

(19) 日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11) 特許出願公表番号

特表2009-523845

(P2009-523845A)

(43) 公表日 平成21年6月25日 (2009.6.25)

(51) Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
C07D 471/04 (2006.01)	C O 7 D 471/04 1 O 8 Z	4 C O 6 5
A61K 31/437 (2006.01)	C O 7 D 471/04 C S P	4 C O 7 2
A61P 43/00 (2006.01)	A 6 1 K 31/437	4 C O 8 6
A61P 3/10 (2006.01)	A 6 1 P 43/00 1 1 1	
A61P 3/04 (2006.01)	A 6 1 P 3/10	
審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 133 頁) 最終頁に続く		

(21) 出願番号 特願2008-552225 (P2008-552225)
 (86) (22) 出願日 平成19年1月23日 (2007.1.23)
 (85) 翻訳文提出日 平成20年7月23日 (2008.7.23)
 (86) 国際出願番号 PCT/KR2007/000393
 (87) 国際公開番号 W02007/083978
 (87) 国際公開日 平成19年7月26日 (2007.7.26)
 (31) 優先権主張番号 10-2006-0006834
 (32) 優先日 平成18年1月23日 (2006.1.23)
 (33) 優先権主張国 韓国 (KR)
 (31) 優先権主張番号 60/846,411
 (32) 優先日 平成18年9月21日 (2006.9.21)
 (33) 優先権主張国 米国 (US)

(71) 出願人 508114487
 クリスタルゲノミクス インコーポレーテッド
 大韓民国 138-736 ソウル, ソン
 パグ, プンナップ2ドン 388-1, ア
 サン メディカル センター, セカンドビ
 ルディング オブ アサン インスティテ
 ユート フォー ライフ サイエンスイズ
 6階
 (71) 出願人 508223365
 ユユ ファーマ インコーポレーテッド
 大韓民国 390-250 チュンチョン
 ブックド, ジェチョンシ, ワンアムドン,
 983

最終頁に続く

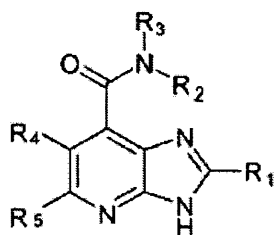
(54) 【発明の名称】 たんぱく質キナーゼの活性を阻害するイミダゾピリジン誘導体、これの製造方法およびこれを含む薬学組成物

(57) 【要約】

【課題】たんぱく質キナーゼの活性を阻害するイミダゾピリジン誘導体、これの製造方法およびこれを含む薬学組成物を提供する。

【解決手段】本発明のイミダゾピリジン誘導体は、化学式1の化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体である。

【化1】

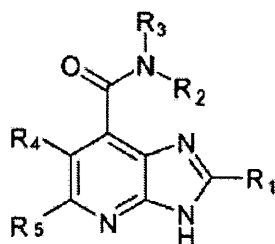


【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記化学式 1 の化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体：

【化 1】



10

前記の式において、

R₁は、非置換されるか；

ハロゲン、-CN、NO₂、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルピペラジニル、C₁₋₆アルキルスルフィニルC₁₋₆アルキル、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、モルホリニルC₁₋₆アルキルアミノ、ピロリジニルC₁₋₆アルキルアミノ、-OR'、-C(O)OR'、-OC(O)R'、-NR'R''、-NHC(O)R'、-C(O)NR'R''、-NHC(S)R'、-C(S)NR'R''、-SR'、-S(O)R'、-SO₂R'、-NHSO₂R'、-SO₂NR'R''、-OSO₂R'、-SO₂OR'、アリル、ヘテロアリル、アリル-C₁₋₄アルキル、ホルミル、または、トリフルオロメチル

20

に置換されたヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルキルスルホニル、アミド、アリル、または、ヘテロアリルで、

(ここで、R'または、R''は、各々独立して、水素、または、非置換されるか、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、(C₁₋₄アルキル)アミノ、OH、COOH、-COO(C₁₋₄アルキル)、-CONH₂、ホルミル、または、トリフルオロメチルに置換されたC₁₋₄アルキル、C₃₋₇シクロアルキル、アリル、または、ヘテロアリルで、

アリルは、フェニル、インダニル、または、ナフチルで、

ヘテロアリルは、環の内1つ以上のN、Oまたは、Sを含む5-10員環アリル、または、モノ-またはバイサイクリックヘテロアリルである。)

30

R₂は、

水素；

非置換されるか、置換されたC₁₋₈アルキル；

環構造内にN、Sまたは、Oを含む、非置換されるか置換されたC₁₋₇アルキル；

(ここで、前記アルキルの置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルカンスルホニル、または、アミドである。)

C₁₋₄アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、アミノC₁₋₆アルキル、アセチルアミノ、カルボキシル、アミド、ジオキソインドール、-CN、NO₂、-OR'、-C(O)OR'、-OC(O)R'、-NR'R''、-NHC(O)R'、-NHC(O)OR'、-C(O)NR'R''、-NHC(S)R'、-C(S)NR'R''、-SR'、-S(O)R'、-SO₂R'、-NHSO₂R'、-SO₂NR'R''、-OSO₂R'、-SO₂OR'、アリル、ヘテロアリル、アリル-C₁₋₄アルキル、ホルミルまたは、トリフルオロメチルに置換されたアリル、または、ヘテロアリル；

40

(ここで、R'または、R''は、各々独立して

水素、または、

非置換されるか、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、(C₁₋₄アルキル)アミノ、OH、COOH、-COOC₁₋₄アルキル、-CONH₂、ホルミル、C₁₋₆アルキルピペリジニル、モルホリニル、または、トリフルオロメチルに置換されたC₁₋₄アルキル、C₃₋₇サイクロアルキル、アリル、または、ヘテロアリルで、

50

アリルは、フェニル、インダニル、または、ナフチルで、
ヘテロアリルは、環構造内に1つ乃至4つのN、Sまたは、Oを含む5－10員環アリル、ピリドンまたは、モノもしくは、バイサイクリックヘテロサイクルである)
非置換されるか置換されたアリル、環構造内にN、Sまたは、Oを含む、非置換されるか置換されたアリル；

(ここで、前記アリルの置換基は、

ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、 C_{1-6} アルカンスルホニル、または、アミド；

非置換されるか置換された C_{1-6} アルキル；

10

または、環構造内に1つ以上のN、Sまたは、Oを含む C_{1-6} アルキルで、

前記アルキルの置換基は、

ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、 C_{1-6} アルキルスルホニル、または、アミド；

非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、アミド、または、ジオキソイソインドールに置換されたアリル；

ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、 C_{1-6} アルキルスルホニル、または、アミドに置換されたアリル基を有するスルホニルアミノアリル；

20

非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、 C_{1-6} アルカンスルホニル、または、アミドに置換され、且つ、環構造内に1つ以上のN、Sまたは、Oを含むアリル；または、非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_{1-6} アルキルオキシ、 C_{1-6} アルキル、アミノ、 C_{1-6} アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、または、アミドに置換された C_{3-8} サイコロアルキルで、

前記の「環構造内に、N、Sまたは、Oを含むアリル」は、ピロル；ピラゾール；イミダゾール；1, 2, 3-トリアゾール；イソオキサゾール；オキサゾール；イソチアゾール；チアゾールリジン；チアゾール；1, 2, 5-オキサジアゾール；1, 2, 3-オキサジアゾール；1, 2, 5-チオジアゾール；1, 2, 3-シオジアゾール；1, 3, 4-オキサジアゾール；1, 3, 4-シオジアゾール；ピリジン；オキシピリジン；ピリミジン；または、トリアジンである)で、

30

R_3 は、

水素；

または、非置換されるか、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、CN、 NO_2 、 NH_2 、 C_{1-4} アルキルアミノ、アミノ C_{1-4} アルキル、OH、COOH、 $-COOC_{1-4}$ アルキル、 $-CONH_2$ の中から選ばれた1つ以上の置換基で置換された C_{1-4} アルキルまたは、 C_{3-7} サイコロアルキル(ここで、前記置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキルオキシ、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルキルスルホニル、または、アミドである)であるか、

40

R_2 および R_3 は、これらが付いている窒素原子とともに環を形成することができ；

R_4 および R_5 は、各々独立的に水素；または、非置換されるか、ハロゲン、 C_{1-4} アルキル、 C_{1-4} アルコキシ、CN、 NO_2 、 NH_2 、(C_{1-4} アルキル)-アミノ、アミノ-(C_{1-4} アルキル)、OH、COOH、 $-COO(C_{1-4}$ アルキル)、および、 $-CONH_2$ の中から選ばれた置換基で置換された C_{1-4} アルキルまたは、 C_{3-7} サイコロアルキル(ここで、前記置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキルオキシ、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルキルスルホニル、または、アミドである)である。

【請求項2】

50

請求項 1 において、

R_1 が、フェニル、ピロリジニルフェニル、ジクロロフェニル、クロロフェニル、フルオロフェニル、ジフルオロフェニル、フラニル、チオフェニル、シクロプロピル、 C_{1-2} アルキルピペラジニルフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニル C_{1-3} アルキルフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、メタンスルホニルフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノフェニル、モルホリニルフェニル、ピペリジニルフェニル、モルホリニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、ピロリジニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、ジメチルアミノ C_{1-4} アルキルアミノフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノエチルメチルアミノフェニル、ピペラジニルアミノフェニル、ピペラジニル C_{1-2} アルキルアミノフェニル、チオモルホリニルフェニル、ピペリジニルアミノフェニル、ピペリジニル C_{1-2} アルキルアミノフェニル、メトキシフェニル、ジ C_{1-3} アルキルアミノピロリジニルフェニル、または、ピリジニルであり；

R_2 は、非置換されるか、スルホニルフェニル、 C_{1-2} アルキルピリジニル、ジ C_{1-2} アルキル、トリ C_{1-2} アルキル、テトラ C_{1-2} アルキル、ピリジニル、オキシピリジニル、クロロピリジニル、モポリニル、アミノ C_{1-2} アルキルピリジニル、アセチルアミノフェニル、イミダゾール、ジクロロイミダゾール、 C_{1-2} アルキルアミダゾール、ジ C_{1-2} アルキルアミノスルホニルアミノフェニル、トリフルオロ C_{1-2} アルキルフェニル、ベンジルオキシオクソピリジニル、ヒドロキシオクソピリジニル、 C_{1-2} アルカンスルホニルアミノフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノアセチルアミノフェニル、トリフルオロメタンスルホニルアミノフェニル、フルオロピリジニル、フルオロヒドロキシフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニルアセチルアミノフェニル、クロロオキシピリジニル、チオフェニル、 C_{1-2} アルキルオキシピリジニル、アミノフェニル、ヒドロキシフェニル、 C_{1-3} アルキルピペラジンカボニルアミノフェニル、モルホリニル C_{1-3} アルコキシフェニル、ベンジル、ヒドロキシジ C_{1-2} アルキル、または、ジ C_{1-2} アルキルアミノ C_{1-2} アルキル基に置換された C_{1-5} アルキル、

非置換されるか、トリ C_{1-2} アルキル、アミノまたは、水酸基に置換されたシクロ C_{3-7} アルキル、

非置換されるか、 C_{1-2} アルキル、ジ C_{1-2} アルキル、クロロ C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルキルアミノ、アミノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、クロロ C_{1-2} アルキル、イソブトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジ C_{1-2} アルキルアミノ C_{1-2} アルコキシ、モルホリニル C_{1-3} アルコキシ、ハロゲン、アセチルアミノ、または、 C_{1-2} アルキルスルホニル C_{1-2} アルキル基に置換されたピリジニル、

非置換されるか、ベンゾイルアミノ、ピペリジニル、ヒドロキシ、 C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルキル、ジ C_{1-2} アルキル、ジイソプロピル、イソプロピル、ジ C_{1-2} アルキルアミノアセチルアミノ、フルオロ C_{1-2} アルキル、フルオロヒドロキシ、トリフルオロ C_{1-2} アルコキシ、ジ C_{1-2} アルキル、アセチルアミノ、シアノ、ベンジルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルアミノ、または、 C_{1-2} アルカンスルホニルに置換されたフェニル、

ベンゾシアゾイル、インダゾイル、 C_{1-2} アルキルインドルイル、インドルイル、ナフタルレニル、キノリニル、 C_{1-2} アルキルピラゾルイル、フェニルシアゾイル、トルイル、ベンゾジオキサソリル、 C_{1-2} アルキルフェニルアセトアミド、 C_{1-2} アルキルフェノキシ酢酸、エタンスルホニル C_{1-2} アルキルフェニルアミド、 C_{1-2} アルキルフェノキシ酢酸ターシャリブチルエステル、 C_{1-2} アルキルフェニルメタンスルホンアミド、 C_{1-2} アルキルピペラジニル、 C_{1-2} アルコキシフェニルアミド、ピペリジニル、ベンジルピペリジニル、トリ C_{1-2} アルキルビシクロヘプチニル、アダマンタニル、アミノビシクロヘプタンカボキシル、アザビシクロオクチル、ビシクロヘプチニル、ターシャリブチルアミド、または、 C_{1-2} アルキルピリジニル C_{1-2} アルキルカバミク酸ターシャリブチルエステルで、

R_3 は、Hであるか、

R_2 および、 R_3 は、それらが付着している窒素原子と共に環を形成することができ；

R₄ は、Hまたは、ハロゲンで；

R₅ は、Hであることを特徴とする化学式 1 の化合物。

【請求項 3】

請求項 1 において、

下記化合物でなる群から選択されることを特徴とする化学式 1 の化合物：

- 1) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(4-アセチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 2) (4-{2-[(2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン-7-カルボニル)-アミノ]-エチル}-フェノキシ)-酢酸；
- 3) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(2-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド； 10
- 4) (3-{2-[(2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボニル)-アミノ]-エチル}-フェノキシ)-酢酸；
- 5) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(4-エタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 6) (3-{2-[(2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボニル)-アミノ]-エチル}-フェノキシ)-酢酸ターシャリブチルエステル；
- 7) (4-{2-[(2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボニル)-アミノ]-エチル}-フェノキシ)-酢酸ターシャリブチルエステル；
- 8) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド； 20
- 9) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 10) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [3-(4, 5-ジクロロ-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；
- 11) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(4-メタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 12) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 (2-(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド；
- 13) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 (2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド； 30
- 14) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 (2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド；
- 15) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 (3-モルホリン-4-イル-プロピル)-アミド；
- 16) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(1-オキシ-ピリジン-2-イル)-エチル]-アミド；
- 17) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；
- 18) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド； 40
- 19) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(2-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；
- 20) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；
- 21) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；
- 22) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-(2-アミノメチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；
- 23) 2-フェニル-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン 7-カルボン酸 [2-

- (2-アミノメチル-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；
- 24) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-ベンゾイルアミノ-フェニル)-アミド；
- 25) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-アミド；
- 26) 6-ブromo-2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-安息香イルアミノ-フェニル)-アミド；
- 27) 6-ブromo-2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；
- 28) 6-ブromo-2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-チオフエン-2-イル-エチル)-アミド；
- 29) 6-クロロ-2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4, 5-ジクロロ-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；
- 30) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸フェニルアミド；
- 31) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド；
- 32) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 33) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 34) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 35) [4-(2-{[2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボニル]-アミノ}-エチル)-フェノキシ]-酢酸；
- 36) [3-(2-{[2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボニル]-アミノ}-エチル)-フェノキシ]-酢酸；
- 37) [4-(2-{[2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボニル]-アミノ}-エチル)-フェノキシ]-酢酸ターシャリブチルエステル；
- 38) [3-(2-{[2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボニル]-アミノ}-エチル)-フェノキシ]-酢酸ターシャリブチルエステル；
- 39) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；
- 40) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸{2-[4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-フェニル]-エチル}-アミド；
- 41) 2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-スルホニルフェニル)-エチル]-アミド；
- 42) [2-(2-{[2-(2, 4-ジクロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボニル]-アミノ}-エチル)-フェノキシ]-酢酸；
- 43) 2-(4-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 44) 2-(4-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 45) 2-(4-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド；
- 46) 2-(4-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸{2-[4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-フェニル]-エチル}

}-アミド；

47) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド；

48) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4, 5-ジクロロイミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；

49) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4-メチルイミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；

50) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド；

51) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド；

52) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド；

53) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-エチル]-アミド；

54) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4-ベンジルオキシ-2-オキソ-2H-ピリジン-1-イル)-プロピル]-アミド；

55) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-ベンジルオキシ-2-オキソ-2H-ピリジン-1-イル)-エチル]-アミド；

56) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-ヒドロキシ-2-オキソ-2H-ピリジン-1-イル)-エチル]-アミド；

57) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド；

58) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチルピリジン-3-イル)-アミド；

59) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシピリジン-3-イル)-アミド；

60) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(6-メチルピリジン-3-イル)-アミド；

61) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-エチルスルホニルピリジン-3-イル)-アミド；

62) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4, 5-ジクロロ-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；

63) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド；

64) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド；

65) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド；

66) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸{2-[4-(2-ジメチルアミノアセチルアミノ)フェニル]-エチル}-アミド；

67) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4-メチルイミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド；

68) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド；

10

20

30

40

50

69) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

70) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド;

71) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド;

72) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド;

73) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;

74) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド;

75) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-2-イル)-エチル]-アミド;

76) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

77) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

78) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

79) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

80) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

81) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-3-イル-プロピル)-アミド;

82) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-トリフルオロメタン-スルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

83) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

84) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-4-イル-プロピル)-アミド;

85) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(2-フルオロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

86) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-エタン-スルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

87) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(5-メチル-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;

88) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド;

89) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド;

90) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド;

91) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;

92) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;

93) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸{2-[4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-フェニル]-エチル}-アミ

10

20

30

40

50

ド；

94) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

95) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

96) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド；

97) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド；

98) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-2-イル)-エチル]-アミド；

99) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；

100) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；

101) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；

102) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；

103) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；

104) (3-{2-[(2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボニル)-アミノ]-エチル}-ピリジン-2-イル-メチル)-カルバミン酸ターシャリブチルエステル；

105) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド；

106) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-3-イル-プロピル)-アミド；

107) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-トリフルオロメタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

108) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド；

109) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-4-イル-プロピル)-アミド；

110) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(2-フルオロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド；

111) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-プロピル]-アミド；

112) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド；

113) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド；

114) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

115) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

116) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド；

117) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボ

10

20

30

40

50

- ン酸[3-(4,5-ジクロロ-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;
 118) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボ
 ン酸[3-(5-メチル-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;
 119) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;
 120) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(2-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;
 121) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(4-アエチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;
 122) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(2-{4-[2-(4-エチル-ピペラジン-1-イル)アエチルアミノ]-フェニル}
 -エチル)-アミド;
 123) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド;
 124) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド;
 125) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド;
 126) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;
 127) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド;
 128) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-2-イル)-エチル]-アミド;
 129) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;
 130) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;
 131) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;
 132) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;
 133) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;
 134) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;
 135) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボ
 ン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;
 136) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(3-ピリジン-3-イル-プロピル)-アミド;
 137) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[2-(4-トリフルオロメタンシルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;
 138) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸[3-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;
 139) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(3-ピリジン-4-イル-プロピル)-アミド;
 140) 6-プロモ-2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジ
 ン7-カルボン酸[3-(4,5-ジクロロ-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;
 141) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボ
 ン酸(4-ベンゾイルアミノ-フェニル)-アミド;

