (m, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.65 – 4.53 (m, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 1H), 4.31 – 4.20 (m, 1H), 4.04 – 3.92 (m, 1H).

[1703]

실시예 419: N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



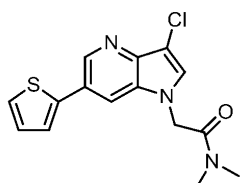
[1704]

[1705]

표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1;  $m/z$  실측치, 312.1  $[M+H]^+$ . 분석 HPLC를 이너트실 ODS-3 컬럼 (3  $\mu m$ ,  $50 \times 3$  mm), 2.2 mL/min의 유량 (온도 = 50°C)에서의 1.6분간에 걸친 0.05% TFA 중의 5 내지 99% ACN, 그 다음에 99% ACN에서 0.4분간 유지의 이동상을 사용한 애질런트 1100 시리즈에서 얻었다. 254 nm에서  $R_t = 0.82$  min.

[1706]

실시예 420: 2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



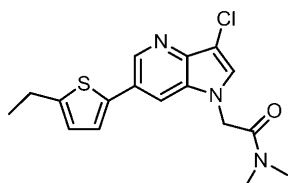
[1707]

[1708]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 319.1;  $m/z$  실측치, 320.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.11 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.50 (dd,  $J = 3.6, 1.2$  Hz, 1H), 7.45 (dd,  $J = 5.2, 1.2$  Hz, 1H), 7.15 (dd,  $J = 5.2, 3.6$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

[1709]

실시예 421: 2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1710]

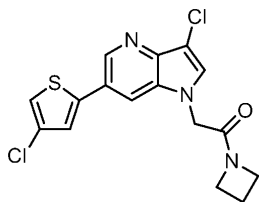
[1711]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{18}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;



m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.03 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.55 (s, 1H), 7.29 (d,  $J$  = 3.6 Hz, 1H), 6.88 – 6.81 (m, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.93 – 2.85 (m, 2H), 1.35 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 3H).

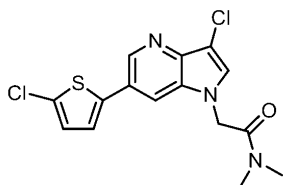
[1712] 실시예 422: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1713]

[1714] 표제 화합물을 (3,4-다이플루오로페닐)보론산 대신에 2-(4-클로로티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 29와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{13}Cl_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 365.0; m/z 실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.15 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.45 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 7.34 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.34 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.08 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.44 – 2.35 (m, 2H).

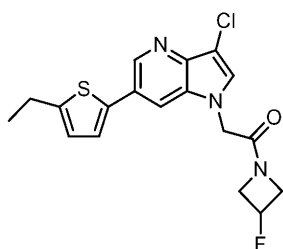
[1715] 실시예 423: 2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1716]

[1717] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.07 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.32 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 7.03 (d,  $J$  = 4.0 Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

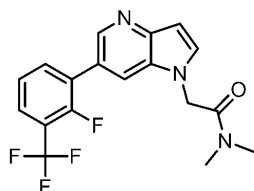
[1718] 실시예 424: 2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1719]

[1720] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.06 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.30 (d,  $J$  = 3.6 Hz, 1H), 6.86 – 6.83 (m, 1H), 5.50 – 5.33 (m, 1H), 5.04 (d,  $J$  = 3.5 Hz, 2H), 4.65 – 4.55 (m, 1H), 4.45 – 4.29 (m, 2H), 4.18 – 4.05 (m, 1H), 2.94 – 2.85 (m, 2H), 1.35 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 3H).

[1721] 실시예 425: 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



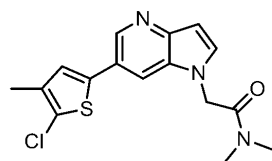
[1722]

[1723]

표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 – 8.59 (m, 1H), 7.78 – 7.74 (m, 1H), 7.73 – 7.68 (m, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 1H), 7.39 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.34 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 6.81 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 3.00 (s, 3H).

[1724]

실시예 426: 2-[6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



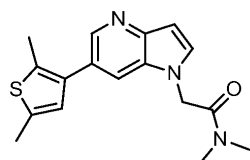
[1725]

[1726]

표제 화합물을 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산 대신에 2-(5-클로로-4-메틸티오펜-2-일)-4,4,5,5-테트라메틸-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.32 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 7.01 (s, 1H), 6.76 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.22 (s, 3H).

[1727]

실시예 427: 2-[6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



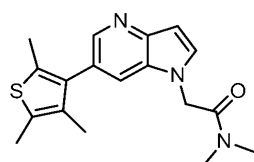
[1728]

[1729]

표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.49 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.32 (d,  $J$  = 3.4 Hz, 1H), 6.76 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 6.73 (s, 1H), 4.91 (s, 2H), 3.07 (s, 3H), 2.99 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.44 (s, 3H).

[1730]

실시예 428: N,N-다이메틸-2-[6-(2,4,5-트라이메틸-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

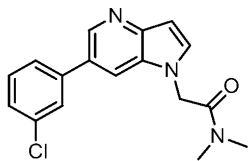


[1731]

[1732]

표제 화합물을 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(2,4,5-트라이메틸티오펜-3-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{21}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.32 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.41 – 7.38 (m, 1H), 7.35 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 6.78 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.06 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.26 (s, 3H), 1.92 (s, 3H).

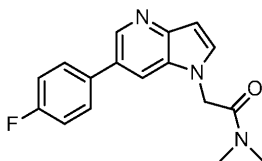
[1733] 실시예 429: 2-[6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1734]

[1735] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.67 (s, 1H), 7.66 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.59 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.52 – 7.46 (m, 1H), 7.38 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.35 – 7.31 (m, 2H), 6.78 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 3.00 (s, 3H).

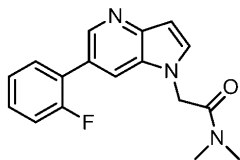
[1736] 실시예 430: 2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1737]

[1738] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.10 – 8.08 (m, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.57 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.36 – 7.30 (m, 2H), 6.58 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

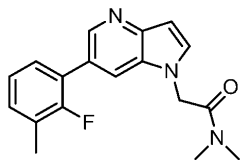
[1739] 실시예 431: 2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1740]

[1741] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.49 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.00 (s, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.58 (dd,  $J = 8.1, 1.8$  Hz, 1H), 7.47 – 7.41 (m, 1H), 7.38 – 7.31 (m, 2H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

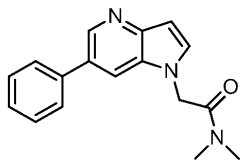
[1742] 실시예 432: 2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1743]

[1744] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.46 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.59 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 7.34 – 7.29 (m, 1H), 7.21 (t,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 6.60 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.32 (d,  $J = 2.1$  Hz, 3H).

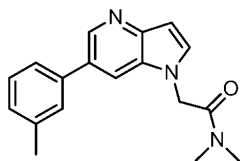
[1745] 실시예 433: N,N-다이메틸-2-(6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드.



[1746]

[1747] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{17}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 279.1; m/z 실측치, 280.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.11 – 8.09 (m, 1H), 7.76 – 7.72 (m, 2H), 7.56 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.50 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 7.40 – 7.35 (m, 1H), 6.58 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

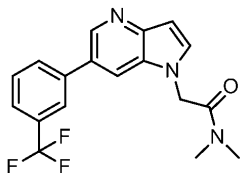
[1748] 실시예 434: N,N-다이메틸-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1749]

[1750] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 293.2; m/z 실측치, 294.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.07 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.57 – 7.54 (m, 2H), 7.54 – 7.50 (m, 1H), 7.38 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.21 – 7.16 (m, 1H), 6.57 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.40 (s, 3H).

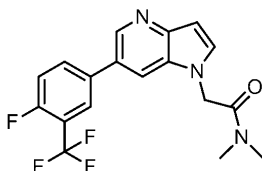
[1751] 실시예 435: N,N-다이메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1752]

[1753] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.22 (dd,  $J = 2.1, 0.9$  Hz, 1H), 8.09 – 8.05 (m, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.75 – 7.71 (m, 2H), 7.61 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.13 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

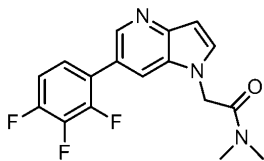
[1754] 실시예 436: 2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1755]

[1756] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1; m/z 실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.20 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 8.14 – 8.08 (m, 1H), 8.06 (dd,  $J = 6.8, 2.4$  Hz, 1H), 7.68 – 7.63 (m, 1H), 7.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

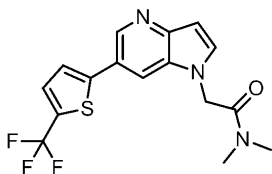
[1757] 실시예 437: N,N-다이메틸-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1758]

[1759] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.48 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.2$  Hz, 1H), 7.49 – 7.42 (m, 2H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

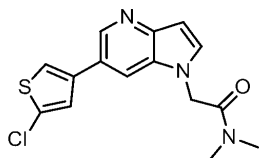
[1760] 실시예 438: N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1761]

[1762] 표제 화합물을 (3,4,5-트라이플루오로페닐)보론산 대신에 4,4,5,5-테트라메틸-2-(5-(트라이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1,3,2-다이옥사보롤란을 사용하여, 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{14}F_3N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.25 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.59 – 7.56 (m, 1H), 7.54 – 7.51 (m, 1H), 6.71 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.32 (s, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.99 (s, 3H).

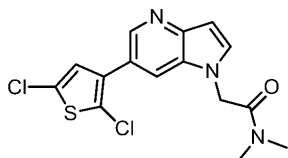
[1763] 실시예 439: 2-[6-(5-클로로-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1764]

[1765] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{14}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 319.1; m/z 실측치, 320.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.60 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.24 (dd,  $J = 1.8, 0.9$  Hz, 1H), 7.72 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.43 (d,  $J = 5.8$  Hz, 1H), 7.24 (d,  $J = 5.8$  Hz, 1H), 6.74 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.33 (s, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.97 (s, 3H).

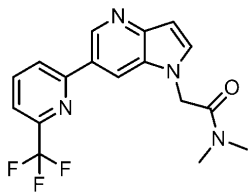
[1766] 실시예 440: 2-[6-(2,5-다이클로로-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1767]

[1768] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 353.0; m/z 실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.51 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.99 – 7.96 (m, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.19 (s, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.97 (s, 3H).

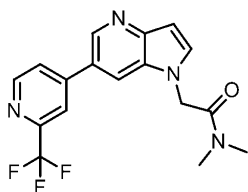
[1769] 실시예 441: N,N-다이메틸-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1770]

[1771] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 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 (500 Mhz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.08 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.50 (s, 1H), 8.21 (d,  $J = 8.0$  Hz, 1H), 8.08 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.72 (d,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.99 (s, 3H).

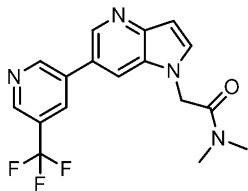
[1772] 실시예 442: N,N-다이메틸-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1773]

[1774] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 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 (500 Mhz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.79 – 8.72 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 8.21 (s, 1H), 8.06 – 8.00 (m, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 1H), 6.73 – 6.68 (m, 1H), 5.32 (s, 2H), 3.22 (s, 3H), 2.99 (s, 3H).

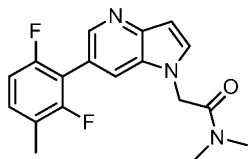
[1775] 실시예 443: N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1776]

[1777] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 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 (500 Mhz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  9.16 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 8.90 – 8.84 (m, 1H), 8.67 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.49 – 8.46 (m, 1H), 8.25 – 8.22 (m, 1H), 7.60 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 6.70 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.30 (s, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

[1778] 실시예 444: 2-[6-(2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.

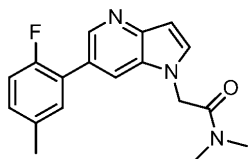


[1779]

[1780] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 Mhz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.35 – 8.33 (m, 1H), 7.93 – 7.91 (m, 1H), 7.58 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.32 – 7.25 (m, 1H), 7.03 – 6.98 (m, 1H), 6.69 (dd,  $J = 3.4, 0.9$  Hz, 1H), 5.25

(s, 2H), 3.17 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 2.32 – 2.29 (m, 3H).

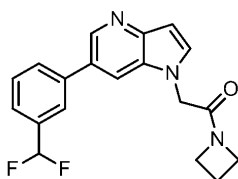
[1781] 실시예 445: 2-[6-(2-플루오로-5-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1782]

[1783] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.47 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.59 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.40 – 7.35 (m, 1H), 7.25 – 7.19 (m, 2H), 6.60 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.36 (s, 3H).

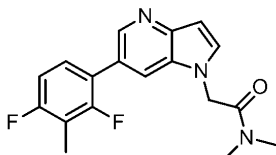
[1784] 실시예 446: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1785]

[1786] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.17 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.96 – 7.91 (m, 2H), 7.69 – 7.56 (m, 3H), 7.12 (t,  $J$  = 55.8 Hz, 1H), 6.62 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.21 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.30 – 2.22 (m, 2H).

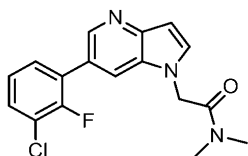
[1787] 실시예 447: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1788]

[1789] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.44 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.60 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.48 – 7.39 (m, 1H), 7.23 – 7.16 (m, 1H), 6.60 (dd,  $J$  = 3.3, 0.8 Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.26 – 2.23 (m, 3H).

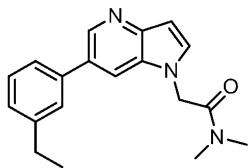
[1790] 실시예 448: 2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1791]

[1792] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.49 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.66 – 7.59 (m, 2H), 7.60 – 7.53 (m, 1H), 7.36 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 6.62 (d,  $J$  = 2.7 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

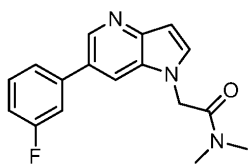
[1793] 실시예 449: 2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1794]

[1795] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.2; m/z 실측치, 308.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.09 – 8.04 (m, 1H), 7.59 – 7.49 (m, 3H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 6.58 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.70 (q,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 1.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

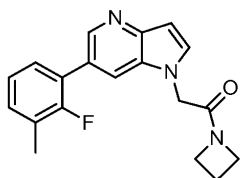
[1796] 실시예 450: 2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1797]

[1798] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.1, 0.9 Hz, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 3H), 7.57 – 7.50 (m, 1H), 7.23 – 7.16 (m, 1H), 6.59 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

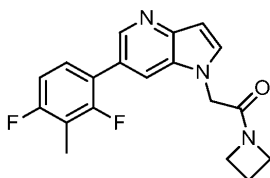
[1799] 실시예 451: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1800]

[1801] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.48 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.62 (d,  $J$  = 3.2 Hz, 1H), 7.41 – 7.37 (m, 1H), 7.35 – 7.29 (m, 1H), 7.22 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 6.61 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.20 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 3H), 2.30 – 2.21 (m, 2H).

[1802] 실시예 452: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



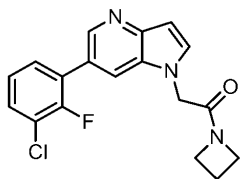
[1803]

[1804] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.45 (t,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.50 – 7.41 (m, 1H), 7.24 – 7.17 (m, 1H), 6.62 (dd,  $J$  = 3.3, 0.9 Hz, 1H), 4.98 (s,



2H), 4.20 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.31 – 2.21 (m, 5H).

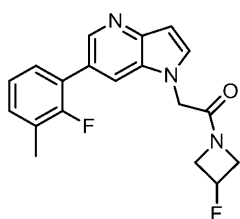
[1805] 실시예 453: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1806]

[1807] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.06 – 8.04 (m, 1H), 7.66 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.65 – 7.61 (m, 1H), 7.60 – 7.55 (m, 1H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 6.64 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.21 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.30 – 2.22 (m, 2H).

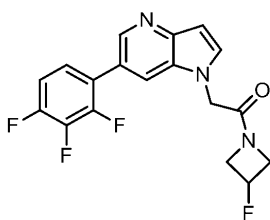
[1808] 실시예 454: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1809]

[1810] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.49 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.42 – 7.36 (m, 1H), 7.36 – 7.29 (m, 1H), 7.23 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.63 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.54 – 5.36 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 4.7$  Hz, 2H), 4.59 – 4.48 (m, 1H), 4.36 – 4.18 (m, 2H), 4.02 – 3.90 (m, 1H), 2.33 (d,  $J = 2.2$  Hz, 3H).

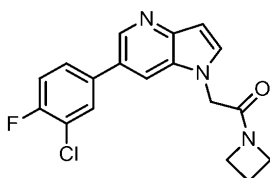
[1811] 실시예 455: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1812]

[1813] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1;  $m/z$  실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.67 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.51 – 7.45 (m, 2H), 6.65 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.54 – 5.36 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 4.6$  Hz, 2H), 4.59 – 4.49 (m, 1H), 4.37 – 4.18 (m, 2H), 4.02 – 3.90 (m, 1H).

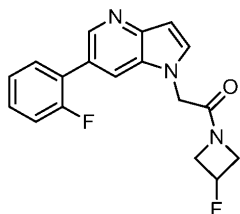
[1814] 실시예 456: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1815]

[1816] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.18 – 8.15 (m, 1H), 7.98 (dd,  $J = 7.2, 2.2$  Hz, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.55 (t,  $J = 9.0$  Hz, 1H), 6.61 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.21 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.32 – 2.21 (m, 2H).

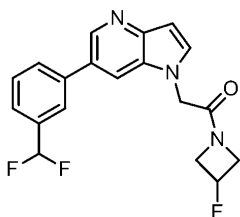
[1817] 실시예 457: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1818]

[1819] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.52 (t,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.65 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.64 – 7.56 (m, 1H), 7.49 – 7.42 (m, 1H), 7.40 – 7.32 (m, 2H), 6.64 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 5.55 – 5.34 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.0$  Hz, 2H), 4.61 – 4.46 (m, 1H), 4.37 – 4.17 (m, 2H), 4.03 – 3.88 (m, 1H).

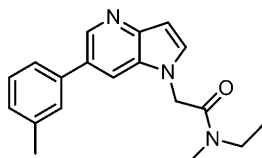
[1820] 실시예 458: 2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1821]

[1822] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J = 1.9, 0.9$  Hz, 1H), 7.95 – 7.91 (m, 2H), 7.69 – 7.62 (m, 2H), 7.62 – 7.57 (m, 1H), 7.12 (t,  $J = 55.8$  Hz, 1H), 6.63 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.56 – 5.36 (m, 1H), 5.10 (d,  $J = 2.3$  Hz, 2H), 4.60 – 4.47 (m, 1H), 4.37 – 4.18 (m, 2H), 4.04 – 3.91 (m, 1H).

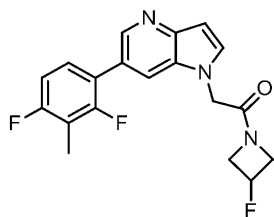
[1823] 실시예 459: N-에틸-N-메틸-2-[6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1824]

[1825] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.2;  $m/z$  실측치, 308.1  $[M+H]^+$ .