10

20

30

40

50

142) 2-(2,4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

143) 2-(2,4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

144) 2-(2,4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4,5-ジクロロ-1-イル)-プロピル]-アミド ;

145) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

146) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

147) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

148) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4,5-ジクロロ-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド ;

149) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(5-メチル-3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド ;

150) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド ;

151) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド ;

152) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

153) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド ;

154) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

155) 2-(1-オキソチオフエン-3-イル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

156) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-ピリジン-2-イル-エチル)-アミド ;

157) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド ;

158) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-ピリジン-4-イル-エチル)-アミド ;

159) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

160) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド ;

161) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-フルオロ-3-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド ;

162) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(4-メチル-1-イル)-プロピル]-アミド ;

163) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド ;

164) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(1-オキシピリジン-2-イル)-エチル]-アミド ;

10

20

30

40

50

164) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-2-イル)-エチル]-アミド;

165) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

166) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(1-オキシ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

167) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

168) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-アミノメチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

169) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(6-クロロ-1-オキシ-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

170) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-フルオロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

171) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-メチルアミノ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

172) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-3-イル-プロピル)-アミド;

173) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-トリフルオロメタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

174) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

175) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-4-イル-プロピル)-アミド;

176) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-プロピル]-アミド;

177) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-メチル-ピリジン-3-イル)-エチル]-アミド;

178) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-フルオロ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

179) 2-(1-オキソ-チオフエン-3-イル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(1-オキシ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

180) 2-(1-オキソ-1H-チオフエン-3-イル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-ピリジン-3-イル-プロピル)-アミド;

181) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸ピリジン-3-イル-アミド;

182) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸ピリジン-4-イル-アミド;

183) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチルオキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

184) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-アミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

185) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

186) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸シクロヘプチル-アミド;

187) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(5-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)-アミド;

10

20

30

40

50

188) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (6-メチル-アミノ-ピリジン-3-イル)-アミド;

189) 2-チオフエン-3-イル-1H-ピロロ[2, 3-b]ピリジン-4-カルボン酸 (4-安息香イルアミノ-フェニル)-アミド;

190) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(6-メタンスルホニルアミノ-ピリジン-3-イル)-プロピル]-アミド;

191) 6-ブロモ-2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-クロロ-ピリジン-4-イル)-エチル]-アミド;

192) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

193) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

194) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

195) 2-チオフエン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (4-エトキシ-6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

196) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

197) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(2-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;

198) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

199) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(3H-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;

200) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸{2-[4-(2-ジメチルアミノ-アセチルアミノ)-フェニル]-エチル}-アミド;

201) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシ-フェニル)-エチル]-アミド;

202) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(4, 5-ジクロロ-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;

203) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(3-クロロ-フェニル)-エチル]-アミド;

204) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-{4-[(4-メチル-ピペラジン-1-カルボニル)-アミノ]}フェニル)-エチル)-アミド;

205) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(4-メチル-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;

206) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

207) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(4-ジメチルアミノ-スルホニルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド;

208) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(3-トリフルオロメチル-フェニル)-エチル]-アミド;

209) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸{2-[3-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-フェニル]-エチル}-アミド;

210) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7

10

20

30

40

50

ーカルボン酸 { 2 - [3 - (3 - モルホリン - 4 - イル - プロポキシ) - フェニル] - エチル } - アミド ;

2 1 1) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 { 2 - [3 - (2 - ジメチルアミノ - エトキシ) - フェニル] - エチル } -
アミド ;

2 1 2) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 (2 - ピリジン - 2 - イル - エチル) - アミド ;

2 1 3) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 (2 - ピリジン - 3 - イル - エチル) - アミド ;

2 1 4) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 (2 - ピリジン - 4 - イル - エチル) - アミド ;

2 1 5) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (4 - フルオロ - 3 - ヒドロキシー - フェニル) - エチル] - アミド ;

2 1 6) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (1 - オキシ - ピリジン - 4 - イル) - エチル] - アミド ;

2 1 7) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - クロロ - ピリジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

2 1 8) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - クロロ - ピリジン - 4 - イル) - エチル] - アミド ;

2 1 9) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (6 - クロロ - ピリジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 0) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - アミノメチル - ピリジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 1) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - アミノメチル - ピリジン - 4 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 2) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (6 - アミノメチル - ピリジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 3) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - フルオロ - ピリジン - 4 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 4) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - メチルアミノ - ピリジン - 4 - イル) - エチル] - アミド ;

2 2 5) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (4 - トリフルオロメタン - スルホニルアミノ - フェニル) - エチル]
ーアミド ;

2 2 6) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 (3 - ピリジン - 3 - イル - プロピル) - アミド ;

2 2 7) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 (3 - ピリジン - 4 - イル - プロピル) - アミド ;

2 2 8) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [3 - (2 - クロロ - ピリジン - 4 - イル) - プロピル] - アミド ;

2 2 9) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [2 - (2 - メチル - ピリジン - 3 - イル) - エチル] - アミド ;

2 3 0) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 [3 - (6 - フルオロ - ピリジン - 3 - イル) - プロピル] - アミド ;

2 3 1) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 ピリジン - 2 - イル - アミド ;

2 3 2) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 ピリジン - 3 - イル - アミド ;

2 3 3) 2 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン 7
ーカルボン酸 ピリジン - 4 - イル - アミド ;

10

20

30

40

50

- 234) [2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-イル]ピペリジン-1-イルメタノン;
- 235) [2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-イル]-(4-メチルピペラジン-1-イル)メタノン;
- 236) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アミノフェニル)-エチル]アミド;
- 237) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(6-メチルオキシピリジン-3-イル)アミド;
- 238) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[3-(6-クロロピリジン-3-イル)プロピル]アミド; 10
- 239) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-メチルオキシピリジン-3-イル)アミド;
- 240) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸シクロヘプチルアミド;
- 241) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチルピリジン-3-イル)アミド;
- 242) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(6-クロロピリジン-3-イル)アミド;
- 243) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(5-メチル-2H-ピラゾール-3-イル)アミド; 20
- 244) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(5-メチルピリジン-2-イル)アミド;
- 245) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(2-クロロピリジン-3-イル)アミド;
- 246) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチルオキシピリジン-3-イル)アミド;
- 247) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-クロロピリジン-3-イル)アミド;
- 248) 2-(4-フルオロフェニル)-3-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]アミド; 30
- 249) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-ピペリジン-1-イルフェニル)アミド;
- 250) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-モルホリン-4-イルフェニル)アミド;
- 251) 6-ブロモ-2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-クロロピリジン-4-イル)-エチル]アミド;
- 252) 6-クロロ-2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(2-クロロピリジン-4-イル)-エチル]アミド; 40
- 253) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸フェニルアミド;
- 254) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-ヒドロキシシクロヘキシル)アミド;
- 255) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸(1-ベンジルピペリジン-4-イル)アミド;
- 256) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸ピペリジン-4-イルアミド;
- 257) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7 50

- カルボン酸(2, 6-ジエチル-フェニル)-アミド;
 258) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2, 6-ジイソプロピル-フェニル)-アミド;
 259) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸ベンジル-エチル-アミド;
 260) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(1-ベンジル-ピロリジン-3-イル)-アミド;
 261) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸-ジイソプロピル-フェニル-アミド;
 262) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 10
 -カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビスクロ[2.2.1]ヘプチン-2-イル)-
 アミド;
 263) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸アダマンタン-1-イル-アミド;
 264) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸アダマンタン-2-イル-アミド;
 265) 2-{[2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピ
 リジン7-カルボニル]-アミノ}-ビスクロ[2.2.1]ヘプタン-2-カルボン酸
 ;
 266) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 20
 -カルボン酸(1-アザ-ビスクロ[2.2.2]オクチン-3-イル)-アミド;
 267) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸シクロヘキシルアミド;
 268) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸-ビスクロ[2.2.1]ヘプチン-2-イル-アミド;
 269) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2, 6, 6-トリメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプチン-3-イル)-
 アミド;
 270) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2, 6, 6-トリメチル-ビスクロ[3.1.1]ヘプチン-3-イル)- 30
 アミド;
 271) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2, 6-ジメチル-フェニル)-アミド;
 272) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(3-アミノ-シクロヘキシル)-アミド;
 273) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸-シクロペンチルアミド;
 274) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7
 -カルボン酸-ビスクロ[2.2.1]ヘプチン-2-イル-アミド;
 275) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 40
 -カルボン酸(2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチル-エチル)-アミド;
 276) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 277) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸-ターシャリブチルアミド;
 278) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2-ジメチルアミノ-1-メチル-エチル)-アミド;
 279) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 -カルボン酸(2-エトキシ-フェニル)-アミド;
 280) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 50

- ーカルボン酸(2-ヒドロキシ-シクロペンチル)ーアミド；
- 281) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1-ヒドロキシメチル-シクロペンチル)ーアミド；
- 282) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1, 1-ジメチル-プロピル)ーアミド；
- 283) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(3, 3, 5-トリメチル-シクロヘキシル)ーアミド；
- 284) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸-ナフタレン-2-イル-アミド；
- 285) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 10
- ーカルボン酸-キノリン-6-イル-アミド；
- 286) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸-キノリン-3-イル-アミド；
- 287) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)ーアミド；
- 288) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(6-メトキシ-2-メチル-ピリジン-3-イル)ーアミド；
- 289) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1, 3, 3-トリメチル-ブチル)ーアミド；
- 290) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 20
- ーカルボン酸(1, 4-ジメチル-ペンチル)ーアミド；
- 291) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1-エチル-プロピル)ーアミド；
- 292) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1, 1, 3, 3-テトラメチル-ブチル)ーアミド；
- 293) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸ベンゾシアゾ-2-イルアミド；
- 294) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7
- ーカルボン酸(1H-インダゾール-6-イル)ーアミド；
- 295) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 30
- ーカルボン酸(2-メチル-1H-インドール-5-イル)ーアミド；
- 296) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(1H-インドール-5-イル)ーアミド；
- 297) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(3-トリフルオロメトキシ-フェニル)ーアミド；
- 298) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7ー
- カルボン酸(3, 5-ジメトキシ-フェニル)ーアミド；
- 299) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(3-アセチルアミノ-フェニル)ーアミド；
- 300) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 40
- ーカルボン酸(3-シアノ-フェニル)ーアミド；
- 301) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(3-ベンジルオキシ-フェニル)ーアミド；
- 302) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸(4-フェニル-シアゾ-2-イル)ーアミド；
- 303) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸o-トリルアミド；
- 304) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
- ーカルボン酸ベンゾ[1, 3]ジオキサール-5-イル-アミド；
- 305) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 50

- ーカルボン酸 (2, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 306) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (2-クロロ-6-メトキシ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 307) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (6-メトキシ-5-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 308) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (6-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 309) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (2-メタンスルホニル-フェニル) -アミド;
 310) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7 10
 ーカルボン酸 (6-クロロ-4-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 311) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4-イソプロトキシ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 312) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4-シクロプロピルメトキシ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 313) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 [4-(2-ジメチルアミノ-エトキシ)-ピリジン-3-イル] -アミド
 ;
 314) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 [4-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-ピリジン-3-イル] - 20
 アミド;
 315) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (2-クロロ-4-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 316) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (6-クロロ-5-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 317) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (2-クロロ-5-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 318) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (2, 5-ジクロロ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 319) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7 30
 ーカルボン酸 (4, 6-ジクロロ-ピリミジン-5-イル) -アミド;
 320) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 321) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (6-ジメチルアミノ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 322) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (6-アセチルアミノ-ピリジン-3-イル) -アミド;
 323) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 [6-(2-モルホリン-4-イル-エトキシ)-ピリジン-3-イル] - 40
 アミド;
 324) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 325) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4-エトキシ-6-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 326) 2-(4-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7
 ーカルボン酸 (4-エチルスルホニル-6-メチル-ピリジン-3-イル) -アミド;
 327) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イ
 ミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド;
 328) 2-(4-メタンスルホニルメチル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-
 b] ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド; 50

329) 2-(4-ジエチルアミノ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド;

330) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド;

331) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド;

332) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

333) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

334) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

335) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

336) 2-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸ピリジン-3-イルアミド;

337) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

338) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

339) 2-[4-(3-モルホリン-4-イル-プロピルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

340) 2-[4-(3-ピロリジン-1-イル-プロピルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

341) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

342) 2-[4-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

343) 2-[4-(4-ジメチルアミノ-ブチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

344) 2-{[4-(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

345) 2-[4-(4-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチン-2-イル)-アミド;

346) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチン-2-イル)-アミド;

347) 2-[4-(ピペリジン-4-イルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチン-2-イル)-アミド;

348) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ

10

20

30

40

50

- ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド ;
- 349) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b]
] ピリジン7-カルボン酸アダマンタン-2-イルアミド ;
- 350) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ
ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘプチルアミド ;
- 351) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b]
] ピリジン7-カルボン酸シクロヘプチルアミド ;
- 352) 2-(4-チオモルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5
-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘプチルアミド ;
- 353) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ 10
ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1-アザ-ビスクロ [2. 2. 2] オクチ
ン-3-イル)-アミド ;
- 354) 2-[4-(ピペリジン-4-イルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4,
5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 355) 2-[4-(2-ピペラジン-1-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 356) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 357) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] 20
] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 358) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ
ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 359) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミ
ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 360) 2-{4-[(2-ジエチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ] -フェニル
}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 361) 2-[4-(4-エチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ
ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸シクロヘキシルアミド ;
- 362) 2-(4-モルホリン-4-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] 30
] ピリジン7-カルボン酸(1-アザ-ビスクロ [2. 2. 2] オクチン-3-イル)-ア
ミド ;
- 363) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(2, 6, 6-トリメチル-ビスクロ
[3. 1. 1] ヘプチン-3-イル)-アミド ;
- 364) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸-ビスクロ [2. 2. 1] ヘプチン-
2-イルアミド ;
- 365) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(2, 6-ジメチル-フェニル)-アミ
ド ; 40
- 366) 2-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビスクロ
[2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド ;
- 367) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-ヒドロキシ-シクロヘキシル)-
アミド ;
- 368) 2-[4-(2-モルホリン-4-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H
-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビスクロ
[2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド ;
- 369) 2-[4-(2-ピペラジン-1-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H 50

ーイミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド;

370) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド;

371) 2-[4-(4-メチルーピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸ビシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イルアミド;

372) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸ビシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イルアミド; 10

373) 2-[4-(2-ピペリジン-1-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸ビシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イルアミド;

374) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸ビシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イルアミド;

375) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(3-アミノ-シクロヘキシル)-アミド;

376) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド; 20

377) 2-[4-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド;

378) 2-[4-(2-ピロリジン-1-イル-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド;

379) 2-{4-[3-(4-メチルーピペラジン-1-イル)-プロピルアミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド; 30

380) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチルーエチル)-アミド;

381) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 1-ジメチループロピル)-アミド;

382) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(3, 3, 5-トリメチルーシクロヘキシル)-アミド;

383) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸-ターシャリブチルアミド; 40

384) 2-[4-(3-ジエチルアミノ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(1, 7, 7-トリメチルービシクロ [2. 2. 1] ヘプチン-2-イル)-アミド;

385) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(2-ジエチルアミノ-1-メチルーエチル)-アミド;

386) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(2-エトキシ-フェニル)-アミド;

387) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミ 50

ダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ヒドロキシ-シクロペンチル)-アミド;

388) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1-ヒドロキシメチル-シクロペンチル)-アミド;

389) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(3-イミダゾ-1-イル-プロピル)-アミド;

390) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[3-(4, 5-ジクロロ-イミダゾ-1-イル)-プロピル]-アミド;

391) 2-[4-(3-ピロリジン-1-イル-プロピルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(2-ピリジン-3-イル-エチル)-アミド;

392) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1, 3, 3-トリメチル-ブチル)-アミド;

393) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1, 4-ジメチル-ペンチル)-アミド;

394) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1-エチル-プロピル)-アミド;

395) 2-[4-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1, 1, 3, 3-テトラメチル-ブチル)-アミド;

396) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

397) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

398) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

399) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

400) 2-[4-(4-ジメチルアミノ-ブチルアミノ)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

401) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

402) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

403) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

404) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

405) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

406) 2-[4-(3-ジエチルアミノ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

407) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミ

10

20

30

40

50

ダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

408) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

409) 2-[4-(3-ジエチルアミノ-ピロリジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

410) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

411) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

412) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

413) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

414) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

415) 2-(4-ピロリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

416) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

417) 2-(4-ピペリジン-1-イル-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

418) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

419) 2-{4-[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4, 6-ジメチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

420) 2-{4-[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

421) 2-{4-[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

422) 2-{4-[(2-ジメチルアミノ-エチル)-メチル-アミノ]-フェニル}-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エチルスルホニル-ピリジン-3-イル)-アミド;

423) 2-[4-(4-メチル-ピペラジン-1-イル)-フェニル]-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシ-6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

424) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

425) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

426) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7-カルボン酸(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;

427) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ [4, 5-b] ピリジン7

10

20

30

40

50

- ーカルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 428) 2-(4-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 429) 6-ブromo-2-(3-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]
 ピリジン-7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 430) 2-(3-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 431) 2-(3-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(6-メトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 432) 2-(3-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 10
 ーカルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 433) 2-(3-メトキシ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 434) 2-ピリジン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 435) 2-ピリジン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 436) 2-ピリジン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(2-クロロ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 437) 2-ピリジン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル 20
 ボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 438) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 439) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(2-クロロ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 440) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(6-クロロ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 441) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 442) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル 30
 ボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 443) 2-ピリジン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(6-メトキシ-4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 444) 2-ピリジン-4-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 445) 2-ピリジン-4-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 446) 2-ピリジン-4-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カル
 ボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 447) 2-(3-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7 40
 ーカルボン酸(4-エトキシ-ピリジン-3-イル)-アミド;
 448) 2-(3-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 449) 2-(3-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7
 ーカルボン酸(1, 7, 7-トリメチル-ビシクロ[2. 2. 1]ヘプチン-2-イル)-
 アミド;
 450) 2-(3-クロロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7
 ーカルボン酸(6-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;
 451) 2-(3-フルオロ-フェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン 50
 7-カルボン酸(4-メチル-ピリジン-3-イル)-アミド;

452) 6-ブロモ-2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-メチルピリジン-3-イル)-アミド;

453) 2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(1,7,7-トリメチル-ビスクロ[2.2.1]ヘプチン-2-イル)-アミド;

454) 2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(6-メチルピリジン-3-イル)-アミド;

455) 2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシピリジン-3-イル)-アミド;

456) 2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エチルスルホニルピリジン-3-イル)-アミド;

10

457) 6-ブロモ-2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシ-6-メチルピリジン-3-イル)-アミド;
および、

458) 2-(3-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸(4-エトキシ-6-メチルピリジン-3-イル)-アミド;

【請求項4】

1) 下記化学式2の化合物を触媒の存在下で水素添加反応させて、下記化学式3の化合物を調製する段階;

2) 下記化学式3の化合物と $R_1-(CO_2H)$ または、 $R_1-(CHO)$ の混合物を有機酸の存在下で加熱還流するか、ニトロベンゼン下でマイクロウェーブを用いて混合物を加熱し、下記化学式4の化合物を調製する段階;

20

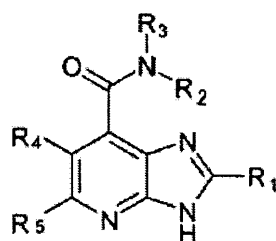
3) 下記化学式4の化合物を、アルカリ水酸化物または、有機溶媒中で酸化剤と反応させ、得た混合物をアイスバス(ice bath)で冷却した後、これにチオニルクロライド($SOCl_2$)または、硫酸(H_2SO_4)を加えて得た混合物を加熱還流して下記化学式5の化合物を調製する段階;

4) 下記化学式5の化合物を、溶媒中で $LiOH \cdot H_2O$ とともに加熱還流し、それに酸を添加して下記化学式6の化合物を調製する段階;および、

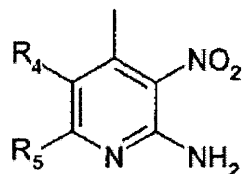
5) 下記化学式6の化合物を有機溶媒中でカップリング剤の存在下で R_2R_3NH と反応させ、下記化学式1の化合物を得る段階を含む、下記化学式1の化合物の調製方法;

30

【化1】

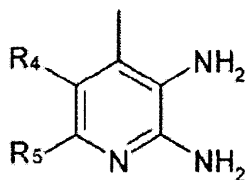


【化2】

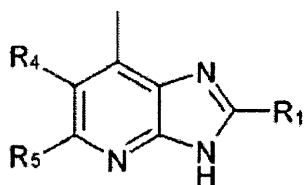


40

【化 3】

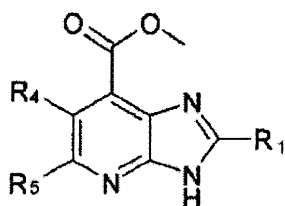


【化 4】



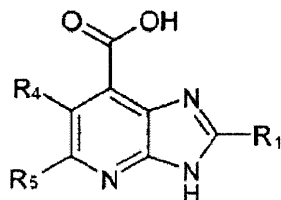
10

【化 5】



20

【化 6】



30

前記化学式の中で、 R_1 乃至 R_5 は、請求項 1 で定義したものと同様である。

【請求項 5】

請求項 4 において、

段階 1) で用いられた触媒が 5 ～ 10 % の Pd / C または、 PtO_2 であることを特徴とする方法。

【請求項 6】

請求項 4 において、

段階 2) で用いられた有機酸が、 $POCl_3$ または、リン酸 (PPA) であることを特徴とする方法。

【請求項 7】

請求項 4 において、

段階 3) で用いられたアルカリ水酸化物が、 $NaOH$ 、 $NaHCO_3$ 、または、 Na_2CO_3 であることを特徴とする方法。

40

【請求項 8】

請求項 4 において、

段階 3) で用いられた有機溶媒が、ピリジンまたは、 $t-BuOH$ であることを特徴とする方法。

【請求項 9】

請求項 4 において、

段階 3) で用いられた酸化剤が $KMnO_4$ 、 MnO_2 、または、 SeO_2 であることを

50

特徴とする方法。

【請求項 10】

請求項 4 において、

段階 4) で用いられた溶媒が水、MeOH および、THF の混合物であることを特徴とする方法。

【請求項 11】

請求項 4 において、

段階 4) で用いられた酸が HCl であることを特徴とする方法。

【請求項 12】

請求項 4 において、

段階 5) で用いられた有機溶媒が、ジメチルフォルムアミド (DMF)、ジメチルスルホキシド (DMSO)、メチレンクロライド (MC) であることを特徴とする方法。

【請求項 13】

請求項 4 において、

段階 5) で用いられたカップリング剤が、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール (HOBt) / 1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド HCl 塩 (EDC) / トリエチルアミン (Et₃N)、(ベンゾトリアゾール-1-イル-オキシ) トリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート (pyBop)、O-ベンゾトリアゾール-N、N、N'、N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート (HBTU) また O-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N、N、N'、N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート (TBTU) であることを特徴とする方法。

【請求項 14】

請求項 1 に記載の化学式 1 の化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を有効成分として含むたんぱく質キナーゼ阻害用組成物。

【請求項 15】

請求項 4 において、

上記たんぱく質キナーゼが、グリコーゲン合成酵素キナーゼ-3 (GSK-3)、オーロラキナーゼ、細胞外信号調節キナーゼ (ERK)、たんぱく質キナーゼ B (AKT)、サクリン依存キナーゼ (CDK)、p38 (protein38) ミトゲン活性たんぱく質キナーゼ (MAPK)、キナーゼドメイン領域キナーゼ (KDR)、または、血管内皮成長因子収容体-2 (VEGFR-2)、c-ジューン-N-ターミナルキナーゼ (JNK)、及び、ピルベートデハイドロゲナーゼキナーゼ (PDK) からなる群の中から選択されるものであることを特徴とする組成物。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の化学式 1 の化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を有効成分として含む糖尿病、肥満、認知症、がん、および炎症の中から選ばれた疾患の予防および治療用薬学組成物。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、たんぱく質キナーゼ (protein kinase) の活性を阻害する新規化合物、この製造方法およびこれを有効成分として含む薬学組成物に係るものである。

【背景技術】

【0002】

たんぱく質キナーゼは、ヌクレオシド 3 リン酸 (nucleoside triphosphate, NTP) から得られたホスホリル基 (phosphoryl group) を特定のたんぱく質に伝達してリン酸化することで、細胞内信号伝達を媒介する酵素である。多くのたんぱく質キナーゼが幾つかの信号伝達経路に関与しているとして報告されていて、これは、細胞増殖、分化、及び死滅等の細胞作用を調節している (非特許文献 1)。

10

20

30

40

50

【非特許文献1】Schlessinger等, Neuron, 9, 383, 1992

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0003】

よって、たんぱく質キナーゼの活性に異常が生じる場合、様々の疾病を引き起こす恐れがあり、例えばアルツハイマーのような中枢神経障害(Mandelkow, E.M.等、FEBS Lett., 314, 315, 1992; Sengupta, A.等、Mol. Cell. Biochem., 167, 99, 1997)、炎症性疾患(Badger, J. Pharm. Exp. Ther., 279, 1453, 1996)、乾癬(Dvir等、J. Cell Biol., 113, 857, 1991)、骨多孔症のような骨疾患(Tanaka 等、Nature, 383, 528, 1996)、癌(Hunter等、Cell, 79, 573, 1994)、動脈硬化症(Hajjar等、FASEB J., 6, 2933, 1992)、血栓症(Salari, FEBS, 263, 104, 1990)、糖尿病のような代謝障害(Borthwick, A.C.等、Biochem. Biophys. Res. Commun., 210, 738, 1995)、血管新生のような血管増殖性障害(Strawn等、Cancer Res., 56, 3540, 1996; Jackson等、J. Pharm. Exp. Ther., 284, 687, 1998)、ステント再狭窄(Buchdunger等、Proc. Nat. Acad. Sci. USA, 92, 2258, 1991)、移植拒否のような自己免疫疾患(Bolen等、Ann. Rev. Immunol., 15, 371, 1997)、真菌類感染のような感染性疾患(国際出願公開W09805335号)、慢性心不全症(Lir, I.等、Int. J. Cardiology, 69, 77-82, 1999)、及び慢性閉鎖性肺疾患(Nguyen, L.T.等、Clinical Nutr., 18, 255-257, 1999; Solar, N.等、Eur. Respir. J., 14, 1015-1022, 1997)、等が発病され得る。

【0004】

オーロラキナーゼ(aurora kinase)は、細胞類似分裂(mitosis)に関与する、セリン/トレオニンたんぱく質キナーゼで、乳房(breast)、大腸(colon)、すい臓(pancreas)及び卵巣(ovarian)等の癌細胞から過発現すると知られて、発癌性たんぱく質(oncoprotein)として疑われており(Carvvajal RD等、Clin. Cancer Res., 12(23), 6869-75, 2006)、最近では、米国のバーテクス(Vertex)社で開発したオーロラキナーゼ抑制剤が、ヌードマウスにて腫瘍を抑制することが報告されている(Elizabeth A Harrington等、Nature Medicine, 10, 262-267, 2004)。

【0005】

p38ミトゲン活性化たんぱく質キナーゼ(MAPK)は、c-ジユーン-N-ターミナルキナーゼ(JNK)及び細胞外信号調節キナーゼ(ERK)等のようなプロリン指向性セリン/トレオニンキナーゼ(proline-directed Ser/Thr kinase)で、細菌による脂質多糖類、物理化学的ストレス、及び腫瘍壊死因子(TNF- α)及びインターロイキン-1(IL-1)等の前炎症性サイトカイン(pro-inflammatory cytokine)により活性化され、TNF- α 、IL-8、IL-1、およびシクロオキシゲナーゼ-2などの炎症性サイトカインを発現させる信号伝達経路に関与していると知られている。

【0006】

p38MAPKにより発現する、このような炎症性サイトカインの内TNF- α は、リウマチ性炎症、複合硬化および喘息などの各種炎症疾患だけでなく、人間免疫欠乏ウイルス(HIV)、インフルエンザウイルス及びヘルペスウイルス等の細菌性感染にも係わっていると知られている(Newton R等、BioDrugs, 17(2), 113-129, 2003)。また、IL-8は、単核細胞、繊維毛細胞、内皮細胞およびケラチン細胞等に発現し炎症疾患に関与していると知られていて、IL-1は、活性化した単核細胞及び大食細胞に発現しリウマチ炎症、発熱、および骨の再吸収減少等の炎症疾患に係わっていると知られている(Bryan Coburn 等、British Journal of Cancer, 95, 1568-1575, 2006)。

【0007】

c-ジユーン-N-ターミナルキナーゼ(JNK)は、Fas/FasL結合、IL-1およびTNF- α 等のサイトカイン、並びにUV、K恒常性変化及び浸透圧等の細胞外刺激によって活性化しAP1転写因子複合体を活性化させる信号伝達経路を媒介し、細胞死滅(apoptosis)および炎症疾患に関与していると知られている(Samadder, P. 等、J. Med. Chem., 47(10), 2710-2713, 2004)。

【0008】

細胞外信号調節キナーゼ(ERK)は、活性化の際Rsk90(Bjorbaek等, J. Biol. Chem., 270, 18848, 1995) 及び、 MAPKAP2(Rouse等, Cell, 78, 1027, 1994) 等のたんぱく質キナーゼ及び ATF2(Raingaud等, Mol. Cell Biol., 16, 1247, 1996), Elk-1(Raingaud 等, Mol. Cell Biol., 16(3), 1247-55, 1996), c-Fos(Chen等, Proc. Natl. Acad. Sci. US A, 90, 10952, 1993) 及び c-Myc(Oliver等, Proc. Soc. Exp. Biol. Med., 210, 162, 1995)等の転写因子を活性化し数々の発癌性たんぱく質の発現を媒介していると知られている。また、ERKは、人の乳がんで過剰発現され(Sivaraman 等, J. Clin. Invest., 99, 1478, 1997) 乳がん細胞の陰性成長等を調節していると知られていて(Frey 等, Cancer Res., 57, 628, 1997)、喘息等の疾患にも関与していると報告されている(Whelchel et al, Am. J. Respir. Cell Mol. Biol., 16, 589, 1997)。

【0009】

サイクリン依存キナーゼ(CDK)は、細胞周期においてG1/S転移およびG2/M転移に重要な働きをし(Kim Nasmyth, Science, 274, 1643-1677, 1996)細胞成長を調節していると知られている。特に、過度な細胞成長を示すがん細胞等にてCDK、または、これらのレギュレータをコーディングする遺伝子の変異が確認されている(Webster, Exp. Opin. Invest. Drugs, 7, 865-887, 1998)。

たんぱく質キナーゼB(PKB又は、AKT)は、血小板成長因子(PDGF)、神経成長因子(NGF)、および、インスリン類似成長因子(IGF-1)等の成長因子によって活性化したホスファチジル・イノシトール3キナーゼ(PI3K)によって活性化し(Kulik 等, Mol. Cell Biol., 17, 1595-1606, 1997; および Hemmings, B. A., Science, 275, 628-630, 1997)、インスリン代謝(Calera, M. R. 等, J. Biol. Chem., 273, 7201-7204, 1998)、細胞分化及び/また、増殖、並び、たんぱく質合成ストレス反応(Alessi, D. R. 等, Curr. Opin. Genet. Dev., 8, 55-62, 1998)等に関与することが知られている。

【0010】

また、AKTもやはり、様々な癌にて過剰発現していると報告されており(Khwaja, A., Nature, 401, 33-34, 1999; Yuan, Z.Q. 等, Oncogene, 19, 2324-2330, 2000; および、 Namikawa, K., 等, J. Neurosci., 20, 2875-2886, 2000)、特に卵巣がん(Cheng, J. Q. 等, Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 89, 9267-9271, 1992)およびすい臓がんにての過剰発現が報告されている(Cheng, J. Q. 等, Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 93, 3636-3641, 1996)。

【0011】

糖尿病および認知症等の治療のための代表的たんぱく質として知られているグリコーゲン合成酵素キナーゼ-3(glycogen synthase kinase-3, GSK-3)は、グリコーゲン合成酵素(glycogen synthase, GS)をリン酸化させ、その活性を阻害する酵素である。実際に肥満性ねずみの脂肪組織ではGSK-3の酵素活性が対照群に比べ2倍ほど高く(H. Eldar-Finkelman, Diabetes, 48, 1662-1666, 1999)、第2型糖尿病患者にても正常人に比べGSK-3の活性および発現量が相当高いことが報告されている(S. E. Nikoulina 等, Diabetes, 49, 263-271, 2000)。

【0012】

これにて、本願発明者等は、このようなたんぱく質キナーゼを効果的に阻害できる化合物に対して鋭意研究した結果、本発明によるイミダゾピリジン化合物が、グリコーゲン合成酵素キナーゼ-3(GSK-3)、オーロラキナーゼ、細胞外信号調節キナーゼ(ERK)、サイクリン依存キナーゼ(CDK)、p38(protein 38)ミトゲン活性たんぱく質キナーゼ(MAPK)、キナーゼドメイン領域キナーゼ(KDR)、または、血管内皮成長因子収容体-2(VEGFR-2)、c-ジユン-Nターミナルキナーゼ(JNK)、及び、ピルベートデハイドロゲナーゼキナーゼ(PDK)等を含むたんぱく質キナーゼの活性を効果的に阻害するのを見出し、本発明はなされた。

【課題を解決するための手段】

【0013】

本発明の目的は、たんぱく質キナーゼの活性を効果的に阻害できる新規の化合物、およびその薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を提供することである。

【0014】

本発明の別の目的は、前記化合物の製造方法を提供することである。

【0015】

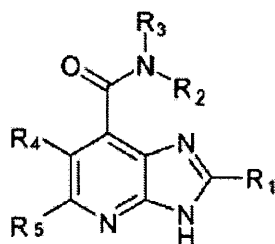
本発明の別の目的は、前記化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を含む薬学組成物を提供することである。

【0016】

前記の目的により、本発明では、下記の化学式1のイミダゾピリジン化合物、およびその薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を提供する。

【0017】

【化1】



前記の式において、

R₁は、非置換されるか、ハロゲン、-CN、NO₂、C₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルキルピペラジニル、C₁₋₆アルキルスルフィニルC₁₋₆アルキル、ピペリジニル、モルホリニル、ピロリジニル、モルホリニルC₁₋₆アルキルアミノ、ピロリジニルC₁₋₆アルキルアミノ、-OR'、-C(O)OR'、-OC(O)R'、-NR'R''、-NHC(O)R'、-C(O)NR'R''、-NHC(S)R'、-C(S)NR'R''、-SR'、-S(O)R'、-SO₂R'、-NHSO₂R'、-SO₂NR'R''、-OSO₂R'、-SO₂OR'、アリル、ヘテロアリル、アリル-C₁₋₄アルキル、ホルミル、または、トリフルオロメチルに置換されたヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルキルスルホニル、アミド、アリル、または、ヘテロアリルで、

(ここで、R'または、R''は、各々独立して

水素、または、

非置換されるか、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、(C₁₋₄アルキル)アミノ、OH、COOH、-COO(C₁₋₄アルキル)、-CONH₂、ホルミル、または、トリフルオロメチルに置換されたC₁₋₄アルキル、C₃₋₇シクロアルキル、アリル、または、ヘテロアリルで、

アリルは、フェニル、インダニル、または、ナフチルで、

ヘテロアリルは、環の内1つ以上のN、Oまたは、Sを含む5-10員環アリル、または、モノ-またはバイサイクリックヘテロアリル)で；

R₂は、

水素；

非置換されるか置換されたC₁₋₈アルキル；または、環構造内にN、Sまたは、Oを含む、非置換されるか置換されたC₁₋₇アルキル、

ここで、前記アルキルの置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルカンスルホニル、または、アミド；

C₁₋₄アルキル、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、アミノC₁₋₆アルキル、アセチルアミノ、カルボキシル、アミド、ジオキソインドール、-CN、NO₂、-OR'、-C(O)OR'、-OC(O)R'、-NR'R''、-NHC(O)R'、-NHC(O)OR'、-C(O)NR'R''、-NHC(S)R'、-C(S)NR'R''

' , -SR' , -S(O)R' , -SO₂R' , -NHSO₂R' , -SO₂NR'R'' , -OSO₂R' , -SO₂OR'、アリル、ヘテロアリル、アリル-C₁₋₄アルキル、ホルミルまたは、トリフルオロメチルに置換されたアリル、または、ヘテロアリル

(ここで、R' または、R'' は、各々独立して

水素、または、

非置換されるか、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、(C₁₋₄アルキル)アミノ、OH、COOH、-COOC₁₋₄アルキル、-CONH₂、ホルミル、C₁₋₆アルキルピペリジニル、モルホリニル、または、トリフルオロメチルに置換されたC₁₋₄アルキル、C₃₋₇サイコロアルキル、アリル、または、ヘテロアリルで、

アリルは、フェニル、インダニル、または、ナフチルで、

10

ヘテロアリルは、環構造内に1つ乃至4つのN、Sまたは、Oを含む5-10員環アリル、ピリドンまたは、モノもしくは、バイサイクリックヘテロサイクルである) ; または、非置換されるか置換されたアリル、または、環構造内にN、Sまたは、Oを含む、非置換されるか置換されたアリル、

(ここで、前記アリルの置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルカンスルホニル、または、アミド ;

非置換されるか置換されたC₁₋₆アルキル ; または、

環構造内にN、Sまたは、Oを含むC₁₋₆アルキルで、

20

前記アルキルの置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルキルスルホニル、または、アミド ;