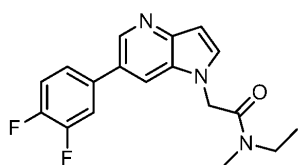
[1826] 실시예 460: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1827]

[1828] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.46 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.64 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.48 – 7.41 (m, 1H), 7.24 – 7.18 (m, 1H), 6.63 (dd,  $J = 3.2, 0.9$  Hz, 1H), 5.53 – 5.36 (m, 1H), 5.06 (d,  $J = 4.8$  Hz, 2H), 4.58 – 4.48 (m, 1H), 4.36 – 4.19 (m, 2H), 4.01 – 3.91 (m, 1H), 2.25 (s, 3H).

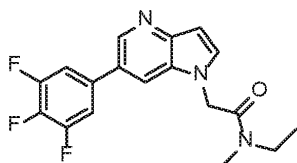
[1829] 실시예 461: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드.



[1830]

[1831] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1;  $m/z$  실측치, 330.1  $[M+H]^+$ .

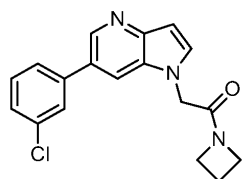
[1832] 실시예 462: N-에틸-N-메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1833]

[1834] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;  $m/z$  실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .

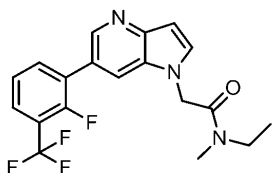
[1835] 실시예 463: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1836]

[1837] 표제 화합물을 실시예 102와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;  $m/z$  실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.83 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.77 – 7.72 (m, 1H), 7.62 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.53 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.47 – 7.41 (m, 1H), 6.61 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.21 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.32 – 2.21 (m, 2H).

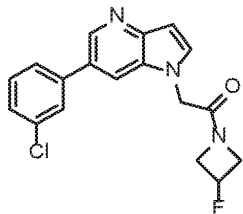
[1838] 실시예 464: N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[1839]

[1840] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .

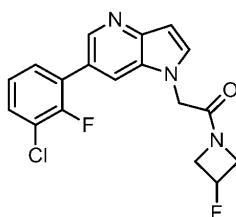
[1841] 실시예 465: 2-[6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1842]

[1843] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.82 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.74 (d,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 7.65 – 7.61 (m, 1H), 7.56 – 7.50 (m, 1H), 7.46 – 7.41 (m, 1H), 6.62 (d,  $J$  = 3.0 Hz, 1H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.09 (s, 2H), 4.60 – 4.49 (m, 1H), 4.36 – 4.19 (m, 2H), 4.00 – 3.91 (m, 1H).

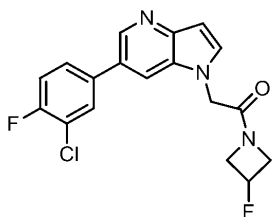
[1844] 실시예 466: 2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1845]

[1846] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.20 (s, 1H), 7.98 (dd,  $J$  = 7.1, 2.3 Hz, 1H), 7.81 – 7.75 (m, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.55 (t,  $J$  = 8.9 Hz, 1H), 6.63 (dd,  $J$  = 3.2, 0.9 Hz, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.08 (d,  $J$  = 2.9 Hz, 2H), 4.60 – 4.48 (m, 1H), 4.37 – 4.19 (m, 2H), 4.02 – 3.90 (m, 1H).

[1847] 실시예 467: 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

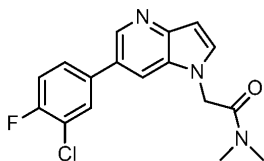


[1848]

[1849] 표제 화합물을 실시예 128과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.18 (dd,  $J$  = 2.2, 0.9 Hz, 1H), 7.98 (dd,  $J$  = 7.1, 2.3 Hz, 1H), 7.80 – 7.75 (m, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 3.3 Hz, 1H), 7.55 (t,  $J$  =

9.0 Hz, 1H), 6.62 (dd,  $J = 3.3, 0.8$  Hz, 1H), 5.54 – 5.37 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 2.8$  Hz, 2H), 4.59 – 4.48 (m, 1H), 4.36 – 4.19 (m, 2H), 4.01 – 3.90 (m, 1H).

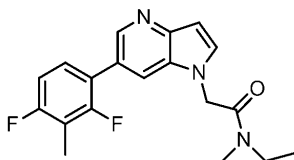
[1850] 실시예 468: 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1851]

[1852] 표제 화합물을 실시예 375와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;  $m/z$  실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.06 (dd,  $J = 2.0, 0.9$  Hz, 1H), 7.83 (dd,  $J = 7.0, 2.3$  Hz, 1H), 7.69 – 7.62 (m, 1H), 7.55 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.35 (t,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.21 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

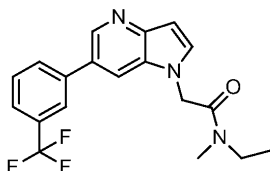
[1853] 실시예 469: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드.



[1854]

[1855] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.37 – 8.33 (m, 1H), 7.93 – 7.87 (m, 1H), 7.59 (dd,  $J = 8.5, 3.3$  Hz, 1H), 7.33 – 7.24 (m, 1H), 7.04 – 6.96 (m, 1H), 6.73 – 6.66 (m, 1H), 5.26 (s, 0.8H), 5.22 (s, 1.2H), 3.54 (q,  $J = 7.1$  Hz, 0.8H), 3.42 (q,  $J = 7.1$  Hz, 1.2H), 3.15 (s, 1.8H), 2.93 (s, 1.2H), 2.33 – 2.27 (m, 3H), 1.26 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1.2H), 1.11 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1.8H).

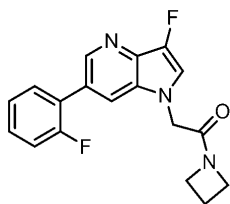
[1856] 실시예 470: N-에틸-N-메틸-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[1857]

[1858] 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;  $m/z$  실측치, 362.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 – 8.57 (m, 1H), 8.11 – 8.06 (m, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.94 – 7.90 (m, 1H), 7.68 – 7.63 (m, 2H), 7.56 (dd,  $J = 7.3, 3.3$  Hz, 1H), 6.67 (dd,  $J = 3.3, 0.9$  Hz, 1H), 5.26 (s, 0.8H), 5.23 (s, 1.2H), 3.54 (q,  $J = 7.1$  Hz, 0.8H), 3.43 (q,  $J = 7.1$  Hz, 1.2H), 3.16 (s, 1.8H), 2.94 (s, 1.2H), 1.29 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1.2H), 1.12 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1.8H).

[1859] 실시예 471: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

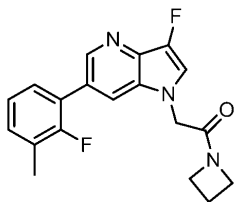


[1860]

[1861] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;

m/z 실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.54 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.69 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 1H), 7.52 – 7.44 (m, 1H), 7.41 – 7.33 (m, 2H), 4.94 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.32 – 2.21 (m, 2H).

[1862] 실시예 472: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

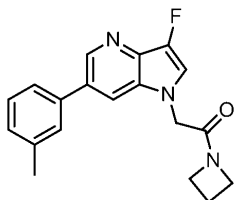


[1863]

[1864] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;

m/z 실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.51 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.44 – 7.31 (m, 2H), 7.23 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.21 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 3H), 2.30 – 2.21 (m, 2H).

[1865] 실시예 473: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

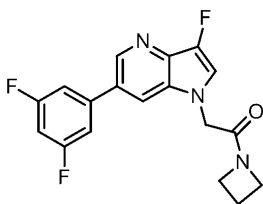


[1866]

[1867] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1;

m/z 실측치, 324.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.16 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.60 – 7.51 (m, 2H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.31 – 2.22 (m, 2H).

[1868] 실시예 474: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

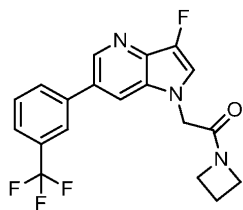


[1869]

[1870] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1;

m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.79 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.32 (t,  $J$  = 2.3 Hz, 1H), 7.70 (d,  $J$  = 2.3 Hz, 1H), 7.62 – 7.56 (m, 2H), 7.30 – 7.23 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 4.26 – 4.19 (m, 2H), 3.94 – 3.87 (m, 2H), 2.35 – 2.24 (m, 2H).

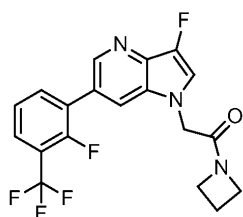
[1871] 실시예 475: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1872]

[1873] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.31 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 8.12 – 8.06 (m, 2H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.70 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 – 2.21 (m, 2H).

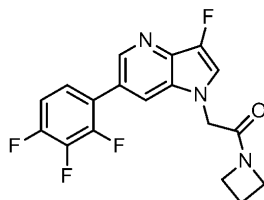
[1874] 실시예 476: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1875]

[1876] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1; m/z 실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.56 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.19 – 8.14 (m, 1H), 7.99 – 7.93 (m, 1H), 7.89 – 7.81 (m, 1H), 7.73 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.57 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 – 2.21 (m, 2H).

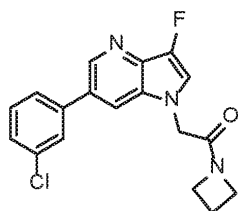
[1877] 실시예 477: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1878]

[1879] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.54 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.14 – 8.10 (m, 1H), 7.73 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.52 – 7.45 (m, 2H), 4.95 (s, 2H), 4.22 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.30 – 2.20 (m, 2H).

[1880] 실시예 478: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1881]

[1882] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;

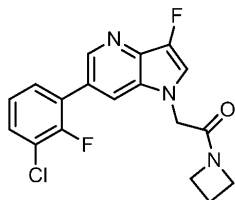
m/z 실측치, 344.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.62 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 8.13 (t, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.75 (t, *J* = 1.9 Hz, 1H), 7.68 – 7.62 (m, 1H), 7.52 – 7.45 (m, 2H), 7.44 – 7.38 (m, 1H), 4.97 (s, 2H), 4.32 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 4.07 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 2.44 – 2.33 (m, 2H).

[1883]

실시예

479:

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



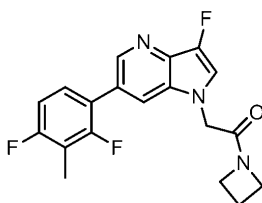
[1884]

[1885]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>ClF<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, MeOD) δ 8.90 – 8.81 (m, 2H), 8.09 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 7.69 – 7.57 (m, 2H), 7.45 – 7.31 (m, 1H), 5.20 (s, 2H), 4.41 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 4.14 – 4.02 (m, 2H), 2.50 – 2.36 (m, 2H).

[1886]

실시예 480: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1887]

[1888]

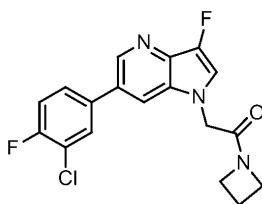
표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>16</sub>F<sub>3</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.94 – 8.90 (m, 1H), 8.87 (s, 1H), 8.15 (d, *J* = 2.2 Hz, 1H), 7.63 – 7.51 (m, 1H), 7.20 – 7.12 (m, 1H), 5.25 (s, 2H), 4.44 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 4.09 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 2.49 – 2.36 (m, 2H), 2.34 – 2.27 (m, 3H).

[1889]

실시예

481:

1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



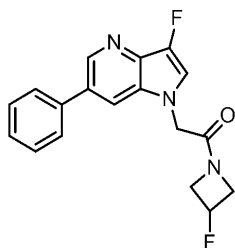
[1890]

[1891]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>ClF<sub>2</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 8.58 (d, *J* = 1.7 Hz, 1H), 8.14 (t, *J* = 2.1 Hz, 1H), 7.81 (dd, *J* = 7.0, 2.3 Hz, 1H), 7.66 – 7.59 (m, 1H), 7.53 (d, *J* = 2.3 Hz, 1H), 7.34 (t, *J* = 8.8 Hz, 1H), 4.95 (s, 2H), 4.32 (t, *J* = 7.8 Hz, 2H), 4.06 (t, *J* = 7.7 Hz, 2H), 2.44 – 2.32 (m, 2H).



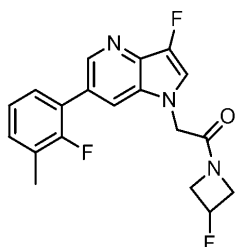
[1892] 실시예 482: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[1893]

[1894] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1;  $m/z$  실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.19 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.78 – 7.74 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.55 – 7.49 (m, 2H), 7.44 – 7.38 (m, 1H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.03 (d,  $J = 2.7$  Hz, 2H), 4.61 – 4.50 (m, 1H), 4.38 – 4.18 (m, 2H), 4.02 – 3.91 (m, 1H).

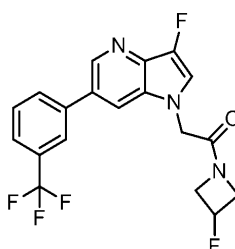
[1895] 실시예 483: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1896]

[1897] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.52 (t,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.51 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.37 (td,  $J = 7.5, 1.7$  Hz, 1H), 7.32 – 7.26 (m, 1H), 7.19 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.47 – 5.30 (m, 1H), 5.00 (d,  $J = 2.1$  Hz, 2H), 4.61 – 4.50 (m, 1H), 4.41 – 4.28 (m, 2H), 4.15 – 4.04 (m, 1H), 2.36 (d,  $J = 2.3$  Hz, 3H).

[1898] 실시예 484: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

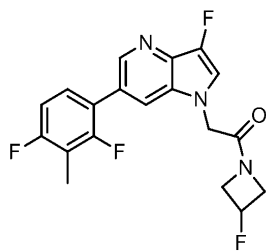


[1899]

[1900] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.31 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 8.12 – 8.05 (m, 2H), 7.80 – 7.72 (m, 2H), 7.70 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.09 – 5.00 (m, 2H), 4.62 – 4.50 (m, 1H), 4.40 – 4.17 (m, 2H), 4.04 – 3.91 (m, 1H).

[1901] 실시예 485: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.





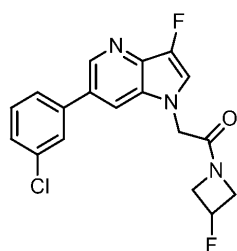
[1911]

[1912]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.52 – 8.45 (m, 1H), 8.06 (s, 1H), 7.69 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.51 – 7.41 (m, 1H), 7.22 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 1H), 5.55 – 5.36 (m, 1H), 5.00 (d,  $J$  = 4.0 Hz, 2H), 4.61 – 4.47 (m, 1H), 4.37 – 4.17 (m, 2H), 4.01 – 3.87 (m, 1H), 2.25 (s, 3H).

[1913]

실시예 489: 2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



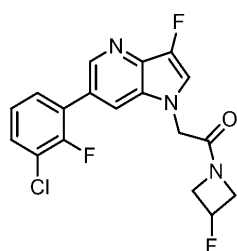
[1914]

[1915]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.26 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.84 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.54 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.50 – 7.44 (m, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.03 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 2H), 4.61 – 4.50 (m, 1H), 4.37 – 4.20 (m, 2H), 4.02 – 3.92 (m, 1H).

[1916]

실시예 490: 2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

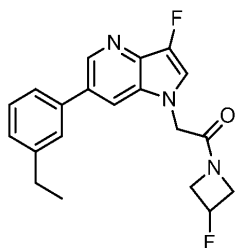


[1917]

[1918]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.55 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.15 (s, 1H), 7.72 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.68 – 7.63 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.41 – 7.34 (m, 1H), 5.55 – 5.36 (m, 1H), 5.02 (d,  $J$  = 3.5 Hz, 2H), 4.61 – 4.50 (m, 1H), 4.39 – 4.17 (m, 2H), 4.02 – 3.88 (m, 1H).

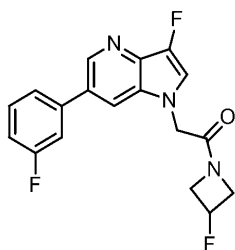
[1919] 실시예 491: 2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[1920]

[1921] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.16 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.64 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.59 – 7.57 (m, 1H), 7.57 – 7.53 (m, 1H), 7.42 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.25 (d,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.02 (d,  $J = 3.0$  Hz, 2H), 4.61 – 4.49 (m, 1H), 4.38 – 4.17 (m, 2H), 4.02 – 3.90 (m, 1H), 2.71 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.25 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

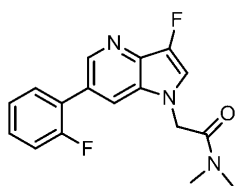
[1922] 실시예 492: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1923]

[1924] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.26 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.68 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 2H), 7.59 – 7.52 (m, 1H), 7.28 – 7.19 (m, 1H), 5.56 – 5.38 (m, 1H), 5.03 (d,  $J = 2.2$  Hz, 2H), 4.62 – 4.49 (m, 1H), 4.39 – 4.18 (m, 2H), 4.02 – 3.92 (m, 1H).

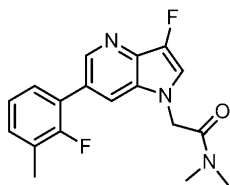
[1925] 실시예 493: 2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1926]

[1927] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.55 – 8.50 (m, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.65 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 1H), 7.51 – 7.44 (m, 1H), 7.40 – 7.33 (m, 2H), 5.20 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H).

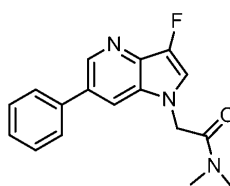
[1928] 실시예 494: 2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1929]

[1930] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.09 – 8.02 (m, 1H), 7.64 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.42 – 7.36 (m, 1H), 7.34 (t,  $J = 7.4$  Hz, 1H), 7.23 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 5.20 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.32 (d,  $J = 2.1$  Hz, 3H).

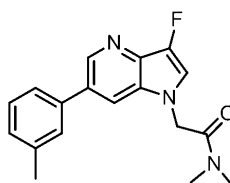
[1931] 실시예 495: 2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1932]

[1933] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 297.1; m/z 실측치, 298.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.19 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 2H), 7.61 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.54 – 7.48 (m, 2H), 7.43 – 7.37 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

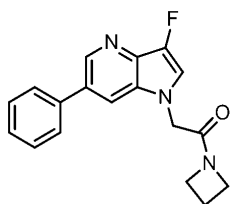
[1934] 실시예 496: 2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1935]

[1936] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.05 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.53 – 7.50 (m, 1H), 7.49 – 7.45 (m, 1H), 7.43 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.36 (t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.24 – 7.19 (m, 1H), 5.22 (s, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.98 (s, 3H), 2.43 (s, 3H).

[1937] 실시예 497: 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.

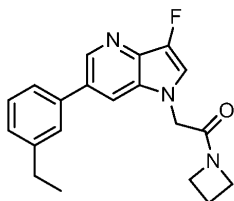


[1938]

[1939] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 309.1; m/z 실측치, 310.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.18 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 7.81 – 7.72 (m, 2H), 7.65 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 7.56 – 7.48 (m, 2H), 7.45 – 7.38 (m, 1H), 4.96

(s, 2H), 4.22 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.22 (m, 2H).