非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、アミド、または、ジオキソイソインドールに置換されたアリル ;

ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルキルスルホニル、または、アミドに置換されたアリル基を有するスルホニルアミノアリル ;

非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、C₁₋₆アルカンスルホニル、または、アミドに置換され、且つ、環構造内に1つ以上のN、Sまたは、Oを含むアリル ; または、

30

非置換されるか、ヒドロキシ、ハロゲン、C₁₋₆アルキルオキシ、C₁₋₆アルキル、アミノ、C₁₋₆アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、または、アミドに置換されたC₃₋₈サイコロアルキルで、

前記の「環構造内に、N、Sまたは、Oを含むアリル」は、ピロル ; ピラゾール ; イミダゾール ; 1, 2, 3-トリアゾール ; イソオキサゾール ; オキサゾール ; イソチアゾール ; チアゾールリジン ; チアゾール ; 1, 2, 5-オキサジアゾール ; 1, 2, 3-オキサジアゾール ; 1, 2, 5-チオジアゾール ; 1, 2, 3-シオジアゾール ; 1, 3, 4-オキサジアゾール ; 1, 3, 4-シオジアゾール ; ピリジン ; オキシピリジン ; ピリミジン ; または、トリアジンである) で、

40

R₃は、水素 ; または、非置換されるか、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、C₁₋₄アルキルアミノ、アミノC₁₋₄アルキル、OH、COOH、-COOC₁₋₄アルキル、-CONH₂の中から選ばれた1つ以上の置換基で置換されたC₁₋₄アルキルまたは、C₃₋₇サイコロアルキル (ここで、前記置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキルオキシ、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルキルスルホニル、または、アミドである) であるか、

R₂ およびR₃ は、これらが付いている窒素原子とともに環を形成することができ ;

R₄ およびR₅ は、各々独立的に水素 ; または、非置換されるか、ハロゲン、C₁₋₄アルキル、C₁₋₄アルコキシ、CN、NO₂、NH₂、(C₁₋₄アルキル)-アミノ、アミノ-(C₁₋₄

50

アルキル)、OH、COOH、 -COO (C_{1-4} アルキル)、および、 -CONH_2 の中から選ばれた置換基で置換された C_{1-4} アルキルまたは、 C_{3-7} サイコロアルキル(ここで、前記置換基は、ヒドロキシ、ハロゲン、アルキルオキシ、アルキル、アミノ、アルキルアミノ、カルボキシル、ニトロ、スルホニルアミド、アルキルスルホニル、または、アミドである)である。

【発明の効果】

【0018】

本発明によれば、たんぱく質キナーゼの活性を阻害するイミダゾピリジン誘導体、これの製造方法およびこれを含む薬学組成物を提供することができる。

【発明を実施するための最良の形態】

【0019】

前記化学式1において、好ましくは、

R_1 は、フェニル、ピロリジニルフェニル、ジクロロフェニル、クロロフェニル、フルオロフェニル、ジフルオロフェニル、フラニル、チオフェニル、シクロプロピル、 C_{1-2} アルキルピペラジニルフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニル C_{1-3} アルキルフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、メタンスルホニルフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノフェニル、モルホリニルフェニル、ピペリジニルフェニル、モルホリニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、ピロリジニル C_{1-3} アルキルアミノフェニル、ジメチルアミノ C_{1-4} アルキルアミノフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノエチルメチルアミノフェニル、ピペラジニルアミノフェニル、ピペラジニル C_{1-2} アルキルアミノフェニル、チオモルホリニルフェニル、ピペリジニルアミノフェニル、ピペリジニル C_{1-2} アルキルアミノフェニル、メトキシフェニル、ジ C_{1-3} アルキルアミノピロリジニルフェニル、または、ピリジニルであり；

R_2 は、非置換されるか、スルホニルフェニル、 C_{1-2} アルキルピリジニル、ジ C_{1-2} アルキル、トリ C_{1-2} アルキル、テトラ C_{1-2} アルキル、ピリジニル、オキシピリジニル、クロロピリジニル、モボリニル、アミノ C_{1-2} アルキルピリジニル、アセチルアミノフェニル、イミダゾール、ジクロロイミダゾール、 C_{1-2} アルキルアミダゾール、ジ C_{1-2} アルキルアミノスルホニルアミノフェニル、トリフルオロ C_{1-2} アルキルフェニル、ベンジルオキシオクソピリジニル、ヒドロキシオクソピリジニル、 C_{1-2} アルカンスルホニルアミノフェニル、ジ C_{1-2} アルキルアミノアセチルアミノフェニル、トリフルオロメタンスルホニルアミノフェニル、フルオロピリジニル、フルオロヒドロキシフェニル、 C_{1-2} アルキルピペラジニルアセチルアミノフェニル、クロロオキシピリジニル、チオフェニル、 C_{1-2} アルキルオキシピリジニル、アミノフェニル、ヒドロキシフェニル、 C_{1-3} アルキルピペラジニルカボニルアミノフェニル、モルホリニル C_{1-3} アルコキシフェニル、ベンジル、ヒドロキシジ C_{1-2} アルキル、または、ジ C_{1-2} アルキルアミノ C_{1-2} アルキル基に置換された C_{1-5} アルキル、

非置換されるか、トリ C_{1-2} アルキル、アミノまたは、水酸基に置換されたシクロ C_{3-7} アルキル、

非置換されるか、 C_{1-2} アルキル、ジ C_{1-2} アルキル、クロロ C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルキルアミノ、アミノ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルコキシ C_{1-2} アルキル、 C_{1-2} アルキルスルホニル、クロロ C_{1-2} アルキル、イソプロトキシ、シクロプロピルメトキシ、ジ C_{1-2} アルキルアミノ C_{1-2} アルコキシ、モルホリニル C_{1-3} アルコキシ、ハロゲン、アセチルアミノ、または、 C_{1-2} アルキルスルホニル C_{1-2} アルキル基に置換されたピリジニル、

非置換されるか、ベンゾイルアミノ、ピペリジニル、ヒドロキシ、 C_{1-2} アルコキシ、 C_{1-2} アルキル、ジ C_{1-2} アルキル、ジイソプロピル、イソプロピル、ジ C_{1-2} アルキルアミノアセチルアミノ、フルオロ C_{1-2} アルキル、フルオロヒドロキシ、トリフルオロ C_{1-2} アルコキシ、ジ C_{1-2} アルキル、アセチルアミノ、シアノ、ベンジルオキシ、トリフルオロメタンスルホニルアミノ、または、 C_{1-2} アルカンスルホニルに置換されたフェニル、

ベンゾシアゾイル、インダゾイル、 C_{1-2} アルキルインドルイル、インドルイル、

10

20

30

40

50

ナフタルレニル、キノリニル、 C_{1-2} アルキルピラゾルイル、フェニルシアゾイル、トルイル、ベンゾジオキソリル、 C_{1-2} アルキルフェニルアセトアミド、 C_{1-2} アルキルフェノキシ酢酸、エタンスルホニル C_{1-2} アルキルフェニルアミド、 C_{1-2} アルキルフェノキシ酢酸ターシャリブチルエステル、 C_{1-2} アルキルフェニルメタンスルホンアミド、 C_{1-2} アルキルピペラジニル、 C_{1-2} アルコキシフェニルアミド、ピペリジニル、ベンジルピペリジニル、トリ C_{1-2} アルキルビスクロヘプチニル、アダマンタニル、アミノビスクロヘプタンカボキシル、アザビスクロオクチル、ビスクロヘプチニル、ターシャリブチルアミド、または、 C_{1-2} アルキルピリジニル C_{1-2} アルキルカバミク酸ターシャリブチルエステルで、

R_3 は、Hであるか、

R_2 および、 R_3 は、それらが付着している窒素原子と共に環を形成することができ；

R_4 は、Hまたは、ハロゲンで；

R_5 は、Hである。

【0020】

本発明による化合物の代表的な例を下記の表1-1～1-74に提示している。

【0021】

【表 1 - 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
1	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.07 (s, 3H), 2.99 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.57~7.49 (m, 5H), 8.06 (m, 2H), 8.55 (d, 1H)	399.5
2	(4-{2-[(2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl)-amino]-ethyl}-phenoxy)-acetic acid		2.97 (t, 2H), 3.84 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 6.82 (d, 1H), 6.85 (s, 1H), 6.84 (d, 1H), 7.11 (t, 1H), 7.54 (t, 3H), 7.70 (d, 2H), 7.99 (d, 2H), 8.29 (d, 1H)	416.4
3	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.98 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 6.67 (m, 1H), 6.79 (m, 2H), 7.56 (m, 3H), 7.79 (d, 1H), 8.06 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	358.4
4	(3-{2-[(2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl)-amino]-ethyl}-phenoxy)-acetic acid		2.95 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 6.86 (d, 1H), 6.78 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.54 (t, 3H), 7.75 (d, 2H), 8.01 (d, 2H), 8.39 (d, 1H)	416.4
5	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.19 (t, 3H), 2.93 (t, 2H), 2.98 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.60 (m, 3H), 7.78 (d, 1H), 8.11 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	449.5
6	(3-{2-[(2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl)-amino]-ethyl}-phenoxy)-acetic acid tert-butylester		1.43 (s, 9H), 2.97 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 6.86 (d, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.54 (t, 3H), 7.75 (d, 2H), 8.01 (d, 2H), 8.39 (d, 1H)	472.5
7	(4-{2-[(2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl)-amino]-ethyl}-phenoxy)-acetic acid tert-butylester		1.28 (s, 9H), 2.97 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.49 (s, 2H), 6.83 (d, 2H), 7.27 (d, 2H), 7.57 (m, 3H), 7.78 (d, 1H), 8.05 (m, 2H), 8.42 (d, 1H)	472.5

【0022】

【表 1 - 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
8	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.90 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 6.77 (m, 1H), 6.99~6.78 (m, 2H), 7.57 (m, 3H), 7.79 (d, 1H), 8.05 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	376.4
9	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.95(d, 2H), 3.86 (t, 2H), 6.66 (t, 2H), 6.80 (m, 2H), 7.12 (t, 1H), 7.59 (m, 3H), 7.80 (d, 1H), 8.00 (m, 2H), 8.47 (d, 1H)	358.4
10	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.25 (m, 2H), 3.64 (t, 2H), 4.22 (t, 2H), 7.62 (m, 3H), 7.79 (m, 2H), 8.28 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 7.90 (m, 1H), 8.34 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	417.3
11	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.80 (s, 3H), 3.03 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.35 (d, 1H), 7.79 (m, 3H), 8.11 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	435.5
12	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.3 (t, 1H), 4.12 (t, 2H), 7.63 (m, 3H), 7.72 (d, 1H), 7.96 (t, 1H), 8.11 (d, 1H), 8.23 (m, 2H), 8.51 (m, 2H), 8.72 (d, 1H)	343.4
13	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.30 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 7.59 (m, 3H), 7.78 (d, 1H), 7.91 (m, 1H), 8.15 (m, 2H), 8.43 (d, 1H), 8.67 (m, 1H), 8.83 (s, 1H)	343.4
14	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.36 (t, 2H), 4.05 (t, 2H), 7.65 (m, 2H), 7.79 (d, 1H), 8.14 (d, 2H), 8.23 (m, 2H), 8.47 (d, 1H), 8.73 (m, 2H)	343.4

【 0 0 2 3 】

【表 1 - 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
15	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-morpholin-4-yl-propyl)-amide		2.22 (q, 2H), 3.60 (t, 2H), 4.20 (t, 2H), 3.30~5.00 (br, 8H), 7.79 (m, 2H), 8.28 (m, 2H), 8.49 (d, 1H), 7.90 (m, 1H), 8.34 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	365.4
16	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-2-yl)-ethyl]-amide		3.10 (t, 2H), 3.96 (t, 2H), 7.68~7.85 (m, 4H), 8.15 (d, 2H), 8.30~8.55 (m, 3H), 8.70~8.88 (m, 2H)	359.4
17	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.11 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 7.68~7.85 (m, 3H), 8.00 (m, 1H), 8.15 (d, 2H), 8.35~8.65 (m, 3H), 8.70 (m, 1H), 8.92 (s, 1H)	359.4
18	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.14 (t, 2H), 4.00 (t, 2H), 7.68~7.85 (m, 3H), 8.00 (m, 1H), 8.24 (m, 2H), 8.35~8.65 (m, 4H), 8.70 (m, 1H)	359.4
19	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.06 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 7.39 (d, 1H), 7.63 (m, 3H), 7.84~7.78 (m, 2H), 8.14 (m, 2H), 8.33 (s, 1H), 8.53 (m, 1H)	377.8
20	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.07 (t, 2H), 3.92 (t, 2H), 7.37 (s, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.62 (s, 3H), 7.80 (s, 1H), 8.12 (s, 2H), 8.26 (d, 1H), 8.51 (br, 1H)	377.8

【 0 0 2 4 】

【表 1 - 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
21	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.20 (t, 2H), 3.92 (t, 2H), 7.65~7.80 (m, 3H), 7.88 (d, 1H), 8.05~8.14 (m, 2H), 8.44~8.60 (m, 2H), 8.70 (m, 1H), 8.90 (s, 1H)	377.8
22	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.17 (s, 1H), 5.70 (s, 1H), 7.36 (t, 2H), 7.78 (d, 1H), 7.91 (m, 1H), 8.31 (m, 2H), 8.49 (m, 2H), 8.82 (d, 1H)	372.4
23	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.40 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 4.46 (s, 2H), 7.62 (m, 3H), 7.75 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.08 (s, 1H), 8.26 (m, 1H), 8.45 (s, 1H), 8.78 (d, 1H)	372.4
24	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-benzoylamino-phenyl)-amide		7.10(d, 1H), 7.31-7.62(m, 7H), 7.66(s, 1H), 7.69(m, 1H), 7.81-7.92(m, 3H), 8.23(d, 1H), 8.58(d, 1H), 8.83(s, 1H)	433.5
25	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-piperidin-1-yl-phenyl)-amide		8.26(m, 2H), 8.13~7.92(m, 3H), 7.82~7.38(m, 2H), 7.44~7.56(m, 2H), 7.11(d, 2H), 3.39(m, 2H), 2.55(s, 2H), 1.71(m, 6H)	397.5
26	6-bromo-2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-benzoylamino-phenyl)-amide		7.10(d, 1H), 7.31-7.62(m, 6H), 7.66(s, 1H), 7.67(m, 1H), 7.81-7.92(m, 3H), 8.33(d, 1H), 8.56(d, 1H), 8.87	512.4
27	6-bromo-2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.22 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.63~7.80 (m, 3H), 7.88 (d, 1H), 8.05~8.14 (m, 2H), 8.44~8.60 (m, 1H), 8.70 (m, 1H), 8.90 (s, 1H)	456.7
28	6-bromo-2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-thiophen-2-yl-ethyl)-amide		3.22 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.63~8.10 (m, 2H), 7.68 (d, 1H), 8.05~8.24 (m, 2H), 8.44~8.60 (m, 2H), 8.70 (m, 1H), 8.90(br, 1H)	427.3

【表 1 - 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
29	6-chloro-2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.26 (m, 2H), 3.66 (m, 2H), 4.20 (t, 2H), 7.57(t, 1H), 7.74 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.21 (m, 1H), 8.45 (m, 2H), 8.82(s, 1H)	449.7
30	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid phenylamide		7.21-7.29(m, 7H), 7.38(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.88-7.90 (d, 1H), 8.29-8.35(m, 2H)	314.3
31	2-phenyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		1.36-1.66(m, 5H), 1.62-1.79(m, 5H), 4.01-4.18(m, 1H), 7.18(d, 2H), 7.76(d, 1H), 7.90~8.12(m, 3H), 8.41(d, 1H)	320.4
32	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylaminophenyl)-ethyl]-amide		2.07 (s, 3H), 2.99 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.57~7.49 (m, 5H), 8.06 (m, 2H), 8.55 (d, 1H)	468.3
33	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxyphenyl)-ethyl]-amide		.91 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.62 (d, 1H), 6.73 (m, 2H), 7.05 (t, 1H), 7.56 (m, 1H), 7.72 (s, 1H), 7.82 (m, 2H), 8.52 (d, 1H)	427.3
34	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxyphenyl)-ethyl]-amide		2.95 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.65 (t, 1H), 6.74 (d, 1H), 7.12 (d, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.82 (m, 2H), 8.53 (d, 1H)	427.3
35	[4-(2-[[2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxyl]-amino]-ethyl)-phenoxy]-acetic acid		2.96 (t, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.56 (s, 2H), 6.77 (d, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.62 (d, 1H), 7.81 (m, 3H), 8.53 (d, 1H)	485.3

【表 1 - 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
36	[3-(2-[[2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl]-amino]-ethyl)-phenoxy]-acetic acid		2.93 (t, 2H), 3.79 (t, 2H), 4.56 (s, 2H), 6.81 (d, 1H), 7.23 (s, 1H), 7.22 (d, 1H), 7.82 (m, 3H), 8.56 (d, 1H)	485.3
37	[4-(2-[[2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl]-amino]-ethyl)-phenoxy]-acetic acid tert-butylester		1.45 (s, 9H), 2.92 (t, 2H), 3.78 (t, 2H), 4.48 (s, 2H), 6.77 (d, 2H), 7.21 (d, 2H), 7.60 (d, 1H), 7.79 (m, 3H), 8.52 (d, 1H)	541.4
38	[3-(2-[[2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl]-amino]-ethyl)-phenoxy]-acetic acid tert-butylester		1.43 (s, 9H), 2.97 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 4.38 (s, 2H), 6.86 (d, 1H), 6.87 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.54 (t, 3H), 7.75 (d, 2H), 8.01 (d, 2H), 8.39 (d, 1H)	541.4
39	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.31 (t, 2H), 3.62 (t, 2H), 4.40 (t, 2H), 7.47 (s, 1H), 7.57 (d, 1H), 7.75 (d, 2H), 7.84 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.56 (d, 2H), 8.99 (s, 1H)	417.3
40	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-(2-dimethylamino-acetyl)-phenyl]-ethyl]-amide		3.97 (m, 8H), 3.80 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.83 (m, 2H), 8.53 (d, 1H)	511.4
41	2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-sulfonylphenyl)-ethyl]-amide		3.97 (m, 8H), 3.80 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.59 (d, 1H), 7.72 (s, 1H), 8.03 (m, 2H), 8.73 (d, 1H)	490.4
42	[2-(2-[[2-(2,4-dichloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl]-amino]-ethyl)-phenoxy]-acetic acid		3.07 (t, 3H), 3.86 (t, 2H), 4.64 (s, 2H), 6.80 (m, 3H), 7.15 (m, 3H), 7.54 (d, 1H), 7.74 (s, 1H), 7.81 (m, 2H), 8.52 (d, 1H)	485.3

【表 1 - 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
43	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.19 (t, 3H), 2.99 (q, 2H), 3.02 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.32 (d, 4H), 7.79 (d, 1H), 8.06 (d, 2H), 8.30 (d, 1H)	484.0
44	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.11 (s, 3H), 2.98 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 7.27 (d, 2H), 7.53 (m, 4H), 7.80 (m, 2H), 7.94 (d, 2H), 8.44 (d, 1H)	433.9
45	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.96 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 6.68 (d, 1H), 6.80 (d, 2H), 7.13 (t, 1H), 7.54 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.00 (d, 2H), 8.42 (d, 1H)	392.8
46	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-(2-dimethylamino-acetyl)-amino]-phenyl]-ethyl]-amide		2.86 (s, 6H), 3.02 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 7.30 (d, 2H), 7.54 (d, 4H), 7.79 (d, 1H), 8.03 (d, 2H), 8.44 (d, 1H)	477.0
47	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		2.36 (m, 2H), 3.65 (t, 2H), 4.44 (t, 2H), 7.54 (m, 1H), 7.60 (d, 2H), 7.75 (m, 1H), 7.81 (d, 1H), 8.25 (d, 2H), 8.48 (d, 2H), 9.03 (s, 1H)	380.8
48	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.26 (m, 2H), 3.66 (m, 2H), 4.20 (t, 2H), 7.57 (t, 2H), 7.74 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.45 (d, 1H)	449.7
49	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4-methyl-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.22 (d, 3H), 2.34 (m, 2H), 3.68 (t, 2H), 4.35 (t, 2H), 7.26 (d, 1H), 7.60 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.25 (d, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.85 (d, 1H)	394.9

【表 1 - 8】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
50	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.84 (s, 3H), 3.03 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 7.11 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.56 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.04 (d, 2H), 8.44 (d, 1H)	470.0
51	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.69 (s, 3H), 3.01 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 7.16 (d, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.62 (d, 2H), 7.79 (d, 1H), 8.06 (d, 2H), 8.45 (d, 1H)	499.0
52	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		3.02 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 6.73 (t, 1H), 6.80 (d, 1H), 7.07 (t, 1H), 7.15 (d, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.01 (d, 2H), 8.44 (d, 1H)	392.8
53	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-trifluoromethyl-phenyl)-ethyl]-amide		3.10 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 7.32-7.63 (m, 6H), 7.81 (d, 1H), 7.97 (d, 2H), 8.43 (d, 1H)	444.8
54	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4-benzyloxy-2-oxo-2H-pyridin-1-yl)-propyl]-amide		2.20 (2H, m), 4.00 (2H, t, J=6.4 Hz), 4.20 (2H, t, J=6.4 Hz), 5.05 (2H, s), 6.13 (2H, d, J=5.7 Hz), 6.34 (1H, s), 7.31~7.42 (8H, m), 7.99 (1H, bs), 8.18 (2H, d, J=8.4 Hz), 8.35 (1H, bs), 9.70 (1H, bs)	514.0
55	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-benzyloxy-2-oxo-2H-pyridin-1-yl)-ethyl]-amide		3.97 (2H, t, J=6.0 Hz), 4.23 (2H, t, J=6.0 Hz), 5.02 (2H, s), 5.97 (1H, s), 6.07 (1H, s), 7.31~7.39 (6H, m), 7.52 (2H, J=8.4 Hz), 7.87 (2H, d, J=6.0 Hz), 8.12 (2H, d, J=8.4 Hz), 8.44 (1H, bs), 9.82 (1H, bs)	500.0
56	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-hydroxy-2-oxo-2H-pyridin-1-yl)-ethyl]-amide		3.89 (2H, t, J=5.7 Hz), 4.14 (2H, t, J=5.7 Hz), 5.83 (1H, bs), 7.13 (1H, d, J=7.5 Hz), 7.50~7.60 (2H, m), 7.74~7.79 (2H, m), 8.19~8.22 (2H, m), 8.39 (1H, d, J=6.0 Hz)	409.8

【表 1 - 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
57	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.10 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 7.42-7.63 (m, 5H), 7.91 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.24 (m, 1H), 8.43 (d, 1H)	377.8
58	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.60(s,1H), 9.58(s,1H), 8.56(m,2H), 8.33(m,3H), 7.89(m,2H), 7.68(m,2H), 2.75(s,3H)	363.8
59	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		11.92(s,1H), 9.70(s,1H), 8.60(m,2H), 8.40(d,2H), 7.90(d,1H), 7.79(d,2H), 7.69(d,1H), 4.64(q,2H), 1.45(t,3H)	393.8
60	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.75(s,1H), 9.24(s,1H), 8.60(m,2H), 8.46(d,2H), 7.82(d,2H), 7.71(d,2H), 7.63(m,1H), 2.70(s,3H)	363.8
61	2-(4-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		11.58(s,1H), 9.26(s,1H), 8.55(d,1H), 8.49(d,2H), 8.33(m,1H), 7.85(d,1H), 7.69(d,2H), 7.51(d,1H), 3.26(q,2H), 1.37(t,3H)	409.9
62	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.25 (q, 2H), 3.61 (t, 2H), 4.24 (t, 2H), 6.75 (d, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.76 (m, 1H), 7.84 (m, 2H), 8.45 (d, 1H)	407.3
63	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.88 (s, 3H), 3.00 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.79 (s, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.33 (d, 2H), 7.77 (d, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.50 (d, 1H)	425.5

【表 1 - 1 0】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
64	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.94 (t, 2H), 3.79 (t, 2H), 6.66 (m, 1H), 6.76 (m, 3H), 7.11 (t, 1H), 7.43 (m, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 8.47 (d, 1H)	348.4
65	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.24 (t, 3H), 2.96 (q, 2H), 3.03 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.63 (m, 1H), 7.16 (m, 3H), 7.30 (d, 2H), 7.63 (d, 1H), 7.68 (d, 1H), 8.25 (d, 1H)	439.5
66	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-(2-dimethylamino-acetyl)-amino]-phenyl]-ethyl]-amide		3.02 (6H), 3.19 (t, 2H), 3.79 (t, 2H), 4.09 (s, 2H), 6.74 (m, 1H), 7.32 (m, 3H), 7.52 (d, 2H), 7.73 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)	432.5
67	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4-methyl-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.24 (d, 3H), 2.31 (m, 2H), 3.63 (t, 2H), 4.35 (t, 2H), 6.77 (m, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.89 (s, 1H), 8.46 (d, 1H), 8.88 (d, 1H)	350.4
68	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		1.13 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.60 (m, 1H), 6.76 (m, 2H), 7.01 (m, 1H), 7.18 (m, 2H), 7.60 (d, 1H), 7.71 (m, 2H), 8.24 (d, 1H)	348.4
69	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.69 (s, 6H), 2.99 (t, 2H), 3.79 (t, 2H), 6.66 (m, 1H), 7.14 (d, 2H), 7.21 (d, 1H), 7.26 (d, 2H), 7.69 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 8.30 (d, 1H)	454.5
70	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.41 (t, 2H), 4.05 (t, 2H), 6.80 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.89 (m, 2H), 8.07 (d, 1H), 8.49 (m, 2H), 8.75 (d, 1H)	333.4

【 0 0 3 1 】

【表 1 - 1 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
71	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.38 (t, 2H), 4.00 (t, 2H), 6.80 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.89 (m, 2H), 8.02 (m, 1H), 8.75 (m, 2H), 8.89 (s, 1H)	333.4
72	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.36 (t, 2H), 4.05 (t, 2H), 6.77 (d, 1H), 7.41 (d, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 8.09 (d, 2H), 8.43 (d, 1H), 8.73 (d, 2H)	333.4
73	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.93 (t, 2H), 3.81 (t, 2H), 6.76 (m, 2H), 6.91 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.32 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.45 (d, 1H)	366.4
74	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		2.36 (q, 2H), 3.66 (t, 2H), 4.46 (t, 2H), 6.78 (s, 1H), 7.47 (d, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.90 (d, 1H), 8.47 (d, 1H), 9.09 (s, 1H)	336.4
75	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-2-yl)-ethyl]-amide		3.46 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 6.84 (m, 1H), 7.50 (m, 1H), 7.64 (m, 2H), 7.71 (m, 2H), 7.99 (s, 1H), 8.48 (d, 1H), 8.52 (d, 1H)	349.4
76	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.1 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 6.78 (m, 1H), 7.45 (d, 1H), 7.55 (t, 1H), 7.75 (d, 2H), 7.91 (s, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.47 (m, 2H)	349.4
77	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.16 (t, 2H), 3.92 (t, 2H), 6.78 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.64 (d, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.82 (m, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.33 (d, 2H), 8.46 (d, 1H)	349.4

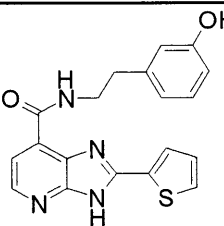
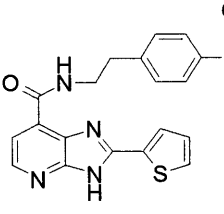
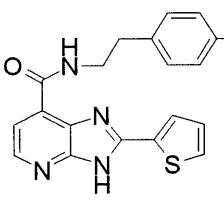
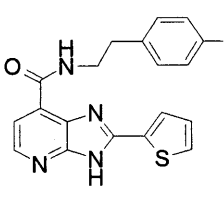
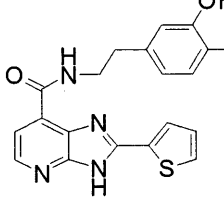
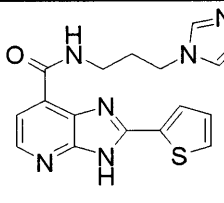
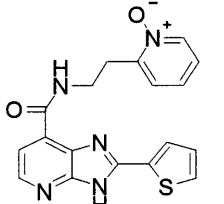
【表 1 - 1 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
78	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.08 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 6.76 (s, 1H), 7.37 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 8.25 (d, 1H), 8.45 (br, 1H)	367.8
79	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.37 (t, 2H), 3.96 (t, 2H), 7.69 (m, 2H), 7.83 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.51 (br, 1H), 8.80 (br, 1H)	367.8
80	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 4.17 (s, 1H), 5.71 (s, 1H), 6.78 (s, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.86 (m, 2H), 8.43~8.53 (m, 2H), 8.81 (m, 1H)	362.4
81	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-3-yl-propyl)-amide		2.18 (t, 2H), 3.08 (t, 2H), 3.65 (t, 2H), 6.76 (s, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.99 (m, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.63 (m, 2H), 8.83 (s, 1H)	347.4
82	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-trifluoromethane sulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		3.03 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 6.73 (s, 1H), 7.21 (d, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.38 (d, 2H), 7.75 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 8.42 (d, 1H)	479.4
83	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.08 (t, 2H), 2.86 (t, 2H), 3.62 (t, 2H), 7.16 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.73 (s, 2H), 7.85 (d, 1H), 8.21 (d, 1H), 8.27 (s, 1H), 8.44 (s, 1H)	381.8
84	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-4-yl-propyl)-amide		2.22 (m, 2H), 3.18 (t, 2H), 3.66 (t, 2H), 6.76 (s, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.05 (d, 2H), 8.46 (d, 1H), 8.68 (d, 2H)	347.4

【表 1 - 1 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
85	2-furan-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-fluoro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.12 (t, 2H), 2.90 (t, 2H), 3.63 (t, 2H), 7.01 (s, 1H), 7.23 (d, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.77 (m, 1H), 7.83 (m, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.43 (m, 2H)	365.4
86	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.21 (t, 3H), 2.98 (m, 4H), 3.83 (t, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.27 (m, 1H), 7.33 (d, 2H), 7.76 (m, 2H), 7.91 (m, 1H), 8.41 (d, 1H)	455.6
87	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(5-methyl-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.22 (d, 3H), 2.34 (m, 2H), 3.68 (t, 2H), 4.35 (t, 2H), 7.29 (m, 1H), 7.74 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 7.91 (d, 2H), 8.41 (d, 1H), 8.88 (d, 1H)	368.5
88	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.50 (t, 2H), 4.09 (t, 2H), 7.30 (t, 1H), 7.65 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.98 (m, 2H), 8.18 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.45 (t, 1H), 8.75 (d, 1H)	349.4
89	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.31 (t, 2H), 3.95 (t, 2H), 7.28 (t, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.85 (d, 1H), 7.95 (d, 1H), 8.05 (m, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.73 (m, 1H), 8.89 (s, 1H)	349.4
90	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.41 (t, 2H), 4.05 (t, 2H), 7.31 (m, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.99 (d, 1H), 8.18 (d, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.80 (d, 2H)	349.4
91	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		3.15 (t, 2H), 3.90 (t, 3H), 6.80 (m, 2H), 7.10 (d, 1H), 7.29 (m, 2H), 7.80 (m, 2H), 7.91 (m, 1H), 8.41 (d, 1H)	364.4

【表 1 - 1 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
92	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.95 (t, 2H), 3.95 (t, 3H), 6.62 (m, 1H), 6.81 (m, 2H), 7.15 (d, 1H), 7.29 (m, 1H), 7.79 (m, 2H), 7.99 (m, 1H), 8.45 (d, 1H)	364.4
93	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-(2-dimethylamino-acetylamino)-phenyl]-ethyl]-amide		3.00 (s, 3H), 3.05 (t, 2H), 4.09 (s, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.39 (d, 2H), 7.58 (d, 2H), 7.95 (d, 1H), 8.42 (d, 1H)	448.6
94	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.68 (s, 6H), 3.31 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.19 (m, 2H), 7.33 (m, 3H), 7.79 (m, 2H), 7.91 (m, 1H), 8.43 (m, 1H)	470.6
95	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.86 (s, 3H), 3.01 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 7.21~7.40 (m, 5H), 7.77 (d, 2m), 7.91 (d, 1H), 8.42 (d, 1H)	441.5
96	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.94 (t, 2H), 3.83 (t, 2H), 6.79 (s, 1H), 6.90~6.98 (m, 2H), 7.27 (t, 1H), 7.77 (t, 2H), 7.92 (d, 1H), 8.43 (m, 1H)	382.4
97	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		2.37 (t, 2H), 3.67 (t, 2H), 4.48 (t, 2H), 7.30 (t, 1H), 7.58 (s, 1H), 7.78 (m, 3H), 8.00 (d, 1H), 8.45 (d, 1H), 9.07 (s, 1H)	352.4
98	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-2-yl)-ethyl]-amide		3.14 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 7.56 (t, 1H), 7.72 (m, 1H), 7.76 (m, 2H), 7.83 (d, 1H), 8.30 (d, 1H), 8.49 (m, 2H), 8.51 (d, 1H)	365.4

【表 1 - 1 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
99	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.15 (t, 2H), 3.92 (t, 2H), 7.31 (t, 2H), 7.59 (t, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.82 (m, 2H), 8.04 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.47 (d, 1H), 8.51 (s, 1H)	365.4
100	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.16 (t, 2H), 3.98 (t, 2H), 7.41 (t, 2H), 7.63 (t, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.01 (m, 2H), 8.04 (d, 1H), 8.22 (m, 1H), 8.47 (m, 2H)	365.4
101	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.26 (d, 1H), 8.43 (m, 1H)	383.9
102	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.98 (t, 2H), 7.33 (m, 2H), 7.73 (m, 1H), 7.92 (s, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.50 (m, 2H), 8.75 (br, 1H)	383.9
103	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.96 (t, 2H), 4.14 (s, 2H), 7.29 (m, 1H), 7.63 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.90 (m, 1H), 7.97 (d, 1H), 8.40 (m, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.80 (d, 1H)	378.5
104	(3-{2-[(2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl)-amino]-ethyl}-pyridin-2-ylmethyl)-carbamic acid tert-butylester		1.39 (s, 9H), 3.31 (t, 2H), 3.97 (t, 2H), 4.75 (s, 2H), 7.28 (m, 1H), 7.69 (m, 2H), 7.80 (m, 1H), 7.90 (s, 1H), 8.05 (s, 1H), 8.40 (m, 1H), 8.55 (d, 1H)	478.6
105	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.38 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 4.64 (s, 2H), 7.29 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.97 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.80 (d, 1H)	378.5

【表 1 - 1 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
106	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(pyridin-3-yl-propyl)-amide]		2.19 (q, 2H), 3.11 (t, 2H), 3.66 (t, 2H), 7.28 (t, 1H), 7.73 (m, 2H), 7.98 (m, 2H), 8.46 (s, 1H), 8.70 (m, 2H), 8.62 (s, 1H)	363.4
107	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-trifluoromethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		3.03 (t, 2H), 3.83 (t, 2H), 7.19~7.26 (m, 4H), 7.39 (d, 2H), 7.75 (d, 2H), 7.91 (d, 1H), 8.40 (m, 1H)	495.5
108	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.09 (t, 2H), 2.85 (t, 2H), 3.64 (t, 2H), 7.27 (d, 1H), 7.73 (s, 1H), 7.83 (m, 2H), 7.85 (m, 2H), 8.18~8.44 (m, 2H)	397.9
109	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-pyridin-4-yl-propyl)-amide]		2.22 (m, 2H), 3.18 (t, 2H), 3.67 (t, 2H), 7.27 (m, 1H), 7.75 (m, 2H), 7.96 (m, 1H), 8.03 (m, 1H), 8.49 (br, 1H), 8.67 (br, 1H)	363.4
110	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-fluoro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.13 (t, 2H), 2.95 (t, 2H), 3.63 (t, 2H), 7.02 (s, 1H), 7.26 (m, 2H), 7.75 (m, 2H), 7.95 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.41 (m, 1H)	381.4
111	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-chloro-pyridin-4-yl)-propyl]-amide		2.12 (t, 2H), 2.93 (t, 2H), 3.63 (t, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.75 (m, 2H), 7.96 (s, 1H), 8.15 (d, 1H), 8.49 (br, 1H)	397.9
112	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-methyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		2.87 (s, 3H), 3.31 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 6.76 (m, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.73 (d, 1H), 7.76~7.80 (m, 1H), 7.88 (s, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.40~8.55 (m, 3H)	363.4

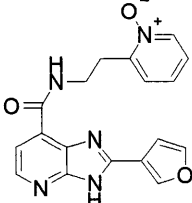
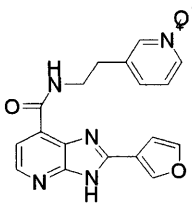
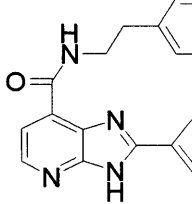
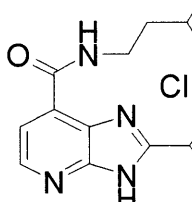
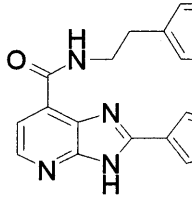
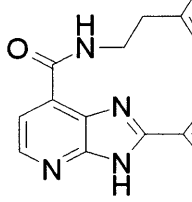
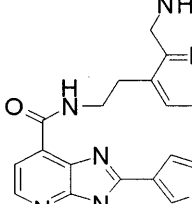
【表 1 - 17】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
113	2-thiophen-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-fluoro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.10 (m, 2H), 2.90 (t, 2H), 3.60 (t, 2H), 6.97 (d, 1H), 7.27 (d, 1H), 7.77 (m, 2H), 7.90 (t, 1H), 7.98 (s, 1H), 8.12 (s, 1H), 8.44 (s, 1H)	381.4
114	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.87 (s, 3H), 3.00 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 7.04 (s, 1H), 7.18 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.82 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 8.43 (br, 1H)	425.5
115	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.88 (s, 3H), 3.00 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.79 (s, 1H), 7.20 (d, 2H), 7.33 (d, 2H), 7.77 (d, 2H), 7.92 (s, 1H), 8.50 (d, 1H)	439.5
116	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.28 (s, 6H), 2.98 (t, 2H), 3.80 (t, 3H), 7.07 (s, 1H), 7.17 (d, 2H), 7.27 (d, 2H), 7.75 (m, 2H), 8.38 (s, 1H), 8.44 (d, 1H)	454.5
117	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.21 (m, 2H), 3.61 (t, 2H), 4.20 (t, 2H), 7.19 (s, 1H), 7.77 (m, 3H), 8.47 (m, 2H)	407.3
118	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(5-methyl-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.38~2.12 (m, 5H), 3.66 (t, 2H), 4.34 (t, 2H), 7.19 (s, 2H), 7.41~7.27 (d, 1H), 7.77 (s, 2H), 8.45 (m, 2H), 8.97~8.86 (d, 1H)	352.4
119	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.94 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 6.65 (d, 1H), 6.76 (m, 2H), 7.03 (s, 1H), 7.11 (m, 1H), 7.74 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.42 (d, 1H)	348.4