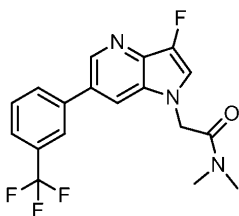
[1940] 실시예 498: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1941]

[1942] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2;  $m/z$  실측치, 338.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  7.80 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 7.26 (t,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 6.74 – 6.67 (m, 2H), 6.66 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 6.59 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 6.47 – 6.41 (m, 1H), 4.15 (s, 2H), 3.49 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.26 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 1.94 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.62 – 1.52 (m, 2H), 0.49 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

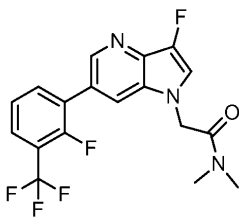
[1943] 실시예 499: 2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1944]

[1945] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.1;  $m/z$  실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.30 (t,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 8.12 – 8.05 (m, 2H), 7.80 – 7.73 (m, 2H), 7.66 (d,  $J = 2.2$  Hz, 1H), 5.24 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

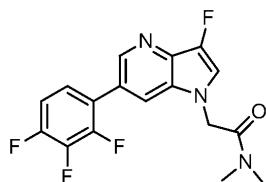
[1946] 실시예 500: 2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1947]

[1948] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1;  $m/z$  실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.54 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.98 – 7.91 (m, 1H), 7.88 – 7.82 (m, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.60 – 7.53 (m, 1H), 5.22 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H).

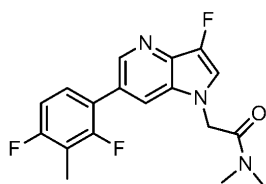
[1949] 실시예 501: 2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1950]

[1951] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{13}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 351.1; m/z 실측치, 352.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.52 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.14 – 8.11 (m, 1H), 7.69 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.52 – 7.43 (m, 2H), 5.20 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H).

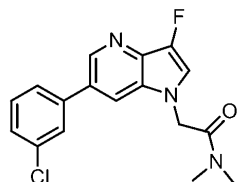
[1952] 실시예 502: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1953]

[1954] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.48 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.65 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.50 – 7.41 (m, 1H), 7.21 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

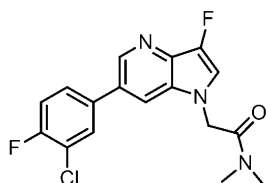
[1955] 실시예 503: 2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1956]

[1957] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.26 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.83 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.77 – 7.73 (m, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.53 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 7.48 – 7.43 (m, 1H), 5.22 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

[1958] 실시예 504: 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.

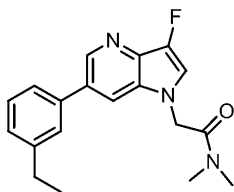


[1959]

[1960] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.25 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.99 (dd,  $J$  = 7.1, 2.3 Hz, 1H), 7.82 – 7.76 (m, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.56 (t,  $J$  = 9.0

Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

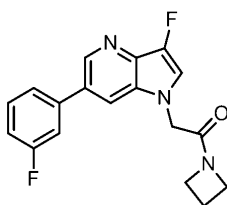
[1961] 실시예 505: 2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1962]

[1963] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.67 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.15 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.60 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.58 – 7.56 (m, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 8.0 Hz, 1H), 7.41 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.25 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.70 (q,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 1.25 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 3H).

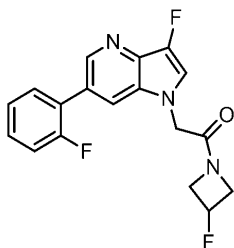
[1964] 실시예 506: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[1965]

[1966] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.77 – 8.71 (m, 1H), 8.26 (s, 1H), 7.70 – 7.62 (m, 3H), 7.59 – 7.53 (m, 1H), 7.27 – 7.20 (m, 1H), 4.96 (s, 2H), 4.23 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.34 – 2.22 (m, 2H).

[1967] 실시예 507: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

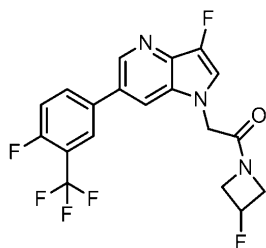


[1968]

[1969] 표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.08 – 8.02 (m, 1H), 7.62 – 7.55 (m, 1H), 7.52 (d,  $J$  = 2.3 Hz, 1H), 7.47 – 7.41 (m, 1H), 7.35 – 7.29 (m, 1H), 7.29 – 7.22 (m, 1H), 5.48 – 5.30 (m, 1H), 5.00 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 2H), 4.61 – 4.51 (m, 1H), 4.42 – 4.28 (m, 2H), 4.14 – 4.03 (m, 1H).

[1970] 실시예 508: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트리플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.





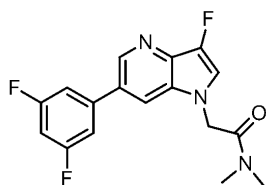
[1971]

[1972]

표제 화합물을 실시예 182와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}F_6N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 413.1; m/z 실측치, 414.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.29 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 8.17 – 8.11 (m, 1H), 8.09 (dd,  $J$  = 6.9, 2.4 Hz, 1H), 7.70 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.69 – 7.65 (m, 1H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.03 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 2H), 4.60 – 4.49 (m, 1H), 4.37 – 4.19 (m, 2H), 4.03 – 3.90 (m, 1H).

[1973]

실시예 509: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



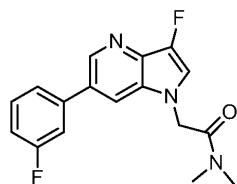
[1974]

[1975]

표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; m/z 실측치, 334.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.78 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.32 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.67 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.61 – 7.54 (m, 2H), 7.29 – 7.21 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[1976]

실시예 510: 2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



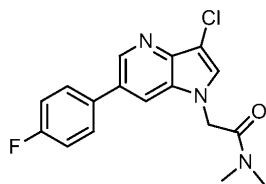
[1977]

[1978]

표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 315.1; m/z 실측치, 316.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.12 (t,  $J$  = 2.1 Hz, 1H), 7.56 – 7.44 (m, 4H), 7.16 – 7.10 (m, 1H), 5.23 (s, 2H), 3.19 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

[1979]

실시예 511: 2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



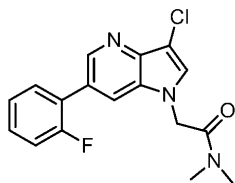
[1980]

[1981]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.21 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.83 – 7.76 (m, 2H), 7.75 (s, 1H), 7.38 – 7.32 (m, 2H), 5.26 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s,

3H).

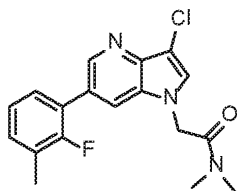
[1982] 실시예 512: 2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1983]

[1984] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1; m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.56 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.12 (dd,  $J$  = 1.9, 1.1 Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.63 – 7.56 (m, 1H), 7.51 – 7.44 (m, 1H), 7.40 – 7.33 (m, 2H), 5.26 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

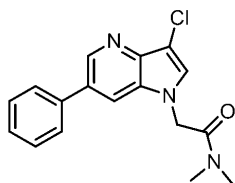
[1985] 실시예 513: 2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1986]

[1987] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 345.1; m/z 실측치, 346.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.54 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.03 (t,  $J$  = 1.4 Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.39 – 7.33 (m, 1H), 7.32 – 7.25 (m, 1H), 7.18 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.97 (s, 3H), 2.35 (d,  $J$  = 2.3 Hz, 3H).

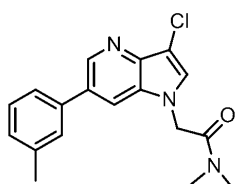
[1988] 실시예 514: 2-(3-클로로-6-페닐피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1989]

[1990] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{16}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.22 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.79 – 7.71 (m, 3H), 7.55 – 7.48 (m, 2H), 7.44 – 7.37 (m, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[1991] 실시예 515: 2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.

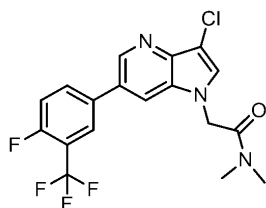


[1992]

[1993] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.19 (d,  $J$  = 1.9 Hz,

1H), 7.74 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.53 (d,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.39 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.22 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.41 (s, 3H).

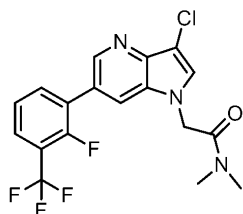
[1994] 실시예 516: 2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1995]

[1996] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 399.1; m/z 실측치, 400.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.77 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.31 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.17 – 8.10 (m, 1H), 8.08 (dd,  $J = 6.8, 2.4$  Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.71 – 7.63 (m, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

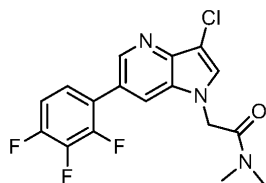
[1997] 실시예 517: 2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[1998]

[1999] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 399.1; m/z 실측치, 400.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.58 (t,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.21 – 8.18 (m, 1H), 7.94 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 7.89 – 7.82 (m, 2H), 7.57 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

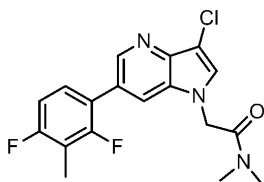
[2000] 실시예 518: 2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2001]

[2002] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 367.1; m/z 실측치, 368.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.56 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.19 – 8.12 (m, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.53 – 7.43 (m, 2H), 5.26 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

[2003] 실시예 519: 2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



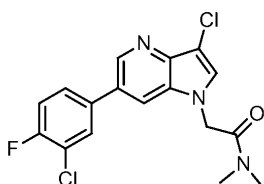
[2004]

[2005]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.52 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.09 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.79 (s, 1H), 7.50 – 7.41 (m, 1H), 7.22 (t,  $J$  = 9.2 Hz, 1H), 5.25 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.25 (s, 3H).

[2006]

실시예 520: 2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



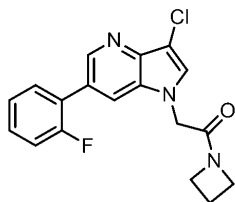
[2007]

[2008]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}Cl_2FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.0; m/z 실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.74 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.28 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.99 (dd,  $J$  = 7.1, 2.4 Hz, 1H), 7.82 – 7.78 (m, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.56 (t,  $J$  = 9.0 Hz, 1H), 5.27 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[2009]

실시예 521: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



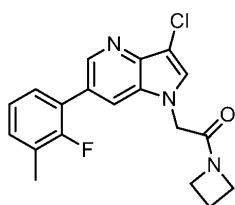
[2010]

[2011]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.58 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.12 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.64 – 7.58 (m, 1H), 7.52 – 7.45 (m, 1H), 7.41 – 7.34 (m, 2H), 5.00 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H).

[2012]

실시예 522: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



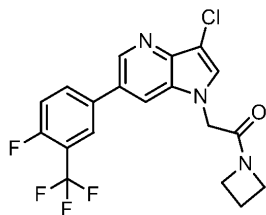
[2013]

[2014]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.1; m/z 실측치, 358.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.55 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.10 (dd,  $J$  = 1.9, 1.1 Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.43 – 7.37 (m, 1H), 7.37 – 7.32 (m, 1H), 7.24 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.23 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 (d,  $J$  = 2.1 Hz, 3H), 2.31 – 2.23 (m,

2H).

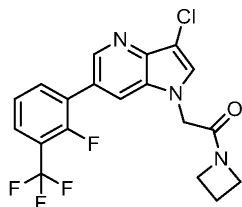
[2015] 실시예 523: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2016]

[2017] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.78 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.32 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.17 – 8.12 (m, 1H), 8.10 (dd,  $J$  = 6.8, 2.4 Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.72 – 7.65 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.91 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.33 – 2.24 (m, 2H).

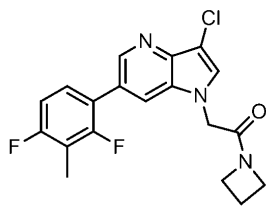
[2018] 실시예 524: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2019]

[2020] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 411.1; m/z 실측치, 412.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.59 (t,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.20 (t,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 7.99 – 7.93 (m, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.58 (t,  $J$  = 7.9 Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.24 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H).

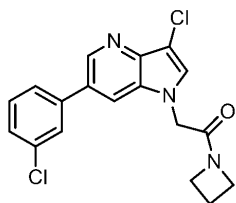
[2021] 실시예 525: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2022]

[2023] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.53 (t,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.09 (t,  $J$  = 1.4 Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.50 – 7.43 (m, 1H), 7.23 (t,  $J$  = 8.5 Hz, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.23 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.32 – 2.22 (m, 5H).

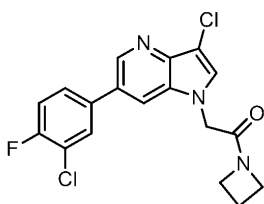
[2024] 실시예 526: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2025]

[2026] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.76 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.29 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.85 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.81 (s, 1H), 7.78 – 7.72 (m, 1H), 7.55 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.51 – 7.45 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.23 (m, 2H).

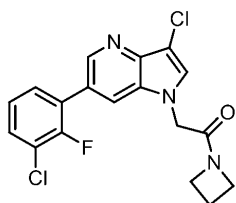
[2027] 실시예 527: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2028]

[2029] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.28 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.01 (dd,  $J = 7.1, 2.3$  Hz, 1H), 7.83 – 7.78 (m, 2H), 7.61 – 7.54 (m, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.24 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.33 – 2.24 (m, 2H).

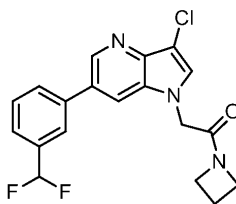
[2030] 실시예 528: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2031]

[2032] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.58 (s, 1H), 8.17 (s, 1H), 7.85 (s, 1H), 7.66 (t,  $J = 7.4$  Hz, 1H), 7.58 (t,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 7.38 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 5.01 (s, 2H), 4.24 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H).

[2033] 실시예 529: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

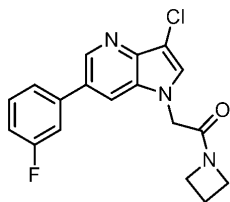


[2034]

[2035] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1;

m/z 실측치, 376.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.18 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.92 – 7.84 (m, 2H), 7.68 – 7.56 (m, 3H), 6.87 (t,  $J = 56.2$  Hz, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.33 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.9$  Hz, 2H), 2.44 – 2.34 (m, 2H).

[2036] 실시예 530: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

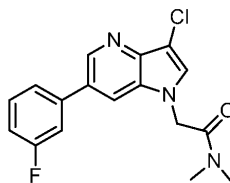


[2037]

[2038] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;

m/z 실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.79 – 8.75 (m, 1H), 8.31 – 8.27 (m, 1H), 7.81 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 7.68 – 7.61 (m, 2H), 7.60 – 7.52 (m, 1H), 7.24 (t,  $J = 8.2$  Hz, 1H), 5.02 (d,  $J = 2.3$  Hz, 2H), 4.25 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.5$  Hz, 2H), 2.33 – 2.25 (m, 2H).

[2039] 실시예 531: 2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.

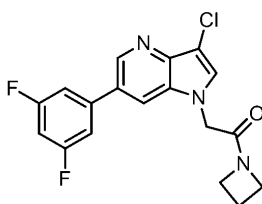


[2040]

[2041] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 331.1;

m/z 실측치, 332.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.15 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.62 (s, 1H), 7.57 – 7.46 (m, 3H), 7.17 – 7.09 (m, 1H), 5.29 (s, 2H), 3.20 (s, 3H), 2.98 (s, 3H).

[2042] 실시예 532: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

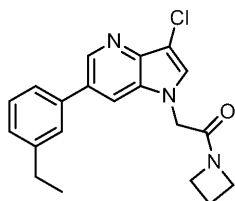


[2043]

[2044] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;

m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.20 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.39 (dd,  $J = 8.7, 2.2$  Hz, 2H), 7.03 – 6.96 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.39 – 4.30 (m, 2H), 4.08 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.44 – 2.35 (m, 2H).

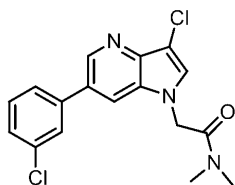
[2045] 실시예 533: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2046]

[2047] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{26}H_{20}ClN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 353.1; m/z 실측치, 354.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.19 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.60 – 7.57 (m, 1H), 7.58 – 7.53 (m, 1H), 7.43 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.26 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.24 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.91 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.71 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.32 – 2.23 (m, 2H), 1.26 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

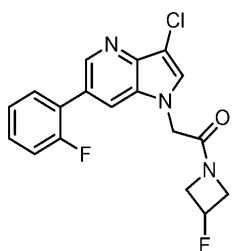
[2048] 실시예 534: 2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2049]

[2050] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}Cl_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.30 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.84 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.77 – 7.73 (m, 1H), 7.54 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.49 – 7.45 (m, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H).

[2051] 실시예 535: 2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

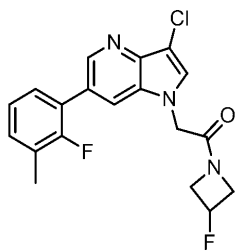


[2052]

[2053] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.58 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.14 (dd,  $J = 1.9, 1.1$  Hz, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.64 – 7.57 (m, 1H), 7.51 – 7.45 (m, 1H), 7.41 – 7.34 (m, 2H), 5.55 – 5.37 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.7$  Hz, 2H), 4.63 – 4.52 (m, 1H), 4.40 – 4.29 (m, 1H), 4.29 – 4.16 (m, 1H), 4.02 – 3.89 (m, 1H).

[2054] 실시예 536: 2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.





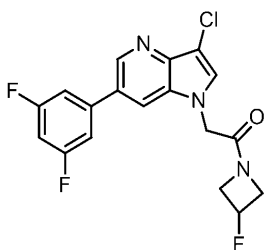
[2055]

[2056]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.1; m/z 실측치, 376.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.58 – 8.54 (m, 1H), 8.11 (s, 1H), 7.82 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 7.35 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 7.24 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.07 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 2H), 4.64 – 4.51 (m, 1H), 4.41 – 4.29 (m, 1H), 4.29 – 4.19 (m, 1H), 4.02 – 3.90 (m, 1H), 2.33 (s, 3H).

[2057]

실시예 537: 2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



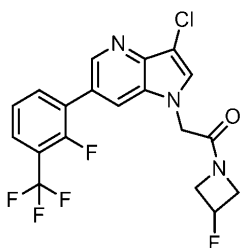
[2058]

[2059]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.82 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.35 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 7.84 (s, 1H), 7.61 – 7.55 (m, 2H), 7.31 – 7.23 (m, 1H), 5.57 – 5.40 (m, 1H), 5.08 (s, 2H), 4.65 – 4.53 (m, 1H), 4.41 – 4.31 (m, 1H), 4.31 – 4.20 (m, 1H), 4.04 – 3.93 (m, 1H).

[2060]

실시예 538: 2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



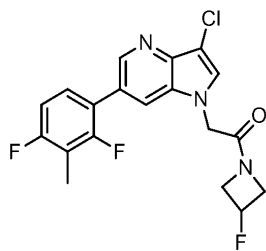
[2061]

[2062]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 429.1; m/z 실측치, 430.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.60 (t,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.22 – 8.20 (m, 1H), 7.98 – 7.93 (m, 1H), 7.89 – 7.83 (m, 2H), 7.58 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.08 (d,  $J$  = 3.5 Hz, 2H), 4.63 – 4.52 (m, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 1H), 4.29 – 4.18 (m, 1H), 4.02 – 3.91 (m, 1H).

[2063]

실시예 539: 2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



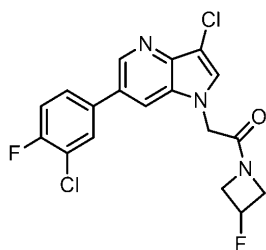
[2064]

[2065]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 393.1;  $m/z$  실측치, 394.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.53 (d,  $J = 2.1$  Hz, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.50 – 7.42 (m, 1H), 7.22 (t,  $J = 8.9$  Hz, 1H), 5.57 – 5.36 (m, 1H), 5.06 (d,  $J = 4.1$  Hz, 2H), 4.63 – 4.50 (m, 1H), 4.42 – 4.17 (m, 2H), 4.06 – 3.89 (m, 1H), 2.25 (s, 3H).