【表 1 - 18】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
120	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		3.00 (t, 2H), 3.80 (t, 2H), 6.74 (m, 2H), 6.94 (m, 2H), 7.15 (m, 1H), 7.75 (s, 2H), 8.37 (s, 1H), 8.45 (d, 1H)	348.4
121	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.10 (s, 3H), 2.97 (t, 2H), 3.78 (t, 2H), 7.11 (s, 1H), 7.25 (d, 2H), 7.48 (d, 1H), 7.77 (d, 2H), 8.44 (s, 1H), 8.51 (d, 1H)	389.4
122	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-[2-(4-ethyl-piperazin-1-yl)-acetylamino]-phenyl]-ethyl]-amide		1.35 (t, 3H), 3.01~2.97 (m, 6H), 3.19 (q, 2H), 3.45~3.18 (m, 6H), 3.78 (t, 2H), 7.08 (s, 1H), 7.31 (d, 2H), 7.53 (d, 2H), 7.75 (s, 2H), 8.36 (s, 1H), 8.45 (d, 1H)	501.6
123	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.40 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 6.71 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83~7.95 (m, 2H), 8.11 (d, 1H), 8.55 (m, 1H), 8.76 (d, 1H)	333.4
124	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.42 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 6.72 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.42 (d, 1H), 8.70 (m, 2H), 8.88 (s, 1H)	333.4
125	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.43 (t, 2H), 4.02 (t, 2H), 7.14 (s, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 8.08 (d, 1H), 8.43 (m, 1H), 8.73 (d, 1H)	333.4
126	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.93 (t, 2H), 3.79 (t, 2H), 6.76 (m, 1H), 6.89 (m, 1H), 6.97 (m, 1H), 7.77 (m, 2H), 8.42 (s, 1H), 8.48 (d, 1H)	366.4
127	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		2.36 (q, 2H), 3.66 (t, 2H), 4.44 (t, 2H), 7.21 (s, 1H), 7.57 (s, 1H), 7.78 (m, 3H), 8.47 (m, 2H), 9.06 (s, 1H)	336.4

【表 1 - 1 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
128	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-2-yl)-ethyl]-amide		3.44 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 7.24 (d, 1H), 7.45 (m, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.41 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.58 (s, 1H)	349.4
129	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 7.80 (s, 1H), 8.31 (d, 1H), 8.48~8.53 (m, 3H)	349.4
130	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.19 (t, 2H), 3.91 (t, 2H), 7.17 (d, 1H), 7.67 (d, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.80 (m, 1H), 8.39 (d, 2H), 8.51 (m, 2H)	349.4
131	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.06 (t, 2H), 3.84 (t, 2H), 7.09 (s, 1H), 7.39 (d, 1H), 7.76~7.80 (m, 3H), 8.32 (s, 1H), 8.45 (m, 2H)	367.8
132	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.08 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 7.07 (s, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.46 (s, 1H), 7.75 (d, 2H), 8.25 (d, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.48 (m, 1H)	367.8
133	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.41 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 6.71 (d, 1H), 7.42 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.50 (d, 1H), 8.70 (m, 1H), 8.90 (s, 1H)	367.8
134	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 4.47 (s, 2H), 7.13 (s, 1H), 7.33 (m, 1H), 7.73~7.82 (m, 3H), 8.44~8.51 (m, 3H)	362.4

【表 1 - 20】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
135	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.37 (t, 2H), 3.98 (t, 2H), 4.21 (s, 2H), 7.16 (s, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.95 (d, 1H), 7.75 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 8.27 (m, 2H), 8.49 (br, 1H), 8.61 (s, 1H)	362.4
136	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-3-yl-propyl)-amide		2.18 (q, 2H), 3.07 (t, 2H), 3.65 (t, 2H), 6.75 (m, 1H), 7.43 (d, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.87 (s, 1H), 7.98 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.61 (d, 1H), 8.66 (m, 1H), 8.83 (br, 1H)	347.4
137	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-trifluoromethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		3.02 (t, 2H), 3.82 (t, 2H), 7.04 (s, 1H), 7.19 (d, 2H), 7.35 (d, 2H), 7.73 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 8.41 (br, 1H)	479.4
138	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.08 (t, 2H), 2.89 (t, 2H), 3.62 (t, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.78 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 7.94 (m, 1H), 8.17 (m, 1H), 8.28 (s, 1H), 8.42 (s, 1H)	381.8
139	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-4-yl-propyl)-amide		2.21 (t, 1H), 3.14 (t, 2H), 3.66 (t, 2H), 7.18 (s, 1H), 7.77 (s, 1H), 8.03 (d, 1H), 8.47 (s, 1H), 8.67 (br, 1H)	347.4
140	6-bromo-2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		DMSO: 1.88(d, J=2.1Hz, 2H), 3.41-3.52(m, 2H), 4.08(d, J=2.1Hz, 2H), 7.21(s, 1H), 7.61(s, 1H), 7.78(d, J=2.6Hz, 2H), 8.21(d, J=2.1Hz, 1H), 8.48(d, J=2.6Hz, 1H)	484.1
141	2-furan-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-benzoylamino-phenyl)-amide		DMSO: 6.58(d, J=2.6Hz, 1H), 7.31-7.62(m, 7H), 7.66(s, 1H), 7.69(d, J=2.3Hz, 2H), 7.81-7.92(m, 3H), 8.23(d, J=2.1Hz, 1H), 8.31(t, J=1.3Hz, 2H), 8.58(d, J=2.1Hz, 1H), 8.83(s, 1H), 10.20(s, 1H)	423.4

【表 1 - 2 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
142	2-(2,4-difluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.21 (t, 3H), 2.96 (q, 2H), 3.01 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.16 (d, 2H), 7.32 (m, 2H), 7.79 (m, 1H), 8.13 (m, 1H), 8.43 (d, 1H)	485.5
143	2-(2,4-difluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.86 (s, 3H), 3.03 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.17 (m, 2H), 7.35 (m, 2H), 7.31 (m, 2H), 7.77 (m, 1H), 8.07 (m, 1H), 8.48 (d, 1H)	471.5
144	2-(2,4-difluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloroimidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.23 (m, 2H), 3.64 (t, 2H), 4.20 (t, 2H), 7.20 (m, 2H), 7.77 (s, 1H), 7.82 (m, 1H), 8.34 (m, 1H), 8.50 (d, 1H)	451.3
145	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.25 (m, 2H), 1.31 (m, 2H), 2.31 (m, 1H), 2.91 (t, 2H), 3.75 (t, 2H), 7.00 (d, 2H), 7.25 (d, 2H), 7.70 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)	399.5
146	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.26 (m, 7H), 2.31 (m, 1H), 2.99 (m, 4H), 3.72 (t, 2H), 7.02 (m, 4H), 7.69 (d, 1H), 8.40 (d, 1H)	413.5
147	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.36 (m, 4H), 2.37 (m, 1H), 2.73 (s, 6H), 2.94 (t, 2H), 3.73 (t, 2H), 7.16 (d, 2H), 7.23 (d, 2H), 7.70 (d, 1H), 8.44 (d, 1H)	428.5
148	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		1.48 (m, 4H), 2.15 (m, 2H), 2.50 (s, 1H), 3.54 (t, 2H), 4.17 (t, 2H), 7.76 (d, 1H), 7.82 (s, 1H), 8.56 (d, 1H)	381.3

【表 1 - 2 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
149	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(5-methyl-3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		1.38 (m, 4H), 2.25 (m, 2H), 2.39 (s, 3H), 2.41 (m, 1H), 3.58 (t, 2H), 4.31 (t, 2H), 7.49~7.31 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 8.96~8.81 (d, 1H)	326.4
150	2-cyclopropyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		1.41 (m, 4H), 2.44 (m, 1H), 2.90 (t, 2H), 3.70 (t, 2H), 6.72 (m, 3H), 7.10 (t, 1H), 7.73 (d, 1H), 8.51 (d, 1H)	322.4
151	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.95 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 6.65 (m, 1H), 6.80 (m, 2H), 7.13 (t, 1H), 7.60 (m, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.76 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.40 (d, 1H)	364.4
152	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.17 (s, 3H), 2.98 (t, 2H), 3.84 (t, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.47 (d, 2H), 7.62 (s, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 8.16 (s, 1H), 8.43 (d, 1H)	405.5
153	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		3.02 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 6.75 (m, 2H), 7.05 (t, 1H), 7.18 (d, 1H), 7.62 (m, 1H), 7.69 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 8.17 (s, 1H), 8.41 (d, 1H)	364.4
154	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.22 (t, 3H), 2.96 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.32 (d, 2H), 7.66 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 8.40 (d, 1H)	455.6
155	2-(1-oxo-thiophen-3-yl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.24 (t, 3H), 2.99 (m, 4H), 3.65 (t, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.28 (d, 2H), 7.75 (m, 2H), 7.84 (m, 1H), 8.28 (d, 1H), 8.45 (br, 1H)	471.6

【表 1 - 2 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
156	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.45 (t, 2H), 4.05 (t, 2H), 7.68 (d, 2H), 7.85~8.10 (m, 3H), 8.40~8.55 (m, 3H), 8.75 (d, 1H), 8.81 (d, 1H)	349.4
157	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.30 (t, 2H), 3.97 (t, 2H), 7.69 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 7.81 (d, 1H), 7.90 (m, 1H), 8.35 (m, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.53 (d, 1H), 8.65 (d, 1H), 8.82 (s, 1H)	349.4
158	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.35 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 7.67 (m, 2H), 7.83 (d, 1H), 8.05 (m, 1H), 8.45 (m, 2H), 8.70 (m, 2H), 8.89 (s, 1H)	349.4
159	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.86 (s, 3H), 3.07 (t, 2H), 3.84 (t, 2H), 7.25 (d, 2H), 7.38 (d, 2H), 7.65~7.82 (m, 3H), 8.28 (m, 1H), 8.45 (d, 1H)	441.5
160	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylaminosulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.69 (s, 6H), 3.05 (t, 2H), 4.88 (t, 2H), 7.18 (d, 2H), 7.35 (d, 2H), 7.65~7.80 (m, 2H), 8.25 (m, 1H), 8.42 (d, 1H)	470.6
161	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.94 (q, 2H), 3.85 (t, 2H), 6.68 (m, 1H), 6.95 (m, 2H), 7.63~7.80 (m, 3H), 8.27 (m, 1H), 8.45 (d, 1H)	382.4
162	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4-methyl-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.24 (s, 3H), 2.33 (m, 2H), 3.67 (t, 2H), 4.37 (t, 2H), 7.43 (s, 1H), 7.70 (m, 1H), 7.80 (m, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.46 (m, 2H), 8.88 (s, 1H)	366.4

【表 1 - 2 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
163	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		2.37 (t, 2H), 3.68 (t, 2H), 4.45 (t, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.68 (m, 1H), 7.76 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 7.93 (d, 1H), 8.42 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 9.02 (s, 1H)	352.4
164	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-2-yl)-ethyl]-amide		3.46 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 7.47 (m, 1H), 7.62 (t, 1H), 7.70~7.75 (m, 2H), 7.78 (m, 1H), 8.01 (m, 1H), 8.43 (d, 1H), 8.57 (d, 1H), 8.73 (m, 1H)	365.4
165	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.35 (t, 2H), 4.01 (t, 2H), 7.67 (m, 1H), 7.71 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 7.99 (m, 2H), 8.34 (s, 1H), 8.40 (d, 1H), 8.67 (m, 1H)	365.4
166	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.20 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.71 (d, 2H), 7.74 (m, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 8.43 (d, 2H), 8.51 (m, 1H), 8.53 (d, 1H)	365.4
167	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 7.36 (d, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.77 (m, 2H), 8.25 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.50 (br, 1H)	383.9
168	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.31 (t, 2H), 3.95 (t, 2H), 4.15 (s, 2H), 7.70 (m, 2H), 7.87 (m, 2H), 8.41 (m, 2H), 8.50 (d, 1H), 8.79 (d, 1H)	378.5
169	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-1-oxy-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.22 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.26 (m, 1H), 7.59 (d, 1H), 7.76 (m, 2H), 7.78 (s, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.41 (s, 2H)	399.9

【0045】

【表 1 - 2 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
170	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-fluoro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.14 (t, 2H), 3.91 (t, 2H), 7.10 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.68 (s, 1H), 7.79 (s, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.35 (s, 1H), 8.45 (br, 1H)	367.4
171	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-methyl amino-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		2.83 (s, 3H), 3.06 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 6.86 (s, 1H), 6.94 (d, 1H), 7.28 (m, 1H), 7.76 (m, 3H), 7.92 (d, 2H), 8.42 (d, 1H)	378.5
172	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-3-yl-propyl)-amide		2.18 (q, 2H), 3.07 (t, 2H), 3.66 (t, 2H), 7.66 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 7.97 (t, 1H), 8.44 (m, 2H), 8.59 (d, 1H), 8.65 (br, 1H), 8.82 (br, 1H)	363.4
173	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-trifluoromethanesulfonyl amino-phenyl)-ethyl]-amide		3.04 (t, 2H), 3.84 (t, 2H), 7.20 (d, 2H), 7.36 (d, 2H), 7.65 (m, 1H), 7.75 (d, 2H), 8.28 (s, 1H), 8.43 (d, 1H)	495.5
174	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.08 (t, 2H), 2.85 (t, 2H), 3.62 (t, 2H), 6.74 (s, 1H), 7.31 (d, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.78 (m, 1H), 8.17 (m, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.44 (s, 1H)	397.9
175	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-4-yl-propyl)-amide		2.27 (q, 2H), 3.15 (t, 2H), 3.67 (t, 2H), 7.68 (q, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.90 (d, 2H), 8.43 (m, 2H), 8.67 (d, 2H)	363.4
176	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-chloro-pyridin-4-yl)-propyl]-amide		2.14 (t, 2H), 2.87 (t, 2H), 3.65 (t, 2H), 7.28~7.38 (m, 3H), 7.78 (d, 1H), 8.14 (d, 1H), 8.29(m, 2H), 8.46 (br, 1H)	397.9

【表 1 - 2 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
177	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-methyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		2.87 (s, 3H), 3.31 (t, 2H), 3.95 (t, 2H), 7.69 (m, 3H), 7.79 (m, 1H), 7.87 (d, 1H), 8.40~8.55 (m, 3H)	363.4
178	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-fluoro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.08 (m, 2H), 2.86 (t, 2H), 3.61 (t, 2H), 6.96 (d, 1H), 7.66 (s, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.87 (m, 2H), 8.09 (s, 1H), 8.35~8.50 (m, 2H)	381.4
179	2-(1-oxo-thiophen-3-yl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(1-oxo-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.06 (t, 2H), 2.84 (t, 2H), 3.55 (t, 2H), 7.53 (t, 1H), 7.65~7.73 (m, 3H), 7.94 (s, 1H), 8.24 (d, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.39 (s, 1H), 8.56 (s, 1H)	395.4
180	2-(1-oxo-1H-thiophen-3-yl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-3-yl-propyl)-amide		2.12 (m, 2H), 2.87 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 7.45~7.75 (m, 4H), 7.82~8.05 (m, 2H), 8.20 (m, 1H), 8.37 (m, 1H), 8.53 (m, 1H)	379.4
181	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-yl-amide		7.71 (m, 1H), 7.92 (d, 1H), 7.96 (m, 1H), 7.98 (m, 1H), 8.00~8.52 (m, 4H), 8.82 (d, 1H)	321.4
182	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-4-yl-amide		7.52 (s, 1H), 7.76 (m, 2H), 7.92 (m, 1H), 8.11 (m, 2H), 8.50 (s, 1H)	321.4
183	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		3.96 (s, 3H), 6.93 (d, 1H), 7.7 (s, 1H), 7.89~7.94 (m, 2H), 8.19 (d, 1H), 8.45~8.65 (m, 2H), 8.67 (s, 1H)	351.4

【表 1 - 2 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
184	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-amino-phenyl)-ethyl]-amide		3.11 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.29 (d, 2H), 7.52 (d, 2H), 7.67~7.82 (m, 4H), 8.32~8.45 (m, 2H)	363.4
185	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.86 (s, 3H), 7.72 (m, 1H), 7.98~8.20 (m, 4H), 8.38 (d, 1H), 8.55 (m, 2H)	335.4
186	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cycloheptyl amide		1.838~1.72 (m, 10H), 2.05 (m, 2H), 4.28 (m, 1H), 7.67 (s, 1H), 7.78 (s, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.31 (s, 1H), 8.43 (d, 1H)	340.5
187	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(5-methyl-2H-pyrazol-3-yl)-amide		2.69 (s, 3H), 7.72~7.67 (m, 2H), 7.86 (d, 1H), 8.46 (s, 1H), 8.65 (br, 1H)	324.4
188	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl amino-pyridin-3-yl)-amide		3.06 (s, 3H), 7.10 (d, 1H), 7.66 (m, 1H), 7.76 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 8.02 (m, 1H), 8.42 (s, 2H), 8.76 (s, 1H)	350.4
189	2-thiophen-3-yl-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridine-4-carboxylic acid(4-benzoylamino-phenyl)-amide		DMSO: 6.68(d, J=2.3Hz, 1H), 7.41-7.52(m, 7H), 7.61(s, 1H), 7.66(d, J=2.3Hz, 2H), 7.91-7.92(m, 3H), 8.11(d, J=2.1Hz, 1H), 8.21(t, J=1.3Hz, 2H), 8.48(d, J=2.1Hz, 1H), 8.84(s, 1H), 10.22(s, 1H)	439.5
190	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-methanesulfonylamino-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.80 (s, 3H), 3.03 (t, 2H), 3.50 (s, 3H), 3.85 (t, 2H), 7.20 (d, 1H), 7.35 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.11 (d, 2H), 8.44 (s, 1H)	456.5

【表 1 - 28】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
191	6-bromo-2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.77 (m, 2H), 8.25 (d, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.41 (s, 1H), 8.50 (br, 1H)	462.8
192	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		3.26(s, 3H), 7.32(s, 1H), 7.77-7.83(m, 2H), 7.99(s, 1H), 8.21(d, 1H), 8.50(d, 1H), 8.64(s, 1H), 8.92(s, 1H), 11.65(s, 1H)	335.4
193	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		1.38(t, 3H), 4.55(q, 2H), 7.37(s, 1H), 7.85(t, 2H), 7.93(d, 2H), 8.36(s, 1H), 8.51(t, 2H), 9.55(s, 1H), 11.72(s, 1H)	365.4
194	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		1.20-1.29(m, 3H), 2.88-3.00(m, 2H), 6.40(d, 1H), 7.34(s, 1H), 7.73-7.81(m, 2H), 7.88(d, 1H), 8.48(t, 2H), 10.88(s, 1H), 11.72(s, 1H)	381.5
195	2-thiophen-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.36(t, 3H), 2.48(t, 3H), 4.36(q, 2H), 7.10(s, 1H), 7.83(q, 2H), 7.92(d, 1H), 8.49(q, 2H), 9.35(s, 1H), 11.52(s, 1H)	379.4
196	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-acetylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.09 (s, 3H), 2.99 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 7.28 (m, 4H), 7.50 (m, 2H), 7.80 (m, 1H), 8.05 (m, 2H), 8.42 (d, 1H)	417.4
197	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		.02 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 6.75 (m, 2H), 7.07 (m, 1H), 7.16 (m, 1H), 7.26 (m, 2H), 7.79 (m, 1H), 8.10 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	376.4

【表 1 - 2 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
198	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.19 (t, 3H), 2.99 (q, 2H), 3.02 (t, 2H), 3.85 (t, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.32 (m, 4H), 7.79 (m, 1H), 8.13 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	467.5
199	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(3H-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.35 (m, 2H), 3.64 (t, 2H), 4.24 (t, 2H), 7.17 (m, 1H), 7.23 (m, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.81 (m, 1H), 7.90 (m, 1H), 8.34 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	366.4
200	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-(2-dimethylamino-acetylamino)-phenyl]-ethyl]-amide		2.98 (m, 8H), 3.85 (t, 2H), 4.08 (s, 2H), 7.35~7.25 (m, 4H), 7.55 (d, 2H), 7.76 (d, 2H), 8.06 (m, 2H), 8.41 (d, 1H)	460.5
201	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.96 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 6.67 (d, 1H), 6.80 (d, 2H), 7.13 (t, 1H), 7.30 (t, 2H), 7.79 (m, 1H), 8.05 (m, 2H), 8.42 (d, 1H)	376.4
202	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.26 (m, 2H), 3.66 (t, 2H), 4.22 (t, 2H), 7.32 (t, 2H), 7.74 (d, 1H), 7.80 (s, 1H), 8.32 (m, 2H), 8.40 (d, 1H)	433.3
203	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-chloro-phenyl)-ethyl]-amide		3.02 (t, 2H), 3.90 (t, 2H), 7.33 (m, 6H), 7.81 (d, 1H), 8.07 (m, 2H), 8.44 (d, 2H)	394.8
204	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[4-[(4-methyl-piperazine-1-carbonyl)-amino]-phenyl]-ethyl]-amide		2.82 (s, 3H), 3.00 (t, 2H), 3.85~3.23 (m, 8H), 3.86 (t, 2H), 7.34 (m, 4H), 7.56 (d, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.11 (m, 2H), 8.46 (d, 1H)	501.6

【表 1 - 3 0】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
205	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4-methyl-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		2.22 (d, 3H), 2.34 (m, 2H), 3.68 (t, 2H), 4.35 (t, 2H), 7.33 (d, 1H), 7.39 (m, 2H), 7.81 (d, 1H), 8.32 (m, 2H), 8.47 (d, 1H), 8.86 (d, 1H)	378.4
206	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-methanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.81 (s, 3H), 3.02 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.35 (d, 1H), 7.44 (d, 1H), 7.77 (m, 2H), 8.12 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	453.5
207	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-dimethylamino-sulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		2.69 (s, 3H), 3.00 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 7.16 (d, 2H), 7.30 (m, 4H), 7.80 (m, 1H), 8.10 (m, 2H), 8.42 (d, 1H)	482.5
208	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(3-trifluoro methyl-phenyl)-ethyl]-amide		3.07 (t, 2H), 3.91 (t, 2H), 7.25 (m, 2H), 7.45 (m, 2H), 7.57 (m, 2H), 7.80 (d, 1H), 8.04 (m, 2H), 8.41 (d, 1H)	428.4
209	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[3-(2-morpholin-4-yl-ethoxy)-phenyl]-ethyl]-amide		3.02(t, 2H), 3.10-3.40(m, 2H), 3.40-3.60(m, 2H), 3.53(t, 2H), 3.61-3.82(m, 2H), 3.88(t, 2H), 3.82-4.10(m, 2H), 4.28(t, 2H), 6.88-6.92(m, 1H), 6.98(s, 1H), 7.05(d, 1H), 7.21-7.38(m, 3H), 7.77(d, 1H), 8.02-8.16(m, 1H), 8.43(d, 1H)	489.6
210	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[3-(3-morpholin-4-yl-propoxy)-phenyl]-ethyl]-amide		1.82-1.87(m, 2H), 2.09-2.20(m, 2H), 3.01(t, 2H), 3.11-3.20(m, 2H), 3.21-3.31(m, 2H), 3.40-3.61(m, 2H), 3.62-3.82(m, 2H), 3.85-3.92(m, 2H), 4.05(t, 2H), 6.81-6.89(m, 1H), 6.91(s, 1H), 6.99(s, 1H), 7.20-7.40(m, 3H), 7.79(d, 1H), 8.05-8.15(m, 2H), 8.28-8.32(m, 1H), 8.44(d, 1H)	503.6

【表 1 - 3 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
211	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-[3-(2-dimethylamino-ethoxy)-phenyl]-ethyl]-amide		2.90 (s, 6H), 3.03 (t, 2H), 3.50 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 4.23 (t, 2H), 6.85-6.92 (m, 1H), 7.0(s, 1H), 7.05(d, 1H), 7.25-7.40 (m, 3H), 7.78 (s, 1H), 8.05-8.15 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	447.5
212	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-2-yl-ethyl)-amide		3.59 (t, 2H), 4.09 (t, 2H), 7.36 (t, 2H), 7.88 (d, 1H), 7.95 (m, 1H), 8.10 (d, 1H), 8.28 (m, 1H), 8.45~8.55 (m, 2H), 8.76 (d, 1H)	361.4
213	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		3.31 (t, 2H), 4.00 (t, 2H), 7.38 (t, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.02 (m, 1H), 8.31 (m, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (m, 2H), 8.88 (s, 1H)	361.4
214	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-4-yl-ethyl)-amide		3.38 (t, 2H), 4.04 (t, 2H), 7.36 (m, 1H), 7.75 (d, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.24 (m, 1H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (d, 1H)	361.4
215	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-fluoro-3-hydroxy-phenyl)-ethyl]-amide		2.95 (t, 2H), 3.89 (t, 2H), 6.78 (m, 1H), 6.84 (m, 1H), 6.99 (m, 1H), 7.33 (t, 2H), 7.81 (d, 1H), 8.08 (m, 2H), 8.45 (d, 1H)	394.4
216	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(1-oxy-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.22 (t, 2H), 3.96 (t, 2H), 7.40 (t, 2H), 7.72 (d, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.25 (m, 2H), 8.43 (d, 2H), 8.50 (d, 1H)	377.4
217	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.06 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 7.33~7.41 (m, 2H), 7.79~7.82 (m, 1H), 8.18 (m, 1H), 8.33 (d, 1H), 8.50 (d, 1H)	395.8

【表 1 - 3 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
218	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.31~7.39 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.79 (d, 1H), 8.15 (m, 2H), 8.26 (d, 1H), 8.48 (m, 1H)	395.8
219	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-chloro-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.20 (t, 2H), 3.92 (t, 2H), 7.38~7.42 (m, 3H), 7.68 (d, 1H), 7.80~8.14 (m, 3H), 8.28 (m, 1H), 8.90 (s, 1H)	395.8
220	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.11 (t, 2H), 3.86 (t, 2H), 4.46 (s, 2H), 7.38 (m, 1H), 7.60 (m, 2H), 7.78~7.94 (m, 2H), 8.18 (m, 2H), 8.50 (d, 2H)	390.4
221	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-aminomethyl-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.13 (t, 2H), 3.91 (t, 2H), 4.20 (s, 2H), 7.35 (t, 2H), 7.46 (m, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.21 (m, 2H), 8.46 (m, 1H), 8.54 (d, 1H)	390.4
222	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(6-aminomethyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		3.13 (t, 2H), 3.88 (t, 2H), 4.18 (s, 2H), 7.36 (m, 3H), 7.75 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 8.27 (m, 2H), 8.49 (br, 1H), 8.61 (s, 1H)	390.4
223	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-fluoro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.14 (t, 2H), 3.95 (t, 2H), 7.11 (s, 1H), 7.32 (m, 3H), 7.80 (s, 1H), 8.11 (m, 3H), 8.50 (br, 1H)	379.4
224	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-methylamino-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		2.82 (s, 3H), 3.09 (t, 2H), 3.94 (t, 2H), 6.87 (s, 1H), 6.95 (d, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.77 (m, 2H), 8.21 (m, 2H), 8.45 (d, 1H)	390.4

【表 1 - 3 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
225	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-trifluoromethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		3.05 (t, 2H), 3.05 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 7.20 (m, 3H), 7.29~7.39 (m, 3H), 7.80 (s, 1H), 8.15 (m, 2H), 8.44 (d, 1H)	507.5
226	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-3-yl-propyl)-amide		2.20 (q, 2H), 3.08 (t, 2H), 3.68 (t, 2H), 7.34 (t, 2H), 7.79 (d, 1H), 7.98 (t, 1H), 8.30 (m, 2H), 8.48 (s, 1H), 8.59 (d, 1H), 8.65 (s, 1H), 8.82 (s, 1H)	375.4
227	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-pyridin-4-yl-propyl)-amide		2.23(q, 2H), 3.13 (t, 2H), 3.69 (t, 2H), 7.35 (t, 2H), 7.78 (d, 1H), 7.98 (d, 1H), 8.31 (m, 2H), 8.46 (d, 1H), 8.63 (br, 1H)	375.4
228	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(2-chloro-pyridin-4-yl)-propyl]-amide		2.11 (t, 2H), 2.86 (t, 2H), 3.62 (t, 2H), 7.29 (d, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.69 (s, 1H), 7.77 (d, 1H), 7.83 (s, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.45 (m, 2H)	409.9
229	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-methyl-pyridin-3-yl)-ethyl]-amide		2.87 (s, 3H), 3.31 (t, 2H), 3.95 (t, 3H), 7.35 (t, 2H), 7.71 (d, 1H), 7.78 (m, 1H), 8.28 (m, 2H), 8.44~8.54 (m, 3H)	375.4
230	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-fluoro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.10 (t, 2H), 2.85 (t, 2H), 3.63 (t, 3H), 6.98(d, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.78~7.90 (m, 2H), 8.00 (s, 1H), 8.25~8.55 (m, 2H)	393.4
231	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-2-ylamide		7.24 (m, 1H), 7.31 (t, 2H), 7.88~7.98 (m, 2H), 8.42~8.51 (m, 5H)	333.3

【表 1 - 3 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
232	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		7.38 (t, 2H), 7.92 (d, 2H), 8.39 (m, 2H), 8.48~8.68 (m, 4H), 9.65 (br, 1H)	333.3
233	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-4-ylamide		7.35~7.41 (t, 2H), 7.93 (d, 1H), 8.36~8.52 (m, 5H), 8.54 (m, 1H), 8.55 (br, 1H)	333.3
234	[2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-7-yl]-piperidin-1-yl-methanone		1.58 (s, 2H), 1.76 (s, 4H), 3.35 (d, 2H), 3.84 (d, 2H), 7.37 (t, 2H), 7.43 (d, 1H), 8.26~8.30 (m, 2H), 8.52 (s, 1H)	324.4
235	[2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridin-7-yl]-(4-methyl-piperazin-1-yl)-methanone		2.99 (s, 3H), 3.250~3.80 (br, 8H), 7.32~7.39 (m, 3H), 8.22~8.27 (m, 2H), 8.47 (d, 1H)	339.4
236	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(4-amino-phenyl)-ethyl]-amide		3.11 (t, 2H), 3.87 (t, 2H), 7.25 (d, 2H), 7.38 (t, 2H), 7.49 (d, 2H), 7.76 (d, 1H), 8.23 (m, 2H), 8.44 (m, 1H)	375.4
237	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		4.00 (s, 3H), 7.00 (d, 1H), 7.39 (t, 2H), 7.93 (d, 1H), 8.23 (d, 1H), 8.38 (m, 2H), 8.62 (m, 1H), 8.77 (m, 1H)	363.4
238	22-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(6-chloro-pyridin-3-yl)-propyl]-amide		2.10 (m, 2H), 2.82~2.98 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 7.28~7.38 (m, 3H), 7.73~7.85 (m, 2H), 8.19 (d, 1H), 8.18 (m, 2H), 8.32 (m, 1H)	409.9

【0055】

【表 1 - 3 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
239	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		4.23 (s, 3H), 7.05 (m, 2H), 7.42 (t, 2H), 7.95 (m, 2H), 8.48 (m, 2H), 8.98 (d, 1H)	363.4
240	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cycloheptylamide		1.84~1.72 (m, 10H), 2.07 (m, 2H), 4.28 (m, 1H), 7.35 (t, 2H), 7.81 (d, 1H), 8.29~8.25 (m, 2H), 8.44 (d, 2H)	352.4
241	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.69 (s, 3H), 7.35 (t, 2H), 7.43 (d, 1H), 7.94 (d, 1H), 8.35~8.27 (m, 2H), 8.51 (d, 1H), 9.48 (br, 1H)	347.4
242	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-chloro-pyridin-3-yl)-amide		7.36 (t, 2H), 7.52 (d, 1H), 7.88 (d, 1H), 8.39~8.34 (m, 3H), 8.50 (d, 1H), 8.91 (br, 1H)	367.8
243	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(5-methyl-2H-pyrazol-3-yl)-amide		2.38 (s, 3H), 7.38~7.33 (m, 3H), 7.82 (s, 1H), 8.31~8.60 (m, 3H)	336.3
244	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(5-methyl-pyridin-2-yl)-amide		2.55 (s, 3H), 6.97(d, 1H), 7.33 (m, 2H), 7.83 (d, 1H), 8.18 (m, 1H), 8.38 (m, 2H), 8.55 (d, 1H), 8.62 (d, 1H)	347.4
245	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-pyridin-3-yl)-amide		7.50 (m, 3H), 7.84 (s, 1H), 8.22 (s, 1H), 8.38 (m, 2H), 8.53 (d, 1H), 8.90 (d, 1H)	367.8

【表 1 - 3 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
246	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		4.32 (s, 3H), 7.41 (t, 3H), 7.91 (d, 2H), 8.38 (m, 3H), 8.50 (s, 1H)	363.4
247	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-chloro-pyridin-3-yl)-amide		7.38 (m, 2H), 7.89 (s, 1H), 8.02(s, 1H), 8.35 (m, 3H), 7.59 (d, 1H), 8.66 (d, 1H)	367.8
248	2-(4-fluoro-phenyl)-3-methyl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid [2-(4-ethanesulfonylamino-phenyl)-ethyl]-amide		1.19 (t, 3H), 2.99 (q, 2H), 3.02 (t, 2H), 3.63 (s, 3H), 3.85 (t, 2H), 7.19 (d, 2H), 7.32 (m, 4H), 7.79 (m, 1H), 8.13 (m, 2H), 8.43 (d, 1H)	481.6
249	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-piperidin-1-yl-phenyl)-amide		DMSO: 1.58~1.72(m, 6H), 3.98~4.02(m, 4H), 7.25(t, J=2.9Hz, 2H), 7.31 (d, J=3.1Hz, 1H), 7.41(d, J=2.1Hz, 2H), 7.64 (d, J=2.1Hz, 2H), 7.95(t, J=2.9Hz, 2H), 8.15(d, J=2.1Hz, 1H)	415.5
250	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-morpholin-4-yl-phenyl)-amide		DMSO: 3.98(d, J=2.6Hz, 4H), 4.08(d, J=2.6Hz, 4H), 7.25(t, J=2.9Hz, 2H), 7.31 (d, J=3.1Hz, 1H), 7.41(d, J=2.1Hz, 2H), 7.64 (d, J=2.1Hz, 2H), 7.95(t, J=2.9Hz, 2H), 8.15(d, J=2.1Hz, 1H)	417.4
251	6-bromo-2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		3.09 (t, 2H), 3.93 (t, 2H), 7.31~7.39 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 8.15 (m, 2H), 8.26 (d, 1H), 8.48 (m, 1H)	474.7

【 0 0 5 7 】

【表 1 - 3 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
252	6-chloro-2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[2-(2-chloro-pyridin-4-yl)-ethyl]-amide		DMSO: 3.98(d, J=2.6Hz, 2H), 4.08(d, J=2.6Hz, 2H), 7.25(t, J=2.9Hz, 2H), 7.45(s, 1H), 7.65(d, J=3.2Hz, 1H), 7.85(d, J=3.2Hz, 1H), 7.89(s, 1H), 7.91(t, J=2.9Hz, 2H)	430.3
253	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid phenylamide		CD ₃ Cl: 7.21-7.29(m, 7H), 7.38(d, J=2.1Hz, 1H), 7.46(d, J=2.1Hz, 1H), 7.88-7.90(d, J=2.1Hz, 1H), 8.29-8.35(m, 1H)	332.3
254	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-hydroxy-cyclohexyl)-amide		CD ₃ OD: 1.53-1.59(m, 4H), 2.09-2.23(m, 4H), 3.82-3.88(m, 1H), 3.79-4.12(m, 2H), 6.92(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.11(d, J=3.4Hz, 2H), 8.43(d, J=2.4Hz, 1H)	354.4
255	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-benzyl-piperidin-4-yl)-amide		CD ₃ OD: 1.33-1.43(m, 4H), 2.22-2.45(m, 4H), 4.02-4.12(m, 1H), 5.21(s, 2H), 7.22-7.37(m, 3H), 7.49-7.52(m, 5H), 8.21(d, J=3.4Hz, 2H)	429.5
256	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid piperidin-4-ylamide		CD ₃ OD: 1.88-1.95(m, 4H), 2.52-2.61(m, 4H), 4.12-4.22(m, 1H), 7.25-7.40(m, 3H), 8.25(d, J=3.1Hz, 2H)	339.4
257	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2,6-diethyl-phenyl)-amide		CDCl ₃ : 1.25(t, 2.7Hz, 6H), 2.76(q, 2.9Hz, 6H), 7.19-7.32(m, 5H), 8.25-8.30(m, 3H), 8.52-8.55(b, 1H), 11.11(s, 1H)	388.4