[2066]

실시예 540:  
2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



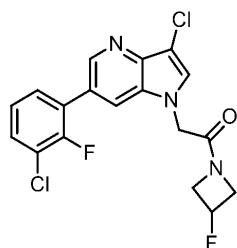
[2067]

[2068]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}Cl_2F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.0;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.28 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.00 (dd,  $J = 7.1, 2.3$  Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.81 – 7.77 (m, 1H), 7.61 – 7.52 (m, 1H), 5.57 – 5.39 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 2.1$  Hz, 2H), 4.64 – 4.52 (m, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.20 (m, 1H), 4.03 – 3.90 (m, 1H).

[2069]

실시예 541:  
2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

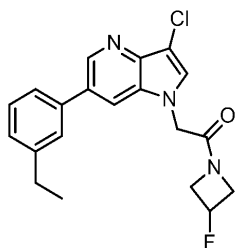


[2070]

[2071]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}Cl_2F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.0;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.59 (t,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 8.19 (t,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 7.86 (s, 1H), 7.69 – 7.63 (m, 1H), 7.61 – 7.56 (m, 1H), 7.42 – 7.35 (m, 1H), 5.55 – 5.38 (m, 1H), 5.07 (d,  $J = 3.6$  Hz, 2H), 4.63 – 4.52 (m, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 1H), 4.29 – 4.19 (m, 1H), 4.02 – 3.90 (m, 1H).

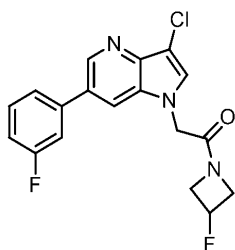
[2072] 실시예 542: 2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2073]

[2074] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}ClFN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 371.1; m/z 실측치, 372.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.20 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.60 – 7.52 (m, 2H), 7.43 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.26 (d,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 5.56 – 5.39 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 3.0$  Hz, 2H), 4.63 – 4.53 (m, 1H), 4.41 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.20 (m, 1H), 4.03 – 3.90 (m, 1H), 2.71 (q,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 1.26 (t,  $J = 7.6$  Hz, 3H).

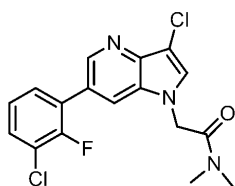
[2075] 실시예 543: 2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2076]

[2077] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1; m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.78 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.29 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.66 – 7.61 (m, 2H), 7.59 – 7.53 (m, 1H), 7.28 – 7.20 (m, 1H), 5.57 – 5.39 (m, 1H), 5.08 (d,  $J = 2.3$  Hz, 2H), 4.64 – 4.53 (m, 1H), 4.40 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.20 (m, 1H), 4.04 – 3.91 (m, 1H).

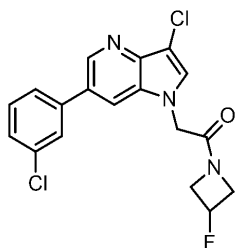
[2078] 실시예 544: 2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2079]

[2080] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}Cl_2FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 365.0; m/z 실측치, 366.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.55 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.08 (t,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.57 – 7.48 (m, 2H), 7.34 – 7.26 (m, 1H), 5.28 (s, 2H), 3.18 (s, 3H), 2.97 (s, 3H).

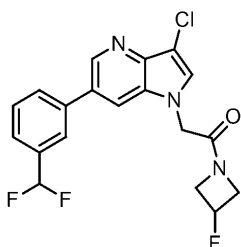
[2081] 실시예 545: 2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2082]

[2083] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.0; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.76 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.30 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.84 (t,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.82 (s, 1H), 7.78 – 7.73 (m, 1H), 7.55 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.49 – 7.45 (m, 1H), 5.56 – 5.39 (m, 1H), 5.09 (d,  $J = 2.0$  Hz, 2H), 4.64 – 4.53 (m, 1H), 4.42 – 4.30 (m, 1H), 4.30 – 4.20 (m, 1H), 4.04 – 3.92 (m, 1H).

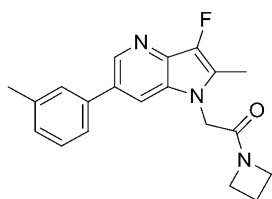
[2084] 실시예 546: 2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2085]

[2086] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 393.1; m/z 실측치, 394.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.76 (s, 1H), 8.28 (s, 1H), 7.96 – 7.92 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 7.73 – 7.56 (m, 2H), 7.30 – 6.95 (m, 1H), 5.60 – 5.36 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 4.66 – 4.50 (m, 1H), 4.43 – 4.17 (m, 2H), 4.05 – 3.89 (m, 1H).

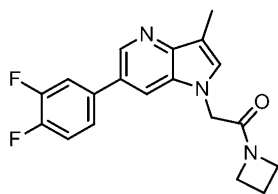
[2087] 실시예 547: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-2-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2088]

[2089] ACN (0.63 mL) 중의 화합물 1-(아제티딘-1-일)-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 (실시예 41,104 mg, 0.32 mmol) 및 셀렉트플루오르® (135 mg, 0.38 mmol)의 용액에, 피리딘 (0.18 mL, 2.34 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 12시간 동안 교반하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (FCC,  $SiO_2$ , 헥산 중의 50 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (6.4 mg, 6%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CD_3OD$ )  $\delta$  8.52 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.01 (dd,  $J = 2.4, 1.8$  Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.48 – 7.44 (m, 1H), 7.36 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.23 – 7.18 (m, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.32 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.8$  Hz, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.41 (d,  $J = 2.0$  Hz, 3H), 2.41 – 2.34 (m, 2H).

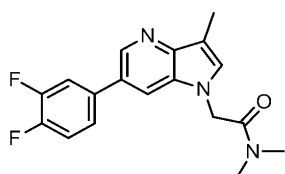
[2090] 실시예 548: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2091]

[2092] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (s, 1H), 7.83 (s, 1H), 7.47 – 7.37 (m, 1H), 7.37 – 7.29 (m, 1H), 7.29 – 7.18 (m, 2H), 4.77 (s, 2H), 4.09 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 4.00 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.38 – 2.21 (m, 2H).

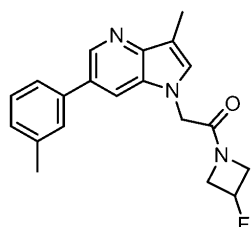
[2093] 실시예 549: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2094]

[2095] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1; m/z 실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.50 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 7.41 – 7.21 (m, 4H), 5.09 (s, 2H), 3.14 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

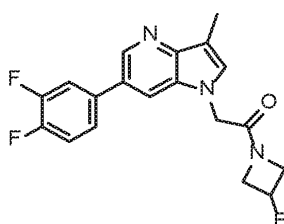
[2096] 실시예 550: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2097]

[2098] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 338.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.02 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.57 – 7.47 (m, 2H), 7.43 – 7.34 (m, 2H), 7.19 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 5.58 – 5.44 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.61 – 4.42 (m, 1H), 4.37 – 4.14 (m, 2H), 4.04 – 3.86 (m, 1H), 2.41 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

[2099] 실시예 551: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.

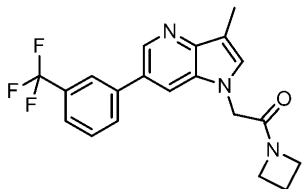


[2100]

[2101] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;

m/z 실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.65 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.10 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.89 – 7.79 (m, 1H), 7.64 – 7.50 (m, 2H), 7.40 (s, 1H), 5.59 – 5.30 (m, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.61 – 4.43 (m, 1H), 4.35 – 4.15 (m, 2H), 4.04 – 3.87 (m, 1H), 2.30 (s, 3H).

[2102] 실시예 552: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

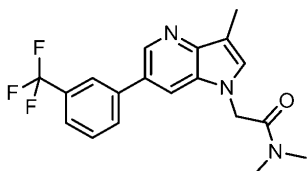


[2103]

[2104] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1;

m/z 실측치, 374.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.71 (s, 1H), 8.25 (br. s, 1H), 7.89 – 7.78 (m, 2H), 7.76 – 7.57 (m, 2H), 7.45 (s, 1H), 4.89 (s, 2H), 4.34 – 4.22 (m, 2H), 4.13 (t,  $J$  = 7.8 Hz, 2H), 2.59 (s, 3H), 2.50 – 2.32 (m, 2H).

[2105] 실시예 553: N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

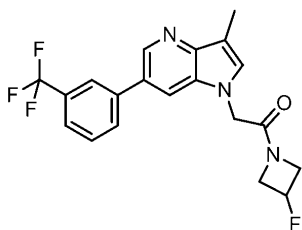


[2106]

[2107] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;

m/z 실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.67 (s, 1H), 7.86 – 7.74 (m, 3H), 7.67 – 7.54 (m, 2H), 7.22 (s, 1H), 4.98 (s, 2H), 3.15 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.47 (s, 3H).

[2108] 실시예 554: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

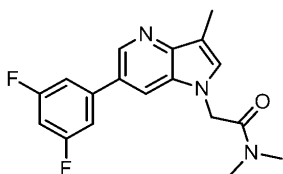


[2109]

[2110] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;

m/z 실측치, 392.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.17 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.10 – 7.99 (m, 2H), 7.74 (d,  $J$  = 4.7 Hz, 2H), 7.42 (s, 1H), 5.59 – 5.28 (m, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.61 – 4.42 (m, 1H), 4.37 – 4.15 (m, 2H), 4.04 – 3.87 (m, 1H), 2.31 (s, 3H).

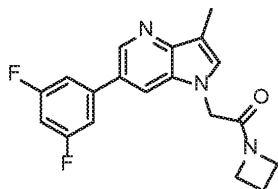
[2111] 실시예 555: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2112]

[2113] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 329.1;  $m/z$  실측치, 330.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.18 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.59 – 7.48 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 7.28 – 7.15 (m, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

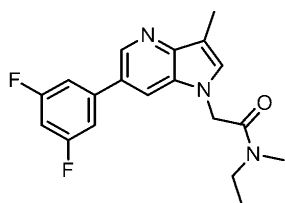
[2114] 실시예 556: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2115]

[2116] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1;  $m/z$  실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.71 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 8.18 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.60 – 7.49 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.30 – 7.15 (m, 1H), 4.94 (s, 2H), 4.20 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 3.90 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.34 – 2.19 (m, 5H).

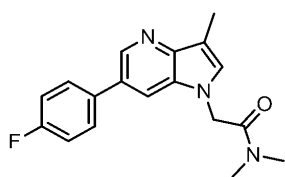
[2117] 실시예 557: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드.



[2118]

[2119] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;  $m/z$  실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.70 (s, 1H), 8.23 – 8.07 (m, 1H), 7.60 – 7.46 (m, 2H), 7.45 – 7.35 (m, 1H), 7.27 – 7.15 (m, 1H), 5.20 (s, 0.8H), 5.17 (s, 1.2H), 3.48 (q,  $J = 7.0$  Hz, 1.2H), 3.32 – 3.20 (m, 0.8H), 3.09 (s, 1.8H), 2.82 (s, 1.2H), 2.30 (s, 3H), 1.24 (t,  $J = 7.0$  Hz, 1.2H), 1.03 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.8H).

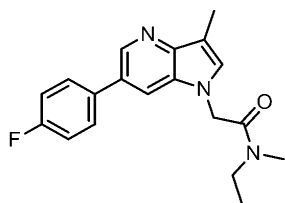
[2120] 실시예 558: 2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2121]

[2122] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1;  $m/z$  실측치, 312.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 8.02 (d,  $J = 1.9$  Hz, 1H), 7.80 – 7.70 (m, 2H), 7.39 – 7.27 (m, 3H), 5.18 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

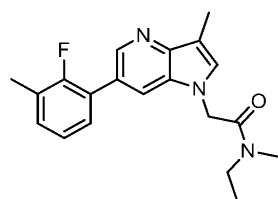
[2123] 실시예 559: N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[2124]

[2125] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.65 (s, 1H), 7.65 – 7.51 (m, 3H), 7.21 – 7.09 (m, 3H), 4.89 (d,  $J$  = 9.2 Hz, 2H), 3.53 – 3.38 (m, 2H), 3.07 – 2.90 (m, 3H), 2.44 (s, 3H), 1.29 – 1.05 (m, 3H).

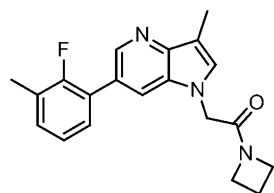
[2126] 실시예 560: N-에틸-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[2127]

[2128] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.2; m/z 실측치, 340.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.44 (s, 1H), 7.93 – 7.84 (m, 1H), 7.42 – 7.26 (m, 3H), 7.25 – 7.16 (m, 1H), 5.18 (s, 0.8H), 5.14 (s, 1.2H), 3.45 (d,  $J$  = 7.1 Hz, 1.2H), 3.32 – 3.21 (m, 0.8H), 3.06 (s, 1.8H), 2.81 (s, 1.2H), 2.32 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 1.20 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 1.2H), 1.01 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 1.8H).

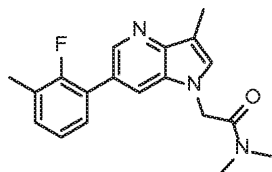
[2129] 실시예 561: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2130]

[2131] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 337.2; m/z 실측치, 337.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.45 (s, 1H), 7.91 (s, 1H), 7.42 – 7.27 (m, 3H), 7.22 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 4.91 (s, 2H), 4.18 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.36 – 2.17 (m, 8H).

[2132] 실시예 562: 2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



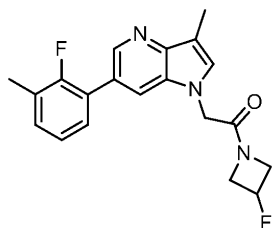
[2133]

[2134] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.47 – 8.42 (m, 1H), 7.92 – 7.88 (m, 1H), 7.42



— 7.26 (m, 3H), 7.26 — 7.16 (m, 1H), 5.17 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.35 — 2.27 (m, 6H).

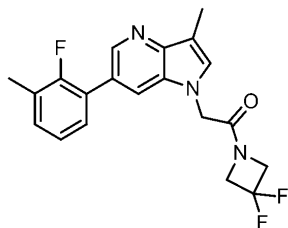
[2135] 실시예 563: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2136]

[2137] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (s, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.38 — 7.10 (m, 4H), 5.33 — 5.02 (m, 1H), 4.77 (s, 2H), 4.41 — 4.06 (m, 2H), 3.91 — 3.74 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.36 (s, 3H).

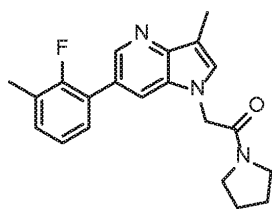
[2138] 실시예 564: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2139]

[2140] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 373.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.48 — 8.44 (m, 1H), 7.97 — 7.93 (m, 1H), 7.42 — 7.27 (m, 3H), 7.26 — 7.18 (m, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.70 (t,  $J = 12.5$  Hz, 2H), 4.35 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 2.36 — 2.26 (m, 6H).

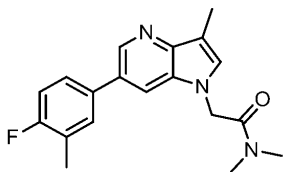
[2141] 실시예 565: 2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2142]

[2143] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 351.2; m/z 실측치, 352.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.60 (s, 1H), 7.75 (s, 1H), 7.49 — 7.06 (m, 4H), 4.83 (s, 2H), 3.51 (t,  $J = 6.9$  Hz, 2H), 3.42 (t,  $J = 6.7$  Hz, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.35 (s, 3H), 2.06 — 1.95 (m, 2H), 1.92 — 1.82 (m, 2H).

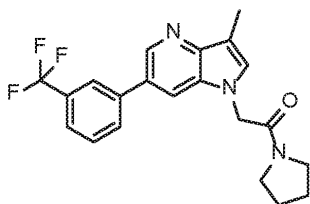
[2144] 실시예 566: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2145]

[2146] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.58 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.01 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.67 – 7.60 (m, 1H), 7.59 – 7.51 (m, 1H), 7.33 (s, 1H), 7.25 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.29 (s, 3H).

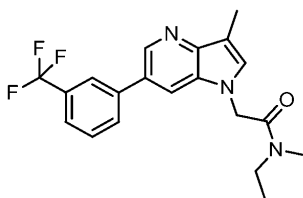
[2147] 실시예 567: 2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-에탄온.



[2148]

[2149] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{20}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 387.2; m/z 실측치, 388.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.68 (s, 1H), 7.91 – 7.76 (m, 2H), 7.70 (s, 1H), 7.65 – 7.50 (m, 2H), 7.20 (s, 1H), 4.85 (s, 2H), 3.64 – 3.41 (m, 4H), 2.43 (s, 3H), 2.15 – 1.97 (m, 2H), 1.97 – 1.81 (m, 2H).

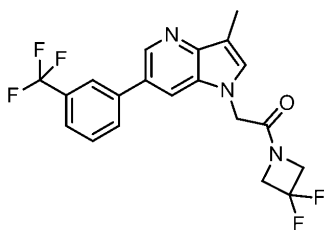
[2150] 실시예 568: N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[2151]

[2152] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{20}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 375.2; m/z 실측치, 376.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.68 (s, 1H), 7.88 – 7.76 (m, 2H), 7.69 – 7.51 (m, 3H), 7.18 (s, 1H), 4.92 (d,  $J$  = 8.7 Hz, 2H), 3.59 – 3.34 (m, 2H), 3.08 (s, 1.5H), 2.98 (s, 1.5H), 2.44 (s, 3H), 1.25 (t,  $J$  = 7.2 Hz, 1.5H), 1.14 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 1.5H).

[2153] 실시예 569: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

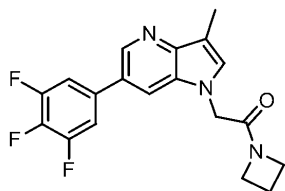


[2154]

[2155] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{16}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 409.1;

m/z 실측치, 410.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.75 (s, 1H), 7.89 – 7.78 (m, 2H), 7.72 – 7.57 (m, 3H), 7.16 (s, 1H), 4.85 (s, 2H), 4.39 (t,  $J$  = 12.0 Hz, 2H), 4.00 (t,  $J$  = 11.5 Hz, 2H), 2.46 (s, 3H).

[2156] 실시예 570: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

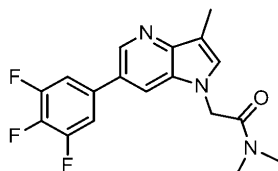


[2157]

[2158] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;

m/z 실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 8.16 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.79 (dd,  $J$  = 9.6, 6.8 Hz, 2H), 7.42 (s, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.19 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 3.90 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 2.38 – 2.15 (m, 5H).

[2159] 실시예 571: N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

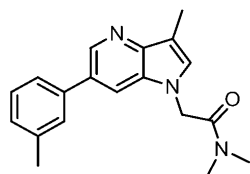


[2160]

[2161] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;

m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 8.15 (d,  $J$  = 1.5 Hz, 1H), 7.77 (dd,  $J$  = 9.5, 6.8 Hz, 2H), 7.41 (d,  $J$  = 17.8 Hz, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.12 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

[2162] 실시예 572: N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

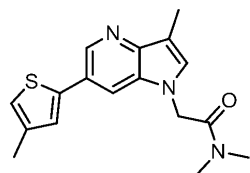


[2163]

[2164] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.2; m/z

실측치, 308.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.57 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.42 – 7.18 (m, 5H), 5.06 (s, 2H), 3.16 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.42 (s, 3H).

[2165] 실시예 573: N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.

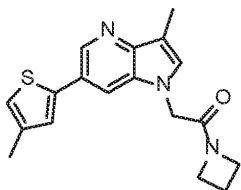


[2166]

[2167] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 313.1;

m/z 실측치, 314.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 1.6 Hz, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.14 (d,  $J$  = 3.8 Hz, 2H), 6.88 (s, 1H), 4.90 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

[2168] 실시예 574: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

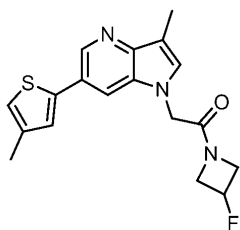


[2169]

[2170] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;

m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.70 (s, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.14 (s, 1H), 6.89 (s, 1H), 4.72 (s, 2H), 4.09 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.85 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.31 (s, 3H), 2.27 – 2.21 (m, 2H).

[2171] 실시예 575: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.

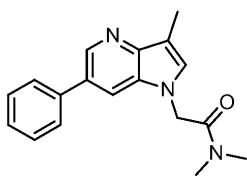


[2172]

[2173] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 343.1;

m/z 실측치, 344.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.76 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.65 (s, 1H), 7.18 (s, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.90 (s, 1H), 5.29 – 5.04 (m, 1H), 4.76 (s, 2H), 4.40 – 4.09 (m, 2H), 3.82 (dd,  $J$  = 21.7, 4.4 Hz, 2H), 2.42 (s, 3H), 2.32 (s, 3H).

[2174] 실시예 576: N,N-다이메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드.

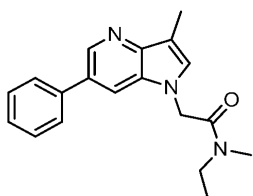


[2175]

[2176] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 293.2; m/z

실측치, 294.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.04 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.77 – 7.70 (m, 2H), 7.49 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.38 (d,  $J$  = 7.3 Hz, 1H), 7.33 (s, 1H), 5.18 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

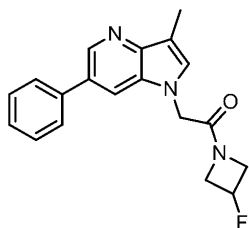
[2177] 실시예 577: N-에틸-N-메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드.



[2178]

[2179] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 307.2; m/z 실측치, 308.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.62 (d,  $J$  = 2.0 Hz, 1H), 8.01 (dd,  $J$  = 9.3, 2.0 Hz, 1H), 7.72 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.49 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.42 – 7.30 (m, 2H), 5.20 (s, 0.8H), 5.16 (s, 1.2H), 3.53 – 3.41 (m, 0.8H), 3.33 – 3.26 (m, 1.2H), 3.08 (s, 1.8H), 2.82 (s, 1.2H), 2.30 (s, 3H), 1.22 (t,  $J$  = 7.0 Hz, 1.2H), 1.02 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 1.8H).

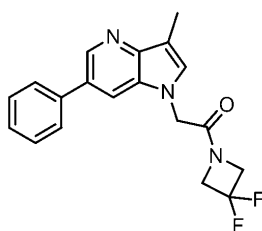
[2180] 실시예 578: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[2181]

[2182] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.06 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.77 – 7.68 (m, 2H), 7.57 – 7.46 (m, 2H), 7.43 – 7.33 (m, 2H), 5.59 – 5.29 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.61 – 4.42 (m, 1H), 4.38 – 4.15 (m, 2H), 4.05 – 3.85 (m, 1H), 2.30 (s, 3H).

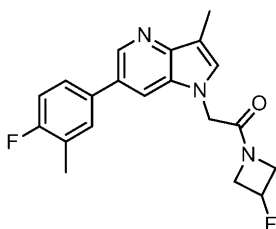
[2183] 실시예 579: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[2184]

[2185] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.63 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.06 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 7.73 (d,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.50 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 2H), 7.43 – 7.32 (m, 2H), 5.07 (s, 2H), 4.71 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 4.36 (t,  $J$  = 12.7 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H).

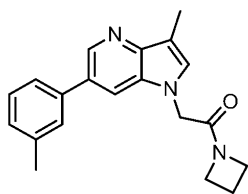
[2186] 실시예 580: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2187]

[2188] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.60 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.40 (d,  $J$  = 6.2 Hz, 2H), 7.23 (s, 1H), 7.10 (t,  $J$  = 8.8 Hz, 1H), 5.27 – 5.01 (m, 1H), 5.01 – 4.76 (m, 2H), 4.47 – 3.95 (m, 4H), 2.44 (s, 3H), 2.35 (s, 3H).

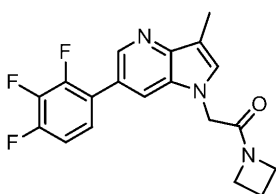
[2189] 실시예 581: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(*m*-톨릴)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온.



[2190]

[2191] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 319.2;  $m/z$  실측치, 320.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.61 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 8.01 (d,  $J = 1.7$  Hz, 1H), 7.53 (d,  $J = 12.9$  Hz, 2H), 7.37 (d,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 7.19 (d,  $J = 7.4$  Hz, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.18 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.89 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.41 (s, 3H), 2.33 – 2.17 (m, 5H).

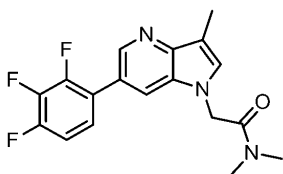
[2192] 실시예 582: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]에탄온.



[2193]

[2194] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.47 (s, 1H), 7.97 (s, 1H), 7.56 – 7.39 (m, 3H), 4.92 (s, 2H), 4.19 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.89 (t,  $J = 7.7$  Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.28 – 2.18 (m, 2H).

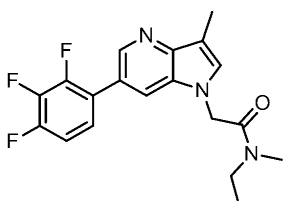
[2195] 실시예 583: *N,N*-다이메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]아세트아미드.



[2196]

[2197] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 347.1;  $m/z$  실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.46 (s, 1H), 7.96 (s, 1H), 7.54 – 7.37 (m, 3H), 5.18 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.31 (s, 3H).

[2198] 실시예 584: *N*-에틸-*N*-메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-*b*]피리딘-1-일]아세트아미드.

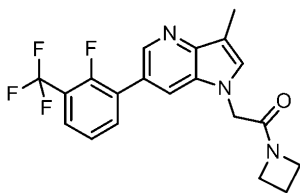


[2199]

[2200] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;  $m/z$  실측치, 362.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.46 (s, 1H), 7.99 – 7.90 (m, 1H), 7.53 – 7.38 (m, 3H), 5.19 (s, 0.8H), 5.15 (s, 1.2H), 3.45 (q,  $J = 7.0$  Hz, 0.8H), 3.30 – 3.25 (m, 1.2 H), 3.06 (s,

1.8H), 2.81 (s, 1.2H), 2.31 (s, 3H), 1.21 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.2H), 1.01 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.8H).

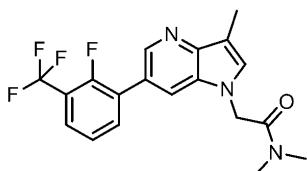
[2201] 실시예 585: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2202]

[2203] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;  $m/z$  실측치, 392.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.49 (s, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.93 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.82 (t,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 7.56 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.45 (s, 1H), 4.93 (s, 2H), 4.19 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.89 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.29 – 2.21 (m, 2H).

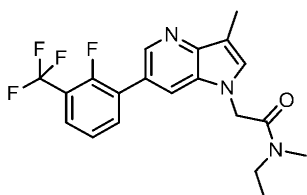
[2204] 실시예 586: 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2205]

[2206] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1;  $m/z$  실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.45 (m, 1H), 8.03 – 7.99 (m, 1H), 7.92 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.81 (t,  $J = 7.2$  Hz, 1H), 7.54 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.41 (s, 1H), 5.19 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.31 (s, 3H).

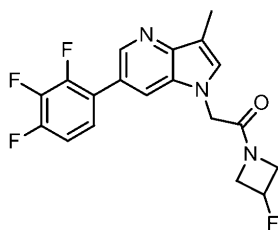
[2207] 실시예 587: N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[2208]

[2209] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 393.1;  $m/z$  실측치, 394.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.47 (s, 1H), 8.03 – 7.96 (m, 1H), 7.92 (t,  $J = 7.5$  Hz, 1H), 7.81 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1H), 7.54 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.47 – 7.39 (m, 1H), 5.20 (s, 0.8H), 5.17 (s, 1.2H), 3.45 (q,  $J = 7.1$  Hz, 0.8H), 3.33 – 3.25 (m, 1.2H), 3.06 (s, 1.8H), 2.81 (s, 1.2H), 2.31 (s, 3H), 1.21 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.2H), 1.01 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.8H).

[2210] 실시예 588: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



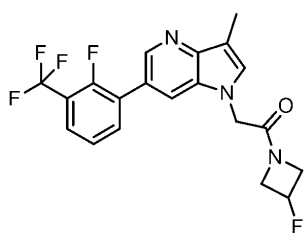
[2211]

[2212]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1;  $m/z$  실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.51 – 8.43 (m, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.52 – 7.40 (m, 3H), 5.59 – 5.30 (m, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.62 – 4.41 (m, 1H), 4.40 – 4.12 (m, 2H), 4.04 – 3.83 (m, 1H), 2.31 (s, 3H).

[2213]

실시예 589: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



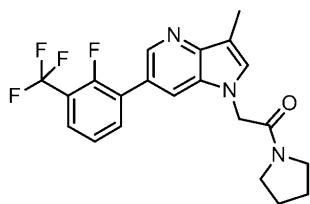
[2214]

[2215]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{16}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 409.1;  $m/z$  실측치, 410.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.52 – 8.46 (m, 1H), 8.05 – 8.00 (m, 1H), 7.97 – 7.89 (m, 1H), 7.87 – 7.77 (m, 1H), 7.55 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.46 – 7.43 (m, 1H), 5.58 – 5.29 (m, 1H), 5.00 (s, 2H), 4.61 – 4.41 (m, 1H), 4.38 – 4.12 (m, 2H), 4.04 – 3.86 (m, 1H), 2.31 (s, 3H).

[2216]

실시예 590: 2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



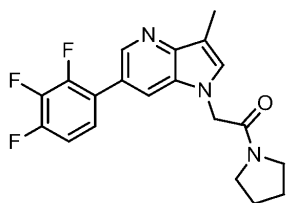
[2217]

[2218]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{19}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 405.1;  $m/z$  실측치, 406.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.45 (m, 1H), 8.04 – 8.00 (m, 1H), 7.92 (t,  $J = 7.7$  Hz, 1H), 7.82 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1H), 7.55 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.45 – 7.42 (m, 1H), 5.10 (s, 2H), 3.56 (t,  $J = 6.8$  Hz, 2H), 3.34 – 3.25 (m, 2H), 2.32 (s, 3H), 2.01 – 1.89 (m, 2H), 1.85 – 1.72 (m, 2H).



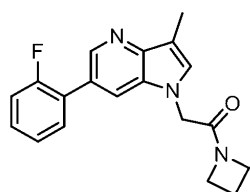
[2219] 실시예 591: 2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2220]

[2221] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 374.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.48 – 8.43 (m, 1H), 8.00 – 7.96 (m, 1H), 7.51 – 7.38 (m, 3H), 5.09 (s, 2H), 3.56 (t,  $J$  = 6.8 Hz, 2H), 3.34 – 3.25 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.00 – 1.89 (m, 2H), 1.86 – 1.72 (m, 2H).

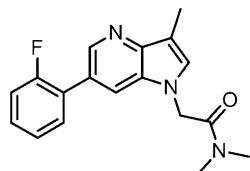
[2222] 실시예 592: 1-(아세트딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2223]

[2224] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 323.1; m/z 실측치, 324.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.44 (m, 1H), 7.96 – 7.91 (m, 1H), 7.63 – 7.55 (m, 1H), 7.49 – 7.27 (m, 4H), 4.91 (s, 2H), 4.19 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 3.89 (t,  $J$  = 7.7 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.29 – 2.18 (m, 2H).

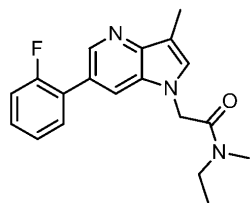
[2225] 실시예 593: 2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2226]

[2227] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 311.1; m/z 실측치, 312.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.53 – 8.46 (m, 1H), 8.02 (s, 1H), 7.63 – 7.51 (m, 1H), 7.50 – 7.39 (m, 2H), 7.39 – 7.30 (m, 2H), 5.19 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.31 (s, 3H).

[2228] 실시예 594: N-에틸-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.

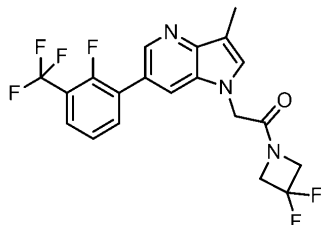


[2229]

[2230] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{20}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 325.2; m/z 실측치, 326.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.49 – 8.44 (m, 1H), 7.91 (d,  $J$  = 7.9 Hz, 1H),

7.62 – 7.53 (m, 1H), 7.49 – 7.29 (m, 4H), 5.18 (s, 0.8H), 5.15 (s, 1.2H), 3.45 (q,  $J = 7.2$  Hz, 0.8H), 3.33 (s, 1.2H), 3.06 (s, 1.8H), 2.81 (s, 1.2H), 2.31 (s, 3H), 1.20 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.2H), 1.01 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.8H).

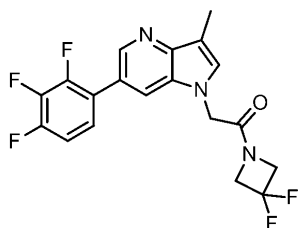
[2231] 실시예 595: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2232]

[2233] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{15}F_6N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 427.1;  $m/z$  실측치, 428.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.51 – 8.47 (m, 1H), 8.06 – 8.01 (m, 1H), 7.93 (t,  $J = 7.6$  Hz, 1H), 7.82 (t,  $J = 7.3$  Hz, 1H), 7.55 (t,  $J = 7.9$  Hz, 1H), 7.44 (s, 1H), 5.07 (s, 2H), 4.71 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 4.35 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 2.32 (s, 3H).

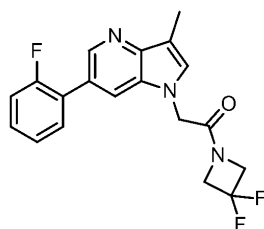
[2234] 실시예 596: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2235]

[2236] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 395.1;  $m/z$  실측치, 396.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.50 – 8.45 (m, 1H), 8.01 – 7.98 (m, 1H), 7.52 – 7.40 (m, 3H), 5.06 (s, 2H), 4.71 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 4.35 (t,  $J = 12.7$  Hz, 2H), 2.31 (s, 3H).

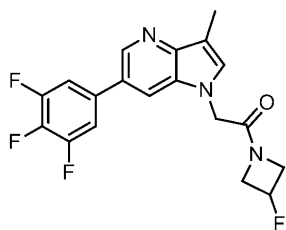
[2237] 실시예 597: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2238]

[2239] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1;  $m/z$  실측치, 360.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.51 – 8.46 (m, 1H), 8.00 – 7.93 (m, 1H), 7.63 – 7.54 (m, 1H), 7.51 – 7.29 (m, 4H), 5.06 (s, 2H), 4.71 (t,  $J = 12.4$  Hz, 2H), 4.35 (t,  $J = 12.7$  Hz, 2H), 2.31 (s, 3H).

[2240] 실시예 598: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



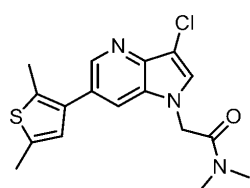
[2241]

[2242]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.70 (s, 1H), 8.16 (s, 1H), 7.95 – 7.68 (m, 2H), 7.42 (s, 1H), 5.82 – 5.17 (m, 1H), 4.99 (s, 2H), 4.65 – 4.40 (m, 1H), 4.40 – 4.11 (m, 2H), 4.11 – 3.76 (m, 1H), 2.30 (s, 3H).

[2243]

실시예 599: 2-[3-클로로-6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



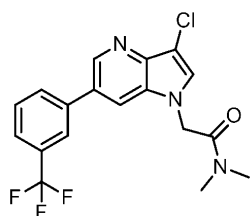
[2244]

[2245]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{18}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 347.1; m/z 실측치, 348.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.56 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.50 (d,  $J$  = 1.7 Hz, 1H), 7.32 (s, 1H), 6.71 (s, 1H), 4.87 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 3.00 (s, 3H), 2.46 (s, 3H), 2.43 (s, 3H).

[2246]

실시예 600: 2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



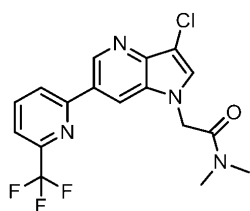
[2247]

[2248]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{15}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 381.1; m/z 실측치, 382.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.75 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.84 – 7.81 (m, 1H), 7.81 – 7.76 (m, 1H), 7.69 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 7.67 – 7.55 (m, 2H), 7.36 (s, 1H), 4.95 (s, 2H), 3.15 (s, 3H), 3.01 (s, 3H).

[2249]

실시예 601: 2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



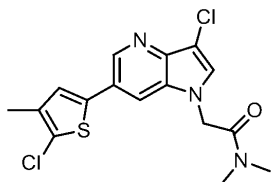
[2250]

[2251]

표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}ClF_3N_4O$ 에 대한 질량 계산치, 382.1;

m/z 실측치, 383.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 9.07 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 8.37 (d, *J* = 1.8 Hz, 1H), 8.01 (d, *J* = 8.0 Hz, 1H), 7.95 (t, *J* = 7.8 Hz, 1H), 7.66 – 7.60 (m, 1H), 7.42 (s, 1H), 4.99 (s, 2H), 3.17 (s, 3H), 3.01 (s, 3H).

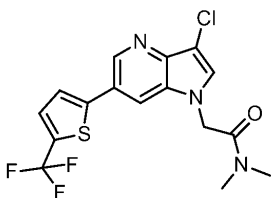
[2252] 실시예 602: 2-[3-클로로-6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2253]

[2254] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>16</sub>H<sub>15</sub>Cl<sub>2</sub>N<sub>3</sub>OS에 대한 질량 계산치, 367.0; m/z 실측치, 368.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 8.63 (d, *J* = 1.9 Hz, 1H), 8.12 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.41 (s, 1H), 5.23 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 2.85 (s, 3H), 2.19 (s, 3H).

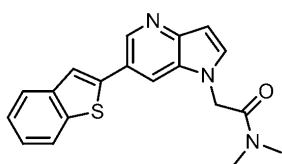
[2255] 실시예 603: 2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2256]

[2257] 표제 화합물을 실시예 146과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>16</sub>H<sub>13</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>3</sub>OS에 대한 질량 계산치, 387.0; m/z 실측치, 388.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (500 MHz, DMSO-*d*<sub>6</sub>) δ 8.79 (d, *J* = 1.9 Hz, 1H), 8.30 (d, *J* = 1.9 Hz, 1H), 7.80 (s, 1H), 7.79 – 7.74 (m, 1H), 7.69 – 7.64 (m, 1H), 5.26 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

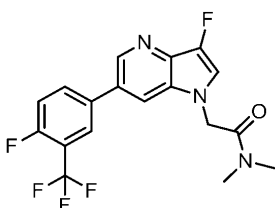
[2258] 실시예 604: 2-[6-(벤조티오펜-2-일)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2259]

[2260] 표제 화합물을 실시예 106과 유사한 방법으로 제조하였다. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) δ 8.85 (d, *J* = 2.0 Hz, 1H), 7.82 (d, *J* = 7.9 Hz, 1H), 7.80 – 7.74 (m, 2H), 7.56 (s, 1H), 7.40 – 7.28 (m, 3H), 6.78 (d, *J* = 3.3 Hz, 1H), 4.92 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 3.00 (s, 3H).

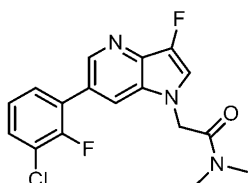
[2261] 실시예 605: 2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2262]

[2263] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{14}F_5N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 383.1; m/z 실측치, 384.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.30 – 8.26 (m, 1H), 8.17 – 8.04 (m, 2H), 7.72 – 7.63 (m, 2H), 5.22 (s, 2H), 3.10 (s, 3H), 2.85 (s, 3H).

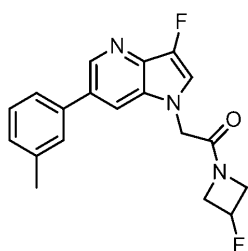
[2264] 실시예 606: 2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2265]

[2266] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{14}ClF_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 349.1; m/z 실측치, 350.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.54 – 8.51 (m, 1H), 8.14 (s, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.67 – 7.62 (m, 1H), 7.59 – 7.54 (m, 1H), 7.40 – 7.34 (m, 1H), 5.21 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H).

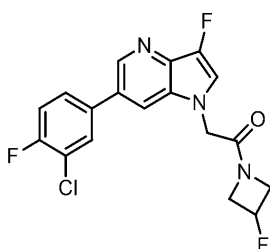
[2267] 실시예 607: 1-(3-플루오로아세트티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2268]

[2269] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.68 (d,  $J$  = 1.8 Hz, 1H), 8.16 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.54 (d,  $J$  = 8.1 Hz, 1H), 7.40 (t,  $J$  = 7.6 Hz, 1H), 7.22 (d,  $J$  = 7.5 Hz, 1H), 5.58 – 5.35 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 4.64 – 4.47 (m, 1H), 4.40 – 4.16 (m, 2H), 4.04 – 3.89 (m, 1H), 2.41 (s, 3H).

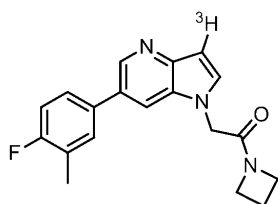
[2270] 실시예 608: 2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아세트티딘-1-일)에탄온.



[2271]

[2272] 표제 화합물을 실시예 92와 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 379.1; m/z 실측치, 380.0  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.72 (d,  $J$  = 1.9 Hz, 1H), 8.25 (t,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 8.00 (dd,  $J$  = 7.1, 2.3 Hz, 1H), 7.84 – 7.74 (m, 1H), 7.68 (d,  $J$  = 2.2 Hz, 1H), 7.57 (t,  $J$  = 9.0 Hz, 1H), 5.58 – 5.35 (m, 1H), 5.02 (s, 2H), 4.63 – 4.48 (m, 1H), 4.40 – 4.15 (m, 2H), 4.07 – 3.87 (m, 1H).

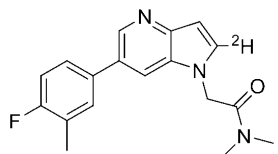
[2273] 실시예 609: 1-(아제티딘-1-일)-2-(3-<sup>3</sup>H)-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온.



[2274]

[2275] 표제 화합물을 H<sub>2</sub> 가스 대신에 삼중 수소 가스를 사용하여, 실시예 349와 유사한 방법으로 제조하였다. <sup>3</sup>H NMR (300 MHz, CD<sub>3</sub>OD) δ 6.97 (s, 1H).

[2276] 실시예 610: 2-[2-듀테리오-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



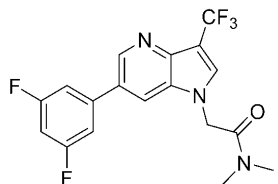
[2277]

[2278] 단계 A: tert-부틸 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-카르복실레이트. DCM (10 mL) 중의 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (500 mg, 2.21 mmol)의 용액에, (Boc)<sub>2</sub>O (0.57 mL, 2.65 mmol) 및 DMAP (27 mg, 0.22 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 얻어진 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 유기층을 합해, 건조시키고, 농축시켜, FCC (헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)로 정제하여, tert-부틸 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-카르복실레이트 (78%, 564 mg)를 얻었다.

[2279] 단계 B: 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-2-듀테로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. -78°C에서 THF 중의 tert-부틸 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-카르복실레이트 (400 mg, 1.23 mmol)의 용액에, tBuLi (2.89 mL, 4.91 mmol, 헥산 중의 1.7 M)를 첨가하여, 반응 혼합물을 15분간 교반하였다. 반응 혼합물에, CD<sub>3</sub>CO<sub>2</sub>D (0.75 mL, 12.3 mmol)를 첨가하여, 반응 혼합물을 실온으로 서서히 가온시켰다. 반응 혼합물을 EtOAc로 희석시켜, 수세하였다. 유기상을 건조시켜, 농축시키고, FCC (헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)로 정제하여, 6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-2-듀테로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (89%, 251 mg)을 얻었다.

[2280] 단계 C: 2-(6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-2-듀테로-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 표제 화합물을 실시예 66과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>17</sub>DFN<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 312.1; m/z 실측치, [M+H]<sup>+</sup>.

[2281] 실시예 611: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2282]

[2283] 단계 A: 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-요오도-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. 실온에서 DMF (10 mL) 중의 6-(3,5-다이플루오로페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (중간체 9, 750 mg, 3.5 mmol)의 용액에, NIS (1.1 g, 4.4 mmol)를 첨가하였다. 용액을 하룻밤 동안 교반하고, 물 (20 mL)을 아침에 첨가하였다. 반응 혼합물을 그대로 실리카 겔 상에서 농축시키고, 정제하여 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc), 표제 화합물 (1.1 g, 97%)을 얻었다. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, DMSO) δ 11.96 (s, 1H), 8.82 – 8.66 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 8.19 – 8.02 (d, J = 2.0

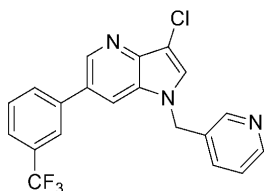
Hz, 1H), 8.02 – 7.80 (d,  $J$  = 2.8 Hz, 1H), 7.70 – 7.45 (m, 2H), 7.33 – 7.14 (m, 1H).

[2284] 단계 B: *tert*-부틸 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-요오도-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-카르복실레이트. DCM (10 mL) 중의 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-요오도-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (1.13 g, 3.2 mmol)의 용액에, DMAP (39 mg, 0.32 mmol), 이어서 BOC 무수물 (0.82 mL, 3.8 mmol)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 1시간 동안 교반하였다. 물 (25 mL) 및 EtOAc (25 mL)를 첨가하였다. 유기물을 추출하고, 합해, 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 정제 (SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (946 mg, 65%)을 얻었다. MS(ESI): C<sub>18</sub>H<sub>15</sub>F<sub>2</sub>IN<sub>2</sub>O<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 456.04;  $m/z$  실측치, 457.05.

[2285] 단계 C: 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘. DMF (5 mL) 중의 *tert*-부틸 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-요오도-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-카르복실레이트 (500 mg, 1.1 mmol)의 용액에, 구리 (208 mg, 3.3 mmol) 및 다이페닐(트라이플루오로메틸)설포늄 트라이플루오로메탄설포네이트 (886 mg, 2.2 mmol)를 첨가하였다. 혼합물을 90°C에서 12시간 동안 환류시켰다. 반응물을 물 (5 mL)로 희석하여, 실리카 겔 상에서 농축시켰다. 정제 (FCC, SiO<sub>2</sub>, 헥산 중의 0 내지 100% EtOAc)에 의해, 표제 화합물 (177mg, 54%)을 얻었다. MS(ESI): C<sub>14</sub>H<sub>7</sub>F<sub>5</sub>N<sub>2</sub>에 대한 질량 계산치, 298.2;  $m/z$  실측치, 299.1.

[2286] 단계 D: 2-(6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 0°C에서 DMF (0.5 mL) 중의 6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 (15 mg, 0.05 mmol)의 용액에, NaH (6.0 mg, 0.15 mmol, 오일 중의 60% 분산액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 30분간 교반한 다음에, 0°C로 냉각시킨 후, DMF (0.5 mL) 중의 1-(아세트아미드-1-일)-2-브로모에탄올 (10 mg, 0.06 mmol)의 용액을 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시켜, 12시간 동안 교반하였다. 물을 첨가하여, 혼합물을 EtOAc로 추출하였다. 합한 유기층을 건조시키고 (MgSO<sub>4</sub>), 여과하여, 감압 하에 농축시켰다. 방법 A에 의한 HPLC 정제에 의해, 표제 화합물 (1.7 mg, 8.8%)을 얻었다. MS (ESI): C<sub>18</sub>H<sub>14</sub>F<sub>5</sub>N<sub>3</sub>O에 대한 질량 계산치, 383.1;  $m/z$  실측치, [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CD<sub>3</sub>OD)  $\delta$  8.82 – 8.50 (d, 1H), 8.34 – 8.15 (d, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.51 – 7.29 (d,  $J$  = 8.4 Hz, 3H), 7.11 – 6.91 (m, 1H), 5.37 (s, 2H), 3.22 (s, 2H), 2.99 (s, 2H).

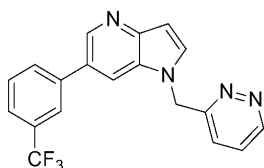
[2287] 실시예 612: 3-클로로-1-(3-피리딜메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘.



[2288]

[2289] 표제 화합물을 단계 C에서 3-클로로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(브로모메틸)피리딘 하이드로브로마이드를 사용하여, 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>20</sub>H<sub>13</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>3</sub>에 대한 질량 계산치, 387.1;  $m/z$  실측치, 388.0 [M+H]<sup>+</sup>. <sup>1</sup>H NMR (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>)  $\delta$  5.40 (s, 2 H) 7.27 – 7.32 (m, 1 H) 7.36 – 7.44 (m, 2 H) 7.56 – 7.69 (m, 2 H) 7.72 (d,  $J$  = 1.85 Hz, 1 H) 7.76 (d,  $J$  = 7.63 Hz, 1 H) 7.80 (s, 1 H) 8.49 – 8.67 (m, 2 H) 8.79 (d,  $J$  = 1.85 Hz, 1 H)

[2290] 실시예 613: 1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘.

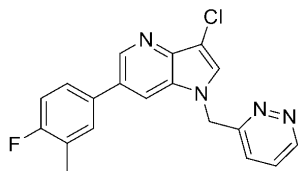


[2291]

[2292] 표제 화합물을 단계 C에서 6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(클로로메틸)피리다진을 사용하여, 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI): C<sub>19</sub>H<sub>13</sub>F<sub>3</sub>N<sub>4</sub>에 대한 질량 계산치, 354.1;  $m/z$

실측치, 355.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  5.77 (s, 2 H) 6.88 (dd,  $J$  =3.24, 0.69 Hz, 1 H) 6.98 (dd,  $J$  =8.55, 1.39 Hz, 1 H) 7.28 - 7.44 (m, 1 H) 7.50 - 7.65 (m, 3 H) 7.72 - 7.84 (m, 3 H) 8.74 (d,  $J$  =1.85 Hz, 1 H) 9.15 (dd,  $J$  =4.97, 1.50 Hz, 1 H)

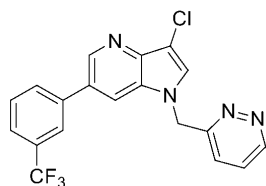
[2293] 실시예 614: 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘.



[2294]

[2295] 표제 화합물을 단계 C에서 3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(클로로메틸)피리다진 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{14}ClFN_4$ 에 대한 질량 계산치, 352.1; m/z 실측치, 353.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  2.35 (d,  $J$  =1.16 Hz, 3 H) 5.71 (s, 2 H) 7.09 (s, 2 H) 7.28 - 7.38 (m, 2 H) 7.39 - 7.45 (m, 1 H) 7.49 (s, 1 H) 7.72 (d,  $J$  =1.62 Hz, 1 H) 8.75 (d,  $J$  =1.16 Hz, 1 H) 9.16 (d,  $J$  =4.86 Hz, 1 H)

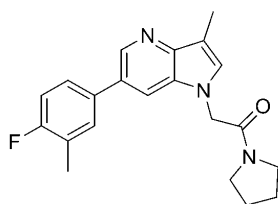
[2296] 실시예 615: 3-클로로-1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘.



[2297]

[2298] 표제 화합물을 단계 C에서 3-클로로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 3-(클로로메틸)피리다진 하이드로클로라이드를 사용하여, 실시예 1과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{12}ClF_3N_4$ 에 대한 질량 계산치, 388.1; m/z 실측치, 389.1  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  5.74 (s, 2 H) 7.09 (dd,  $J$  =8.55, 1.62 Hz, 1 H) 7.45 (dd,  $J$  =8.55, 5.09 Hz, 1 H) 7.54 (s, 1 H) 7.56 - 7.70 (m, 2 H) 7.75 (s, 1 H) 7.78 - 7.86 (m, 2 H) 8.80 (d,  $J$  =1.85 Hz, 1 H) 9.18 (dd,  $J$  =4.85, 1.62 Hz, 1 H)

[2299] 실시예 616: 2-[6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.

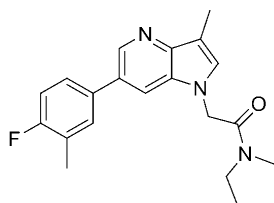


[2300]

[2301] 표제 화합물을 단계 A에서 (4-플루오로페닐)보론산 대신에 (4-플루오로-3-메틸페닐)보론산을 사용하여, 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 351.2; m/z 실측치, 352  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.58 (s, 1H), 8.01 (s, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 7.60 - 7.48 (m, 1H), 7.34 (s, 1H), 7.25 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 3.58 (t,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 3.31 - 3.25 (m, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 2.05 - 1.88 (m, 2H), 1.86 - 1.72 (m, 2H).



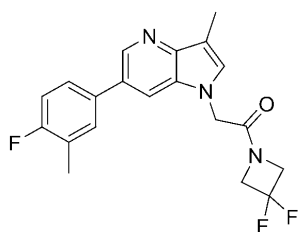
[2302] 실시예 617: N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드.



[2303]

[2304] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{22}FN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 339.2; m/z 실측치, 340  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.58 (s, 1H), 7.98 (d,  $J$  = 5.5 Hz, 1H), 7.63 (d,  $J$  = 6.9 Hz, 1H), 7.59 – 7.48 (m, 1H), 7.35 (d,  $J$  = 8.4 Hz, 1H), 7.25 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.19 (s, 0.8H), 5.15 (s, 1.2H), 3.52 – 3.42 (m, 1.2H), 3.30 – 3.24 (m, 0.8H), 3.08 (s, 1.8H), 2.82 (s, 1.2H), 2.33 (s, 3H), 2.29 (s, 3H), 1.22 (t, 1.2H), 1.02 (t,  $J$  = 7.1 Hz, 1.8H).

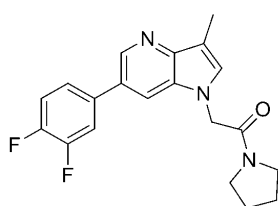
[2305] 실시예 618: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2306]

[2307] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 374  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.60 (s, 1H), 8.03 (s, 1H), 7.64 (d,  $J$  = 7.4 Hz, 1H), 7.60 – 7.51 (m, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.26 (t,  $J$  = 9.1 Hz, 1H), 5.06 (s, 2H), 4.70 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 4.36 (t,  $J$  = 12.5 Hz, 2H), 2.33 (s, 3H), 2.30 (s, 3H).

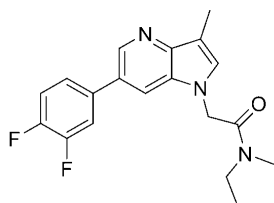
[2308] 실시예 619: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2309]

[2310] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; m/z 실측치, 356  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz, DMSO- $d_6$ )  $\delta$  8.64 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.90 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.47 (m, 2H), 7.38 (s, 1H), 5.09 (s, 2H), 3.58 (t,  $J$  = 6.7 Hz, 2H), 3.30 – 3.21 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.03 – 1.89 (m, 2H), 1.87 – 1.70 (m, 2H).

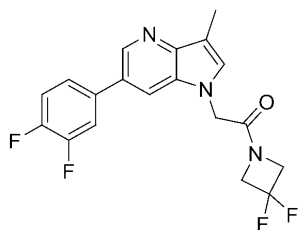
[2311] 실시예 620: 2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드.



[2312]

[2313] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.63 (s, 1H), 8.07 (d,  $J = 8.8$  Hz, 1H), 7.89 – 7.77 (m, 1H), 7.64 – 7.47 (m, 2H), 7.38 (d,  $J = 8.3$  Hz, 1H), 5.19 (s, 0.9H), 5.16 (s, 1.1H), 3.54 – 3.41 (m, 1.1H), 3.30 – 3.24 (m, 0.9H), 3.09 (s, 1.7H), 2.82 (s, 1.3H), 2.29 (s, 3H), 1.23 (t,  $J = 7.0$  Hz, 1.3H), 1.02 (t,  $J = 7.0$  Hz, 1.7H).

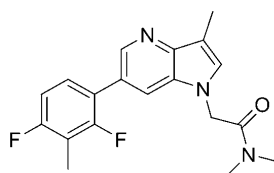
[2314] 실시예 621: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2315]

[2316] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{15}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 377.1; m/z 실측치, 378  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.65 (s, 1H), 8.10 (s, 1H), 7.91 – 7.76 (m, 1H), 7.65 – 7.47 (m, 2H), 7.39 (s, 1H), 5.06 (s, 2H), 4.70 (t,  $J = 12.2$  Hz, 2H), 4.36 (t,  $J = 12.6$  Hz, 2H), 2.30 (s, 3H).

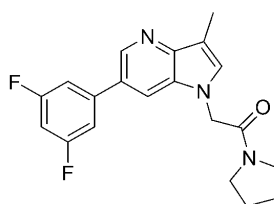
[2317] 실시예 622: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2318]

[2319] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; 343  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.41 (s, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.48 – 7.32 (m, 2H), 7.19 (t,  $J = 8.7$  Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.08 (s, 3H), 2.84 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

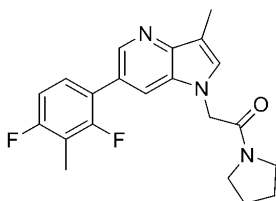
[2320] 실시예 623: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2321]

[2322] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1;  $m/z$  실측치, 356  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.66 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.66 (d,  $J = 1.8$  Hz, 1H), 7.23 – 7.08 (m, 3H), 6.85 – 6.74 (m, 1H), 4.83 (s, 2H), 3.58 – 3.42 (m, 4H), 2.44 (s, 3H), 2.12 – 1.97 (m, 2H), 1.96 – 1.82 (m, 2H).

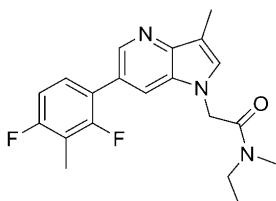
[2323] 실시예 624: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2324]

[2325] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{21}H_{21}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 369.2;  $m/z$  실측치, 370  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.45 (s, 1H), 7.98 (s, 1H), 7.50 – 7.37 (m, 2H), 7.20 (t,  $J = 8.8$  Hz, 1H), 5.09 (s, 2H), 3.56 (t,  $J = 6.7$  Hz, 2H), 3.29 – 3.17 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 2.03 – 1.86 (m, 2H), 1.86 – 1.70 (m, 2H).

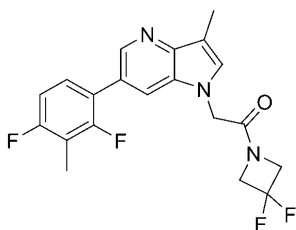
[2326] 실시예 625: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드.



[2327]

[2328] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{21}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 357.2;  $m/z$  실측치, 358  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.42 (s, 1H), 7.89 (d,  $J = 6.9$  Hz, 1H), 7.49 – 7.34 (m, 2H), 7.19 (t,  $J = 8.7$  Hz, 1H), 5.18 (s, 0.8H), 5.14 (s, 1.2H), 3.52 – 3.38 (m, 2H), 3.06 (s, 1.8H), 2.81 (s, 1.2H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (s, 3H), 1.20 (t,  $J = 6.9$  Hz, 1.2H), 1.01 (t,  $J = 7.0$  Hz, 1.8H).

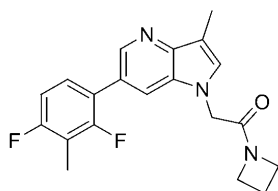
[2329] 실시예 626: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2330]

[2331] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{17}F_4N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 391.1;  $m/z$  실측치, 392  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.44 (s, 1H), 7.93 (s, 1H), 7.54 – 7.34 (m, 2H), 7.20 (s, 1H), 5.05 (s, 2H), 4.82 – 4.61 (m, 2H), 4.45 – 4.24 (m, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.24 (s, 3H).

[2332] 실시예 627: 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



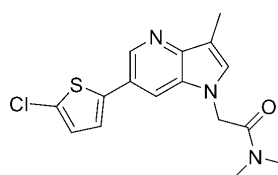
[2333]

[2334]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{19}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 355.1; 356  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.43 (s, 1H), 7.90 (s, 1H), 7.50 – 7.35 (m, 2H), 7.20 (t,  $J$  = 8.7 Hz, 1H), 4.90 (s, 2H), 4.18 (t,  $J$  = 7.4 Hz, 2H), 3.88 (t,  $J$  = 7.5 Hz, 2H), 2.30 (s, 3H), 2.28 – 2.18 (m, 5H).

[2335]

실시예 628: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



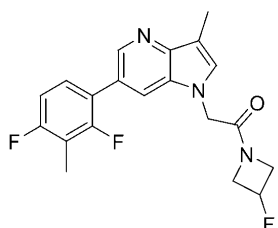
[2336]

[2337]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{16}H_{16}ClN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 333.1; 334  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.56 (s, 1H), 7.99 (s, 1H), 7.40 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 7.36 (s, 1H), 7.18 (d,  $J$  = 3.9 Hz, 1H), 5.16 (s, 2H), 3.11 (s, 3H), 2.86 (s, 3H), 2.27 (s, 3H).

[2338]

실시예 629: 2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



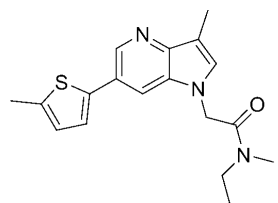
[2339]

[2340]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{20}H_{18}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 373.1; m/z 실측치, 374  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.61 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.38 – 7.27 (m, 1H), 7.15 (s, 1H), 6.96 (t,  $J$  = 8.5 Hz, 1H), 5.42 – 5.21 (m, 1H), 4.76 (s, 2H), 4.42 – 4.07 (m, 2H), 3.99 – 3.74 (m, 2H), 2.45 (s, 3H), 2.28 (s, 3H), 1.60 (s, 3H).

[2341]

실시예 630: N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



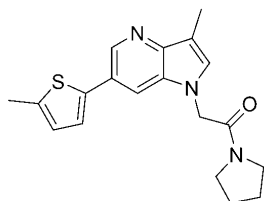
[2342]

[2343]

표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{21}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 327.1; m/z 실측치, 328  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.55 (s, 1H), 7.88 (d,  $J$  = 7.7 Hz, 1H), 7.37 – 7.26 (m, 2H), 6.84 (d,  $J$  = 2.4 Hz, 1H), 5.16 (s, 0.8H), 5.13 (s, 1.2H), 3.52 – 3.40 (m, 2H), 3.08 (s,

1.8H), 2.82 (s, 1.2H), 2.48 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.22 (t,  $J = 7.0$  Hz, 1.2H), 1.02 (t,  $J = 7.1$  Hz, 1.8H).

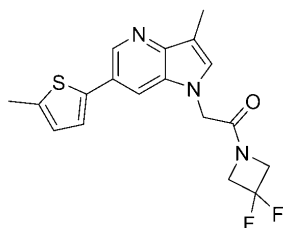
[2344] 실시예 631: 2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온.



[2345]

[2346] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{21}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 339.1;  $m/z$  실측치, 340  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.55 (s, 1H), 7.94 (s, 1H), 7.36 – 7.27 (m, 2H), 6.84 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 5.07 (s, 2H), 3.58 (t,  $J = 6.7$  Hz, 2H), 3.30 – 3.24 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.27 (s, 3H), 1.95 (dd,  $J = 13.3, 6.7$  Hz, 2H), 1.82 (dd,  $J = 13.4, 6.7$  Hz, 2H).

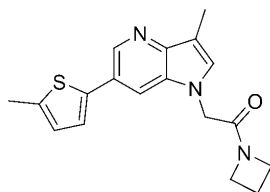
[2347] 실시예 632: 1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2348]

[2349] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{17}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 361.1;  $m/z$  실측치, 362  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.69 (s, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.17 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.77 (d,  $J = 2.5$  Hz, 1H), 4.85 (s, 2H), 4.38 (t,  $J = 11.9$  Hz, 2H), 4.03 (t,  $J = 11.3$  Hz, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.41 (s, 3H).

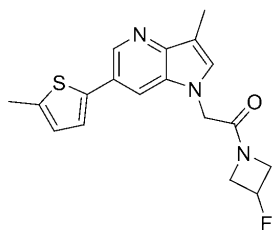
[2350] 실시예 633: 1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2351]

[2352] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 325.1;  $m/z$  실측치, 326  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 7.64 (s, 1H), 7.20 – 7.00 (m, 2H), 6.77 (s, 1H), 4.68 (s, 2H), 4.07 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 3.77 (t,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 2.53 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.22 (dd,  $J = 15.3, 7.7$  Hz, 2H).

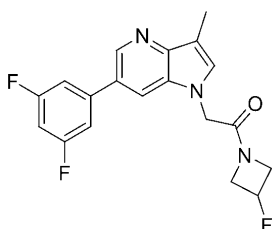
[2353] 실시예 634: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2354]

[2355] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{18}H_{18}FN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 343.1; m/z 실측치, 344  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.73 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 7.61 (d,  $J = 1.5$  Hz, 1H), 7.15 (d,  $J = 3.4$  Hz, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.77 (d,  $J = 2.3$  Hz, 1H), 5.27 (dd,  $J = 9.7, 5.1$  Hz, 0.5H), 5.13 – 5.01 (m, 0.5H), 4.74 (s, 2H), 4.41 – 4.08 (m, 2H), 3.85 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 3.78 (d,  $J = 4.2$  Hz, 1H), 2.53 (s, 3H), 2.41 (s, 3H).

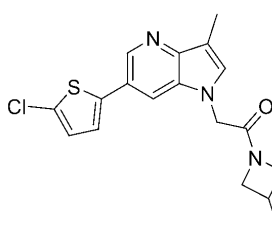
[2356] 실시예 635: 2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2357]

[2358] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{16}F_3N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 359.1; m/z 실측치, 360  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.72 (s, 1H), 8.19 (s, 1H), 7.54 (d,  $J = 7.6$  Hz, 2H), 7.42 (s, 1H), 7.23 (t,  $J = 9.4$  Hz, 1H), 5.60 – 5.51 (m, 0.5H), 5.41 – 5.30 (m, 0.5H), 5.00 (s, 2H), 4.62 – 4.43 (m, 1H), 4.38 – 4.14 (m, 2H), 4.05 – 3.86 (m, 1H), 2.30 (s, 3H).

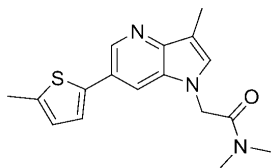
[2359] 실시예 636: 2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온.



[2360]

[2361] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{15}ClFN_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 363.1; m/z 실측치, 364  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.59 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 8.00 (d,  $J = 1.4$  Hz, 1H), 7.45 – 7.35 (m, 2H), 7.19 (d,  $J = 3.9$  Hz, 1H), 5.61 – 5.48 (m, 0.5H), 5.41 – 5.30 (m, 0.5H), 4.98 (s, 2H), 4.64 – 4.45 (m, 1H), 4.40 – 4.15 (m, 2H), 4.06 – 3.85 (m, 1H), 2.28 (s, 3H).

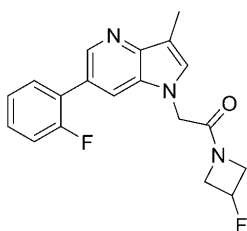
[2362] 실시예 637: N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드.



[2363]

[2364] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{17}H_{19}N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 313.1; m/z 실측치, 314  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.69 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 7.58 (d,  $J = 1.6$  Hz, 1H), 7.13 – 7.06 (m, 2H), 6.75 (d,  $J = 2.4$  Hz, 1H), 4.86 (s, 2H), 3.09 (s, 3H), 3.01 (s, 3H), 2.52 (s, 3H), 2.40 (s, 3H).

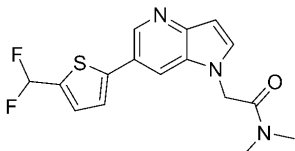
[2365] 실시예 638: 1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온.



[2366]

[2367] 표제 화합물을 실시예 27과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{19}H_{17}F_2N_3O$ 에 대한 질량 계산치, 341.1; m/z 실측치, 342  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (300 MHz,  $DMSO-d_6$ )  $\delta$  8.48 (s, 1H), 7.95 (s, 1H), 7.58 (t,  $J = 7.8$  Hz, 1H), 7.50 – 7.27 (m, 4H), 5.53 (s, 0.5H), 5.34 (s, 0.5H), 4.98 (s, 2H), 4.59 – 4.43 (m, 1H), 4.37 – 4.13 (m, 2H), 3.95 (dd,  $J = 24.6, 11.6$  Hz, 1H), 2.31 (s, 3H).

[2368] 실시예 639: 2-[6-[5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드.



[2369]

[2370] 단계 A: 2-(6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 표제 화합물을 6-브로모-1H-피롤로[3,2-b]피리딘 및 2-브로모-N,N-다이메틸아세트아미드를 사용하여, 중간체 10과 유사한 방법으로 제조하였다. MS (ESI):  $C_{11}H_{12}BrN_3O$ 에 대한 질량 계산치, 281.1; m/z 실측치, 282.05  $[M+H]^+$ .

[2371] 단계 B: 2-(6-(5-(다이플루오로메틸)티오펜-2-일)-1H-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸아세트아미드. 다이옥산 (2 mL) 중의 2-브로모-5-(다이플루오로메틸)티오펜 (100 mg, 0.47 mmol)의 용액에, 비스(피나콜라토)다이보론 (143 mg, 0.56 mmol),  $PdCl_2(dppf) \cdot CH_2Cl_2$  (35 mg, 0.05 mmol), KOAc (138 mg, 1.40 mmol)를 첨가하였다. 얻어진 반응 혼합물을 밀봉 용기에서 90°C로 가열하고, 2시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각시킨 다음에, 계속해서 단계 A의 중간체 (50 mg, 0.18 mmol), 이어서  $Cs_2CO_3$  (115 mg, 0.352 mmol), 추가량의  $PdCl_2(dppf) \cdot CH_2Cl_2$  (35 mg, 0.05 mmol) 및 다이옥산 (3 mL)을 첨가하였다. 반응 혼합물을 다시 90°C로 가열하고, 밀봉 용기에서 2시간 동안 교반하였다. 반응물을 실온으로 냉각시켜, 포화  $NaHCO_3$  수용액으로 세정하였다. 유기층을 분리한 후에,  $Mg_2SO_4$ 로 건조시키고, 여과하여, 갈색 잔류물로 농축시키고, 실리카 겔 크로마토그래피 (0 내지 7% 2M  $NH_3/MeOH/DCM$ )로 정제하여, 표제 화합물 (45 mg, 30%)을 얻었다. MS (ESI):  $C_{16}H_{15}F_2N_3OS$ 에 대한 질량 계산치, 335.3; m/z 실측치, 335.9  $[M+H]^+$ .  $^1H$  NMR (500 MHz,  $CDCl_3$ )  $\delta$  8.76 – 8.71 (d,  $J = 2.0$  Hz, 1H), 7.71 – 7.66 (m, 1H), 7.37 – 7.33 (d,  $J = 3.3$  Hz, 1H), 7.28 – 7.23 (m, 2H),

6.97 – 6.72 (m, 2H), 4.96 – 4.89 (s, 2H), 3.14 – 3.09 (s, 3H), 3.04 – 2.97 (s, 3H).

[2372] 생물학적 분석

[2373] **래트 NR1/NR2B 수용체에 대한 특이적 결합 저해**

[2374] 본 분석은 GluN2B 서브유닛 함유 NMDA 수용체에 대한 트레이서의 결합 및 시험 화합물의 이러한 결합을 치환하는 능력에 의존한다. 3-[<sup>3</sup>H] 1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온은 GluN1 서브유닛과 GluN2B 서브유닛 사이의 계면에 위치한 이펜프로딜 결합 부위에 결합하는 고친화성 GluN2B 선택적 길항제이다. 대안적으로, 본 분석은 성체 래트 피질막으로부터의 천연 NMDA 수용체에서 이펜프로딜 결합 부위에 대하여 경쟁하는 리간드에 대한 결합 친화력을 측정한다.

[2375] 요약하면, 성체 래트 피질을 분석 완충액(50 mM 트리스(Tris); pH 7.4)에서 균질화시킨다. 천연 NMDA 수용체를 함유하는 얻어진 피질막을 원심분리에 의해 정제하여, 충분히 세척한 다음에, 분석 완충액에 재현탁시킨다. 시험 화합물, 트레이서 및 피질막을 함께 혼합하고, 실온에서 2시간 동안 진탕 배양하여, 결합 평형에 이르게 한다. 트레이서의 비특이적 결합은 뇌막을 10 μM의 CP 101,606으로 전배양하여 측정한다. 배양 후에, 결합 및 비결합 트레이서를 폴리에틸렌이민에 침지시킨 세포 수집기(cell harvester) 및 GF/B 필터 플레이트(퍼킨엘머(PerkinElmer))로 여과하여 분리한다.

[2376] 결합도를 액체 신타레이터 카운터로 필터 플레이트에 보유된 [3H] 방사능을 계수하여 측정한다. 시험 화합물에 대한 결합 친화력(평형해리상수  $K_i$ )은 실험 데이터를 다음 모델  $\log EC_{50} = \log(10^{\log K_i * (1 + [\text{방사성 리간드}] / \text{HotKd})})$  및  $Y = \text{하부} + (\text{상부} - \text{하부}) / (1 + 10^{(X - \log EC_{50})})$  (여기서, [방사성 리간드]는 트레이서의 농도이고, HotKdNM은 트레이서의 평형해리상수이며, 상부 및 하부는 Y축 단위의 곡선 플래토(curve plateau)임)로 피팅하여 측정한다.

[2377] HN2BC: 포유류 세포에 발현되는 클론 인간 NR1/NR2B 이온 채널에 대한 피험물질의 효과

[2378] NMDA 수용체는  $\text{Ca}^{2+}$  이온에 대하여 고투과성을 지닌 이온 채널로서, 세포 기반 칼슘 유출(calcium flux) 분석을 이용하여 NMDA 수용체 기능을 모니터링할 수 있게 한다. 본 분석에서, 공동 작용제(co-agonist)인 글루타메이트와 글리신을 인간 GluN1/GluN2B NMDA 수용체를 이중 발현하는 세포에 첨가하여, 세포  $\text{Ca}^{2+}$  유입을 개시한다. 세포 내 칼슘의 경시적 변화를 변화를 형광 염료 및 FLIPR(형광 이미징 플레이트 리더(Fluorometric Imaging Plate Reader)) 장치를 사용하여 측정한다.

[2379] 측정하기 24시간 전에, 안정한 세포주에서의 NMDA 수용체의 발현이 비선택성 NMDA 수용체 차단제의 존재 하에 Tet-On 유도성 시스템으로 유도된다. 실험 당일, 세포 배양 배지를 조심스럽게 세척하고, 세포를 137 mM NaCl, 4 mM KCl, 2 mM  $\text{CaCl}_2$ , 0.5 mM  $\text{MgCl}_2$ , 10 mM HEPES 및 5 mM D-글루코스를 함유하는 염료 로딩 완충액 (pH 7.4)에 칼슘 5 염료 키트 (몰레큘러 디바이스즈(Molecular Devices))와 함께 로딩한다. 실온에서 1시간 배양한 후, 염료를 분석 완충액(137 mM NaCl, 4 mM KCl, 2 mM  $\text{CaCl}_2$ , 0.01 mM EDTA, 10 mM HEPES 및 5 mM D-글루코스; pH 7.4)으로 씻어낸다. FLIPR TETRA 리더에서, 다양한 농도의 시험 화합물을 세포에 5분간 첨가하면서, 형광을 모니터링하여 잠재적인 작용제 활성을 검출한다. 그 다음에, 공동 작용제인 글루타메이트 및 글리신을 추가로 5분간 첨가한다.  $\sim EC_{50}$ 에 상당하는 글루타메이트 농도를 사용하여, 분석의 시그널 윈도우(signal window)와, NMDA 수용체 길항제 및 음성 알로스테릭 조절제(negative allosteric modulator)를 검출하는 능력을 최대화한다. 포화 농도(10 μM)의 글리신도 본 분석에 존재한다. 비선택성 NMDA 수용체 길항제, (+)MK-801을 길항제 활성에 대한 양성 대조군으로 사용한다. 시험 화합물의 존재 하에서의 형광 신호를 정량화하여, 적절한 대조 웰에 의해 정의된 신호로 정규화한다.



[2380] [표 5]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
1	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;	6.5
2	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;	6.9
3	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
4	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.3
5	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;	6.7
6	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.3
7	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.8
8	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
9	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.2
10	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;	7.3
11	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.6
12	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.4
13	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.3
14	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;	6.9
15	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.4
16	2-(3-브로모-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;	7.1
17	2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;	7.3
18	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
19	2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.5
20	2-[3-브로모-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.3
21	2-(3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-N-사이클로프로필-아세트아미드;	7.4
22	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
23	2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.3
24	2-[3-브로모-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.0
25	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.1
26	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.4
27	2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.3
28	2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.7
29	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
30	2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7

[2381]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
31	2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	5.5
32	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.4
33	2-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
34	2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.8
35	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.7
36	2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.0
37	2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.0
38	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	5.3
39	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.5
40	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.3
41	1-(아제티딘-1-일)-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
42	2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	5.6
43	N-사이클로프로필-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;	NT
44	2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.7
45	2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.3
46	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)-2-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.3
47	1-(아제티딘-1-일)-2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.1
48	2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.2
49	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.7
50	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.4
51	N-사이클로프로필-2-[2-메틸-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.2
52	2-(2-메틸-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-모르폴리노-에탄온;	5.9
53	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	5.3
54	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
55	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.5
56	2-(3-클로로-6-페닐-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.3
57	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.5
58	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.6

[2382]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
59	3-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸;	7.4
60	5-메틸-3-[[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸;	7.0
61	5-메틸-3-[[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;	6.4
62	5-메틸-3-[[6-(o-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;	6.9
63	3-[[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
64	3-[[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
65	3-[[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸]-5-메틸-아이속사졸 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
66	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
67	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.3
68	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-브로모-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
69	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
70	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트산;	7.3
71	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.1
72	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
73	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
74	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
75	N-사이클로프로필-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.3
76	N-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.0
77	N-사이클로프로필-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6
78	2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	5.8
79	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	7.1
80	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	6.5
81	2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	6.5
82	2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	7.2
83	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	6.6
84	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피콜리딘-1-일-에탄온;	7.1
85	1-모르폴리노-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.2
86	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.3
87	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.0
88	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.6
89	1-모르폴리노-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
90	1-모르폴리노-2-[6-(p-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
91	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	5.8
92	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.9

[2383]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
93	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
94	2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
95	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
96	2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
97	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
98	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
99	N-사이클로프로필-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.2
100	N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.0
101	N-사이클로프로필-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.7
102	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
103	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
104	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
105	2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.4
106	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.5
107	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.8
108	2-[6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.9
109	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
110	N-사이클로프로필-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6
111	N-사이클로프로필-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.4
112	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-메틸-3-피리딜)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.3
113	5-[1-[2-(아제티딘-1-일)-2-옥소-에틸]피롤로[3,2-b]피리딘-6-일]피리딘-2-카르보니트릴;	5.3
114	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리미딘-5-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;	<5
115	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[(5-플루오로피리미딘-2-일)메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;	6.5
116	사이클로부틸-6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.1
117	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.3
118	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
119	2-사이클로프로필-1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3

[2384]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
120	1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
121	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
122	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.4
123	1-피롤리딘-1-일-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
124	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
125	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.5
126	1-모르폴리노-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
127	1-모르폴리노-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
128	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
129	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.6
130	6-(4-메틸-2-티에닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;	7.7
131	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피롤로[3,2-b]피리딘;	6.9
132	2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.9
133	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
134	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
135	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
136	1-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
137	6-(4-메틸-2-티에닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;	7.7
138	6-(3,4-다이플루오로페닐)-1-[[5-(트라이플루오로메틸)-2-푸릴]메틸]피롤로[3,2-b]피리딘;	NT
139	N,N-다이메틸-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	NT
140	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;	7.5
141	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;	6.4
142	1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;	6.3
143	3,3-다이메틸-1-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	6.1
144	1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;	5.7
145	1-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3,3-다이메틸-부탄-2-온;	6.3
146	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.0

[2385]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
147	2-[3-클로로-6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
148	2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
149	2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
150	2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
151	2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
152	2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0
153	N-사이클로프로필-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
154	N-사이클로프로필-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.4
155	N-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.6
156	N-사이클로프로필-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
157	N-사이클로프로필-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.6
158	N-사이클로프로필-2-[6-(페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.2
159	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.6
160	N-사이클로프로필-2-[6-(o-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.7
161	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
162	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(o-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.0
163	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
164	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
165	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
166	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.9
167	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-메틸-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4
168	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6
169	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
170	1-부틸-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
171	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-아이소펜틸-피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7

[2386]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
172	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(3-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.1
173	1-(사이클로프로필메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
174	1-(사이클로프로필메틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.8
175	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.3
176	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	7.5
177	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	7.5
178	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(테트라하이드로푸란-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
179	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(4-피리딜메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	7.3
180	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥시란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.1
181	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-피라졸-1-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.1
182	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.4
183	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리미딘-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	7.5
184	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(옥세탄-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.3
185	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
186	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4
187	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.3
188	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.3
189	(R/S)-1-(3-아자바이사이클로[3.1.0]헥산-3-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.9
190	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-메톡시-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.6
191	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-플루오로-1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
192	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-플루오로메틸)-1-피페리딜에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
193	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(1-피페리딜)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.1
194	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(2-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.8
195	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(트라이플루오로메틸)-1-피페리딜]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.4
196	(R/S)-1-(2-에틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.9

[2387]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
197	1-(2,2-다이메틸모르폴린-4-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.8
198	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시피롤리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.0
199	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
200	1-(2,2-다이메틸피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.6
201	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.4
202	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시-3-메틸-아제티딘-1-일)에탄온;	6.9
203	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-하이드록시-3-(트라이플루오로메틸)아제티딘-1-일]에탄온;	6.4
204	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.8
205	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	7.3
206	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[3-(하이드록시메틸)아제티딘-1-일]에탄온;	6.5
207	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;	6.5
208	1-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
209	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(4-하이드록시-4-메틸-1-피페리딘)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
210	(R/S)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸모르폴린-4-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.4
211	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;	6.4
212	1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]아제티딘-3-카르보니트릴;	6.5
213	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
214	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메틸아제티딘-1-일)에탄온;	7.0
215	1-(3,3-다이메틸아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
216	1-[2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세틸]피롤리딘-3-온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.9
217	1-(3,3-다이플루오로피롤리딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.5
218	(R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시피롤리딘-1-일)에탄온;	6.4
219	1-사이클로프로필-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.3
220	1-사이클로프로필-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.3
221	1-사이클로프로필-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
222	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
223	1-[6-(4-플루오로-2,3-다이메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.1

[2388]



실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
224	1-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	6.4
225	1-[6-(2,3-다이메틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.1
226	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-페닐-에탄온;	6.7
227	1-(4-플루오로페닐)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.1
228	(R/S)-6-(4-플루오로페닐)-1-(테트라하이드로피란-2-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	6.2
229	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소프로필-아세트아미드;	6.3
230	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-프로필-아세트아미드;	5.3
231	(R/S)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2,2,2-트라이플루오로-1-메틸-에틸)아세트아미드;	5.7
232	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(1-메틸사이클로프로필)아세트아미드;	5.0
233	N-(2-플루오로에틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	4.8
234	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-아이소부틸-아세트아미드;	5.6
235	5-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;	4.9
236	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;	6.7
237	N-(사이클로프로필메틸)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	5.7
238	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;	5.5
239	5-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸-3-메틸-1,2,4-옥사다리아졸;	6.8
240	3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-[(1-메틸피라졸-4-일)메틸]피콜로[3,2-b]피리딘;	6.3
241	2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로부틸-에탄온;	5.3
242	1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.1
243	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.0
244	2-[3-클로로-6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	6.2
245	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
246	2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-사이클로프로필-아세트아미드;	7.0
247	2-[3-클로로-6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.5
248	N-사이클로프로필-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.2
249	N-사이클로프로필-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.1
250	N-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6
251	N-벤질-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.3

[2389]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
252	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]메틸옥사졸;	5.3
253	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-하이드록시에틸)아세트아미드;	7.1
254	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-(2-메톡시에틸)아세트아미드;	5.9
255	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	5.4
256	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
257	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.9
258	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.7
259	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.5
260	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4
261	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.3
262	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.0
263	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.8
264	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-2-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.2
265	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.0
266	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.9
267	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4
268	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
269	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
270	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.4
271	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
272	(R/S)-1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-올;	7.6
273	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-하이드록시아제티딘-1-일)에탄온;	6.0
274	(R/S)-1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄올;	7.2
275	(R/S)-2-사이클로프로필-1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]프로판-2-올 트라이플루오로아세테이트 염;	6.8

[2390]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
276	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메톡시-에탄아민;	6.3
277	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.5
278	1-피롤리딘-1-일-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
279	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
280	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
281	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
282	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.1
283	2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.7
284	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
285	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.8
286	1-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 옥심 트라이플루오로아세테이트 염;	6.8
287	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.2
288	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.7
289	(R/S)-1-(2-사이클로프로필-2-플루오로-에틸)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘;	7.1
290	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-메톡시아제티딘-1-일)에탄온;	6.2
291	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(2-메톡시에틸)피롤로[3,2-b]피리딘 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
292	1-사이클로부틸-2-[6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.9
293	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3R)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.5
294	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-[(3S)-3-플루오로피롤리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
295	1-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온 트라이플루오로아세테이트 염;	6.5
296	N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	7.6
297	N,N-다이에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.4
298	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.3
299	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;	7.3
300	2-(3-클로로-6-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;	7.7
301	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
302	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
303	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이메틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4

[2391]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
304	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	6.8
305	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.1
306	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
307	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
308	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
309	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
310	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.3
311	2-[6-[3,4-다이플루오로페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
312	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
313	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.7
314	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.2
315	2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.1
316	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
317	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
318	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;	7.7
319	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
320	1-사이클로프로필-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
321	1-사이클로프로필-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
322	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
323	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
324	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.0
325	1-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	6.7
326	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	6.7
327	1-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.2
328	1-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.2
329	1-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	6.3

[2392]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
330	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;	7.2
331	(R/S)-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설파닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;	5.4
332	6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(메틸설폰닐메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;	5.8
333	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	5.2
334	1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.6
335	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.9
336	1-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.7
337	1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.8
338	1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.8
339	1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.9
340	4-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]부탄-2-온;	7.9
341	1-[3-플루오로-6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	6.0
342	1-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.3
343	1-[3-플루오로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.2
344	1-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.3
345	1-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.5
346	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-모르폴리노-에탄온;	7.4
347	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
348	N-사이클로프로필-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.5
349	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
350	N-사이클로프로필-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	7.8
351	N-사이클로프로필-2-[6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	7.1
352	N-사이클로프로필-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4
353	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
354	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
355	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
356	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.7
357	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.7
358	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세테이트 염;	7.4

[2393]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
359	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염;	7.5
360	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
361	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
362	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
363	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
364	1-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-3-메틸-부탄-2-온;	7.7
365	1-사이클로부틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
366	N-사이클로프로필-2-[6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.5
367	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.3
368	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
369	2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.7
370	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
371	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
372	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.8
373	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
374	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
375	N,N-다이메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.9
376	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.7
377	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	8.0
378	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	8.2
379	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
380	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	8.0
381	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
382	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
383	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
384	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-사이클로프로필-에탄온;	7.7
385	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트이트 염;	7.7

[2394]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
386	N,N-다이메틸-2-[6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염;	6.4
387	2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드;	7.2
388	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염;	6.1
389	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	6.8
390	2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드;	6.5
391	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드 트라이플루오로아세트레이트 염;	7.3
392	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	7.2
393	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸- 아세트아미드;	6.9
394	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	6.8
395	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2- b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	7.3
396	2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N- 다이메틸-아세트아미드;	6.3
397	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(4-클로로-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘- 1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	7.3
398	2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3- 플루오로아제티딘-1-일)에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	7.4
399	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
400	N,N-다이메틸-2-[6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.3
401	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(5-에틸-2-티에닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;	6.2
402	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2- b]피리딘-1-일]에탄온 트라이플루오로아세트레이트 염;	6.6
403	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
404	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-메틸티아졸-5-일)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
405	1-(아제티딘-1-일)-2-(6-티아졸-5-일)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	5.0
406	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(6-플루오로-3-피리딜)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;	NT
407	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;	5.2
408	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;	7.4
409	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
410	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1- 일]에탄온;	6.5
411	2-[6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2- 트라이플루오로에틸)아세트아미드;	7.6
412	2-[3-클로로-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3- 플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	5.1

[2395]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
413	2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.3
414	2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
415	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-N-(2,2,2-트라이플루오로에틸)아세트아미드;	7.2
416	2-[3-클로로-6-(4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	5.6
417	2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
418	2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.3
419	N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	7.2
420	2-[3-클로로-6-(2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.2
421	2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.2
422	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(4-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
423	2-[3-클로로-6-(5-클로로-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
424	2-[3-클로로-6-(5-에틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.5
425	2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.5
426	2-[6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
427	2-[6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
428	N,N-다이메틸-2-[6-(2,4,5-트라이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.0
429	2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.1
430	2-[6-(4-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
431	2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.6
432	2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.1
433	N,N-다이메틸-2-(6-페닐피콜로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;	7.6
434	N,N-다이메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.0
435	N,N-다이메틸-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.3
436	2-[6-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
437	N,N-다이메틸-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.5
438	N,N-다이메틸-2-[6-(5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6

[2396]



실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
439	2-[6-(5-클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
440	2-[6-(2,5-다이클로로-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.9
441	N,N-다이메틸-2-[6-[6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.0
442	N,N-다이메틸-2-[6-[2-(트라이플루오로메틸)-4-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.8
443	N,N-다이메틸-2-[6-[5-(트라이플루오로메틸)-3-피리딜]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.4
444	2-[6-(2,6-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.2
445	2-[6-(2-플루오로-5-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.4
446	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
447	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.7
448	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.7
449	2-[6-(3-에틸페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
450	2-[6-(3-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
451	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
452	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
453	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
454	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
455	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
456	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
457	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
458	2-[6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.4
459	N-에틸-N-메틸-2-[6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.4
460	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
461	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;	7.5
462	N-에틸-N-메틸-2-[6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.9
463	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
464	N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	7.9

[2397]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
465	2-[6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.1
466	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
467	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
468	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.8
469	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;	7.8
470	N-에틸-N-메틸-2-[6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.7
471	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
472	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
473	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
474	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
475	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
476	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
477	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
478	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
479	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
480	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
481	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
482	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.8
483	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
484	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.9
485	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
486	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
487	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.3
488	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.8
489	2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	8.0

[2398]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
490	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
491	2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.8
492	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.6
493	2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.6
494	2-[3-플루오로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.5
495	2-(3-플루오로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.9
496	2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
497	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-플루오로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.5
498	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
499	2-[3-플루오로-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.6
500	2-[3-플루오로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
501	2-[3-플루오로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
502	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
503	2-[6-(3-클로로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.8
504	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.9
505	2-[6-(3-에틸페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.7
506	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.8
507	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.7
508	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.9
509	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-플루오로-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
510	2-[3-플루오로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.4
46	2-[3-클로로-6-(4-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
512	2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.5
513	2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
514	2-(3-클로로-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.9
515	2-[3-클로로-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0

[2399]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
516	2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.7
517	2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0
518	2-[3-클로로-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
519	2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
520	2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
521	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.9
522	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
523	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
524	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
525	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
526	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
527	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
528	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
529	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-[3-(다이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
530	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
531	2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
532	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
533	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
534	2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
535	2-[3-클로로-6-(2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.7
536	2-[3-클로로-6-(2-플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.6
537	2-[3-클로로-6-(3,5-다이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.9
538	2-[3-클로로-6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.1
539	2-[3-클로로-6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.6
540	2-[3-클로로-6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.6

[2400]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
541	2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.4
542	2-[3-클로로-6-(3-에틸페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.5
543	2-[3-클로로-6-(3-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
544	2-[3-클로로-6-(3-클로로-2-플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.5
545	2-[3-클로로-6-(3-클로로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.9
546	2-[3-클로로-6-(3-(다이플루오로메틸)페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.4
547	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-2-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
548	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
549	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
550	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.9
551	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.2
552	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
553	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.1
554	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
555	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
556	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
557	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;	6.9
558	2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
559	N-에틸-2-[6-(4-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	6.8
560	N-에틸-2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	6.1
561	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
562	2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
563	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
564	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.0
565	2-[6-(2-플루오로-3-메틸페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일]에탄온;	6.9

[2401]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
566	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.3
567	2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.7
568	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.3
569	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.4
570	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.2
571	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.3
572	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	7.1
573	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.9
574	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
575	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(4-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
576	N,N-다이메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;	7.0
577	N-에틸-N-메틸-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)아세트아미드;	6.7
578	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	6.9
579	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-(3-메틸-6-페닐-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일)에탄온;	7.2
580	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
581	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(m-톨릴)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.1
582	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
583	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.9
584	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.4
585	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
586	2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.9
587	N-에틸-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	6.6
588	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
589	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.9
590	2-[6-[2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐]-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.5
591	2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.9
592	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.9

[2402]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
593	2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.6
594	N-에틸-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	6.1
595	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.6
596	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(2,3,4-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
597	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.5
598	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(3,4,5-트라이플루오로페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
599	2-[3-클로로-6-(2,5-다이메틸-3-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0
600	2-[3-클로로-6-(3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.1
601	2-[3-클로로-6-(6-(트라이플루오로메틸)-2-피리딜)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.9
602	2-[3-클로로-6-(5-클로로-4-메틸-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	8.0
603	2-[3-클로로-6-(5-(트라이플루오로메틸)-2-티에닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
604	2-[6-(벤조티오펜-2-일)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.7
605	2-[3-플루오로-6-(4-플루오로-3-(트라이플루오로메틸)페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
606	2-[6-(3-클로로-2-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.2
607	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-플루오로-6-(m-톨릴)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.4
608	2-[6-(3-클로로-4-플루오로-페닐)-3-플루오로-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.7
609	1-(아제티딘-1-일)-2-(3-[ <sup>3</sup> H]-6-(4-플루오로-3-메틸페닐)-1H-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	NT
610	2-[2-뉴테리오-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	8.7
611	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-(트라이플루오로메틸)피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	8.0
612	3-클로로-1-(3-피리딜메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;	7.5
613	1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;	5.6
614	3-클로로-6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-1-(피리다진-3-일메틸)피콜로[3,2-b]피리딘;	7.5
615	3-클로로-1-(피리다진-3-일메틸)-6-[3-(트라이플루오로메틸)페닐]피콜로[3,2-b]피리딘;	7.6
616	2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.5
617	N-에틸-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피콜로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-메틸-아세트아미드;	7.3

[2403]

실시예 번호	화합물명	pIC <sub>50</sub>
618	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(4-플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.5
619	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.4
620	2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;	7.6
621	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(3,4-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
622	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0
623	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.8
624	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	7.1
625	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N-에틸-N-메틸-아세트아미드;	7.0
626	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
627	1-(아제티딘-1-일)-2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.8
628	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	7.0
629	2-[6-(2,4-다이플루오로-3-메틸-페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	7.4
630	N-에틸-N-메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.6
631	2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-피롤리딘-1-일-에탄온;	6.8
632	1-(3,3-다이플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.7
633	1-(아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	7.3
634	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온;	6.2
635	2-[6-(3,5-다이플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.5
636	2-[6-(5-클로로-2-티에닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-1-(3-플루오로아제티딘-1-일)에탄온;	6.8
637	N,N-다이메틸-2-[3-메틸-6-(5-메틸-2-티에닐)피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]아세트아미드;	6.5
638	1-(3-플루오로아제티딘-1-일)-2-[6-(2-플루오로페닐)-3-메틸-피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]에탄온; 및	6.9
639	2-[6-[5-(다이플루오로메틸)-2-티에닐]피롤로[3,2-b]피리딘-1-일]-N,N-다이메틸-아세트아미드;	6.7

\*NT 는 미시험을 의미함.

[2404]