【表 1 - 3 8】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
258	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,6-diisopropyl-phenyl)-amide		CDCl ₃ : 1.25(s, 6H), 1.28(s, 6H), 3.21-3.38(m, 2H), 7.25-7.40(m, 5H), 8.28-8.32(m, 3H), 8.45-8.52(b, 1H), 10.99(s, 1H)	416.5
259	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid benzylethyl-amide		CDCl ₃ : 1.43(t, 2.5Hz, 3H), 2.96(q, 2.1Hz, 2H), 5.20(s, 2H), 7.19-7.32(m, 6H), 8.15-8.23(m, 4H), 8.52-8.55(b, 1H)	374.4
260	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-benzyl-pyrrolidin-3-yl)-amide		CDCl ₃ : 2.01-2.32(m, 6H), 5.20(s, 2H), 4.23-4.44(m, 1H), 7.21-7.25(m, 3H), 7.33-7.35(m, 3H), 8.21-8.28(m, 4H), 8.42-8.50(b, 1H)	415.5
261	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid isopropyl-phenyl-amide		CDCl ₃ : 1.25(d, 2.7Hz, 6H), 3.96-3.99(m, 1H), 7.29-7.37(m, 6H), 8.25-8.33(m, 4H), 8.22-8.31(b, 1H)	374.4
262	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.96(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.13(s, 3H), 1.17-2.02(m, 1H), 1.41-1.63(m, 3H), 1.78-2.02(m, 3H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.82(d, J=3.6Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.12(d, J=3.6Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	392.5

【表 1 - 3 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
263	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid adamantan-1-ylamide		CDCl ₃ : 1.25-2.01(m, 15H), 6.89-7.79(m, 5H), 8.22-8.28(m, 3H), 8.48-8.51(b, 1H)	390.5
264	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid adamantan-2-ylamide		CDCl ₃ : 1.25-2.01(m, 15H), 6.99-7.81(m, 5H), 8.25-8.29(m, 3H), 8.49-8.53(b, 1H)	390.5
265	2-[[2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carbonyl]-amino]-bicyclo[2.2.1]heptane-2-carboxylic acid		CD ₃ OD: 2.28-2.33(m, 3H), 2.54-2.53(m, 2H), 3.50-3.71(m, 3H), 3.90-3.97(m, 1H), 7.21(t, J=3.1Hz, 2H), 7.80(d, J=2.5Hz, 1H), 8.20(d, J=3.1Hz, 2H), 8.42(d, J=2.5Hz, 1H)	394.4
266	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-azabicyclo[2.2.2]octyn-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 2.18-2.24(m, 3H), 2.40-2.53(m, 2H), 3.20-3.64(m, 3H), 3.92-3.99(m, 1H), 4.02-4.22(m, 1H), 4.61-4.31(m, 1H), 7.23(t, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.18(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	365.4
267	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.36-1.66(m, 5H), 1.62-1.79(m, 5H), 4.01-4.18(m, 1H), 7.18(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	338.4
268	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD: 1.36-1.66(m, 4H), 1.62-1.79(m, 3H), 2.01-2.13(m, 3H), 4.01-4.18(m, 1H), 7.18(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	350.4

【表 1 - 40】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
269	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]heptin-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 1.17(m, 3H), 1.23(d, 2.6Hz, 3H), 1.27-1.38(m, 1H), 1.37(s, 3H), 1.79-1.83(m, 1H), 1.92-1.94(m, 1H), 2.01-2.10(m, 1H), 2.12-2.21(m, 1H), 2.56-2.61(m, 1H), 2.69-2.81(m, 1H), 4.62-4.65(m, 1H), 6.93(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.10(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	392.5
270	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]heptin-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 1.17(m, 3H), 1.23(d, 2.6Hz, 3H), 1.27-1.38(m, 1H), 1.37(s, 3H), 1.79-1.83(m, 1H), 1.92-1.94(m, 1H), 2.01-2.10(m, 1H), 2.12-2.21(m, 1H), 2.56-2.61(m, 1H), 2.69-2.81(m, 1H), 4.62-4.65(m, 1H), 6.93(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.10(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	392.5
271	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,6-dimethyl-phenyl)-amide		CD ₃ OD: 2.60(s, 6H), 6.94(d, J=3.6Hz, 2H), 7.95(d, J=2.4Hz, 1H), 8.19(d, J=3.6Hz, 2H), 8.48(d, J=2.4Hz, 1H)	360.4
272	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-amino-cyclohexyl)-amide		CD ₃ OD: 1.21-1.64(m, 4H), 1.77-1.79(m, 1H), 1.82-2.19(m, 2H), 2.43-2.63(m, 2H), 4.42-4.47(m, 1H), 6.72(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.31(d, J=2.4Hz, 1H)	353.4
273	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclopentylamide		CD ₃ OD: 1.60-1.78(b, 4H), 1.80-1.90(b, 2H), 2.07-2.09(b, 2H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.85(d, J=3.4Hz, 2H), 7.27(d, J=2.4Hz, 1H), 8.23(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	324.4

【表 1 - 4 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
274	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD+CDCl ₃ : 1.05-1.07(m, 2H), 1.25-1.30(m, 4H), 1.78-1.83(m, 1H), 2.39(s, 2H), 3.25-3.30(m, 1H), 3.92-3.98(m, 1H), 7.14(t, J=3.4Hz, 1H), 7.81(d, J=2.4Hz, 1H) 8.17(t, J=3.4Hz, 2H), 8.26(d, J=2.4Hz, 1H)	350.4
275	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-hydroxy-1,1-dimethyl-ethyl)-amide		CD ₃ OD+CDCl ₃ : 1.41(s, 6H), 3.61(s, 2H), 6.93(d, J=4.4Hz, 1H), 7.18(t, J=3.6Hz, 2H), 7.64(d, J=2.4Hz, 1H), 8.21(t, J=3.4Hz, 2H), 8.25(d, J=2.4Hz, 1H)	328.3
276	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		10.97(s, 1H), 8.48(d, 1H), 8.41(s, 1H), 8.24(d, 2H), 7.77(d, 1H), 7.18(d, 2H), 6.40(s, 1H), 3.87(s, 3H), 2.37(s, 3H)	377.4
277	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid tert-butylamide		CD ₃ OD: 0.93(s, 9H), 6.76(d, J=3.6Hz, 2H), 7.69(d, J=2.4Hz, 1H), 8.11(d, J=3.6Hz, 2H), 8.29(d, J=2.4Hz, 1H)	312.3
278	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-dimethylamino-1-methyl-ethyl)-amide		CD ₃ OD: 1.45(d, J=3.6Hz, 3H), 2.99(s, 6H), 3.04-3.69(m, 3H), 6.88(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.21(d, J=2.4Hz, 1H)	341.4
279	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-ethoxy-phenyl)-amide		CD ₃ OD: 2.22(t, J=2.5Hz, 3H), 4.34(q, J=2.5Hz, 2H), 6.99(d, J=3.4Hz, 2H), 7.01-7.22(m, 3H), 7.86(d, J=2.4Hz, 1H), 8.20(d, J=2.4Hz, 2H), 8.39-8.40(m, 1H), 8.46(d, J=2.4Hz, 1H)	376.4

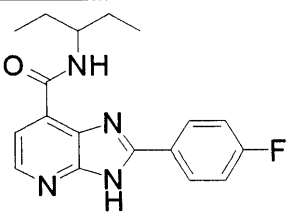
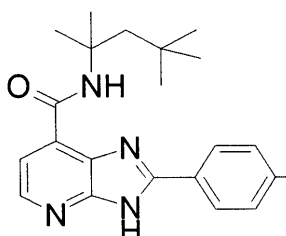
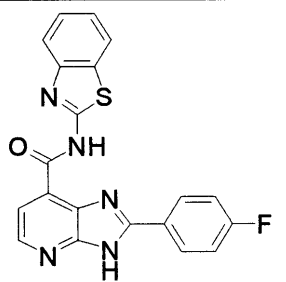
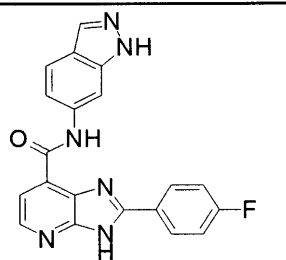
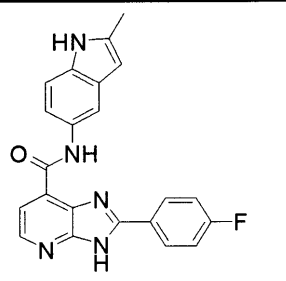
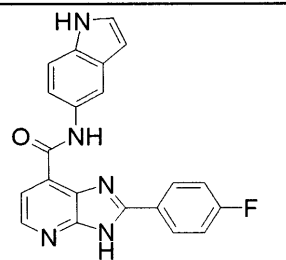
【表 1 - 4 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
280	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-hydroxy-cyclopentyl)-amide		CD ₃ OD: 1.62-2.02(m, 6H), 3.40-3.51(m, 1H), 4.19-4.39(m, 1H), 6.87(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.12(d, J=3.4Hz, 2H), 8.26(d, J=2.4Hz, 1H)	340.4
281	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-hydroxymethyl-cyclopentyl)-amide		CD ₃ OD: 1.72-2.42(m, 8H), 3.20(s, 2H), 3.40-3.51(m, 1H), 6.66(d, J=3.6Hz, 2H), 7.56(d, J=2.4Hz, 1H), 8.02(d, J=3.6Hz, 2H), 8.16(d, J=2.4Hz, 1H)	354.4
282	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,1-dimethyl-propyl)-amide		CDCl ₃ : 1.13(t, J=2.8Hz, 3H), 1.59(s, 6H), 1.99(q, J=2.1Hz, 2H), 7.39(t, J=3.4Hz, 2H), 8.02(d, J=2.4Hz, 1H), 8.25(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	326.4
283	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (3,3,5-trimethyl-cyclohexyl)-amide		DMSO: 0.83(s, 3H), 1.00(s, 3H), 1.08(s, 3H), 1.18-1.52(m, 4H), 1.76-1.88(m, 2H), 7.49(t, J=3.4Hz, 2H), 7.72(d, J=2.4Hz, 1H), 8.25(t, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	380.5
284	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid naphthalen-2-ylamide		11.8(s, 1H), 8.63(s, 1H), 8.58(d, 1H), 8.48(m, 2H), 8.02(m, 2H), 7.81(m, 3H), 7.44(m, 3H), 7.35(d, 1H)	382.4
285	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid quinolin-6-ylamide		12.2(s, 1H), 8.78(m, 3H), 8.62(d, 1H), 8.43(m, 1H), 8.18(d, 2H), 7.80(m, 2H), 7.58(d, 1H), 7.44(m, 1H), 7.08(s, 1H)	383.4

【表 1 - 4 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
286	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid quinolin-3-ylamide		11.98(s, 1H), 9.40(s, 1H), 9.07(s, 1H), 8.56(m, 3H), 8.16(m, 2H), 8.02(m, 1H), 7.80(m, 2H), 7.73(m, 1H), 7.42(m, 2H)	383.4
287	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		12.0(s, 1H), 9.75(s, 1H), 8.73(d, 1H), 8.40(d, 1H), 8.39(m, 2H), 7.88(m, 2H), 7.55(m, 2H), 4.70(q, 2H), 1.42(t, 3H)	377.4
288	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-2-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.23(s, 1H), 8.58(d, 1H), 8.39(m, 3H), 7.83(d, 1H), 7.46(m, 2H), 6.80(d, 1H), 3.88(s, 3H), 2.65(s, 3H)	377.4
289	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,3,3-trimethyl-butyl)-amide		CD ₃ OD: 1.12(s, 9H), 1.28(d, J=1.4Hz, 3H), 1.30(d, J=2.4Hz, 2H), 4.10(q, J=1.8Hz, 2H), 6.75(d, J=3.4Hz, 2H), 7.73(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.31(d, J=2.4Hz, 1H)	354.4
290	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,4-dimethyl-pentyl)-amide		CD ₃ OD: 0.96(d, J=4.4Hz, 3H), 1.01(d, J=4.4Hz, 3H), 1.26-1.29(m, 2H), 1.29(d, J=3.1Hz, 3H), 1.48-1.67(m, 2H), 1.86-1.89(m, 1H), 4.27(q, J=1.2Hz, 2H), 6.74(d, J=3.4Hz, 2H), 7.69(d, J=2.4Hz, 1H), 7.99(d, J=3.4Hz, 2H), 8.30(d, J=2.4Hz, 1H)	354.4

【表 1 - 4 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
291	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-ethyl-propyl)-amide		CD ₃ OD: 1.23(t, J=3.4Hz, 6H), 3.27(q, J=1.2Hz, 4H), 4.21-4.28(m, 1H), 6.99(d, J=3.1Hz, 2H), 7.61(d, J=2.0Hz, 1H), 7.89(d, J=3.1Hz, 2H), 8.28(d, J=2.0Hz, 1H)	326.4
292	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amide		1.03(s, 9H), 1.26-1.40(m, 2H), 1.63(s, 6H), 2.32(s, 6H), 7.82(d, 1H), 7.99(d, 2H), 8.17 (d, 2H), 8.29(d, 1H)	368.5
293	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid benzothiazo-2-ylamide		9.80(s, 1H), 8.58(d, 1H), 8.46(m, 1H), 7.90(d, 2H), 7.70(d, 1H), 7.52(m, 2H), 7.46(m, 2H), 7.30(m, 2H)	389.4
294	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1H-indazo-6-yl)-amide		12.03(s, 1H), 9.50(s, 1H), 8.60(m, 1H), 8.50(m, 1H), 8.28(m, 1H), 8.17(s, 2H), 7.91(d, 2H), 7.62(s, 1H), 7.50(m, 1H), 7.09(d, 1H)	372.4
295	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-methyl-1H-indol-5-yl)-amide		11.22(s, 1H), 10.05(s, 1H), 8.57(d, 1H), 8.43(m, 2H), 7.80(m, 3H), 7.40(m, 5H), 6.97(d, 1H), 2.38(s, 3H)	385.4
296	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1H-indol-5-yl)-amide		11.38(s, 1H), 10.04(s, 1H), 8.47(m, 1H), 7.70(m, 4H), 7.42(m, 3H), 7.05(d, 1H), 6.50(s, 1H)	371.4

【 0 0 6 5 】

【表 1 - 4 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
297	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-trifluoromethoxy-phenyl)-amide		11.72(s,1H), 8.58(d,1H), 8.44(m,2H), 8.19(s,1H), 7.82(d,1H), 7.66(d,1H), 7.50(m,2H), 7.10(m,1H), 6.58(m,1H)	416.3
298	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (3,5-dimethoxy-phenyl)-amide		11.55(s,1H), 8.58(d,1H), 8.40(m,2H), 7.80(d,1H), 7.53(m,2H), 7.04(s,2H), 6.40(s,1H), 3.80(s,6H)	392.4
299	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-acetylamino-phenyl)-amide		11.76(s,1H), 10.11(s,1H), 8.54(d,1H), 8.42(m,1H), 7.82(m,1H), 7.50(m,2H), 7.38(m,2H), 7.01(d,1H), 2.04(s,3H)	389.4
300	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-cyano-phenyl)-amide		11.55(s,1H), 8.60(d,1H), 8.43(m,1H), 7.45(m,1H), 7.26(m,2H), 7.03(m, 5H)	357.3
301	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-benzyloxy-phenyl)-amide		11.58(s,1H), 8.58(d,1H), 8.40(m,2H), 7.84(d,1H), 7.77(s,1H), 7.48(m,4H), 7.30(m,4H), 5.18(s,2H)	438.5
302	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-phenyl-thiazo-2-yl)-amide		7.21-7.29(m, 7H), 7.38(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.88-7.90 (d, 1H), 8.29-8.35(m, 2H)	415.5

【表 1 - 4 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
303	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid o-tolylamide		11.76(s,1H), 10.11(s,1H), 8.54(d,1H), 8.42(m,1H), 7.82(m,1H), 7.50(m,2H), 7.38(m,2H), 7.01(d,1H), 2.35(s,3H)	346.4
304	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid benzo[1,3]dioxol-5-ylamide		7.82(m,1H), 7.40~7.50(m,3H), 7.38(m,2H), 7.23(m,1H), 7.01(m,2H), 6.06(s,2H)	376.4
305	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		11.63(s,1H), 8.95(s,1H), 8.60(d,1H), 8.44(m,2H), 7.90(d,1H), 7.56(m,3H), 2.89(s,3H), 2.60(s,3H)	361.4
306	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		11.75(s,1H), 8.78(d,1H), 8.52(d,1H), 8.40(m,2H), 7.80(d,1H), 7.47(m,2H), 7.00(d,1H), 3.90(s,3H)	397.8
307	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-5-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.00(s,1H), 8.55(d,1H), 8.42(m,2H), 8.24(d,1H), 7.78(d,1H), 7.59(s,1H), 7.48(m,2H), 3.50(s,3H), 2.10(s,3H)	377.4
308	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.86(s,1H), 9.37(s,1H), 8.65(m,1H), 8.56(d,1H), 8.45(m,3H), 7.95(d,1H), 7.80(d,1H), 7.50(m,2H), 7.45(m,3H), 2.75(s,3H)	347.4

【表 1 - 4 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
309	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-methanesulfonyl-phenyl)-amide		11.66(s,1H), 10.21(s,1H), 8.74(d,1H), 8.62(m,1H), 7.92(m,1H), 7.40(m,2H), 7.32(m,2H), 7.11(d,1H), 2.84(s,3H)	410.4
310	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-chloro-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.70(s,1H), 9.65(s,1H), 8.60(m,2H), 8.38(m,2H), 8.00(m,1H), 7.85(m,1H), 7.47(m,2H), 2.909(s,3H)	381.8
311	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-isobutoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.30(br, 1H), 8.58(t, 2H), 8.47(s, 1H), 7.89(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.34(t, 2H), 6.65(d, 1H), 3.92(d, 1H), 2.20(m, 1H), 1.03(d, 6H)	405.4
312	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-cyclopropylmethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.66(br, 1H), 8.45(m, 3H), 8.13(d, 1H), 7.85(d, 1H), 7.32(t, 2H), 6.94(d, 1H), 4.13(d, 2H), 1.41(m, 1H), 0.79(m, 2H), 0.57(m, 2H)	403.4
313	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[4-(2-dimethylamino-ethoxy)-pyridin-3-yl]-amide		9.44(br, 1H), 8.58~8.28(m, 3H), 8.00(d, 1H), 7.85(d, 1H), 7.35(m, 3H), 6.79(d, 1H), 4.61(t, 2H), 3.75(t, 2H), 2.99(s, 6H)	420.5
314	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[4-(2-morpholin-4-yl-ethoxy)-pyridin-3-yl]-amide		9.46(br, 1H), 8.62~8.35(m, 3H), 7.98(d, 2H), 7.98(d, 2H), 7.35(m, 3H), 7.98(d, 2H), 7.90(d, 2H), 7.35(m, 3H), 6.79(d, 1H), 4.85(t, 2H), 3.94(br, 4H), 3.69(t, 2H), 3.32(br, 4H)	462.5
315	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.30(s,1H), 8.55(d,1H), 8.50(m,2H), 8.24(d,1H), 7.80(d,1H), 7.44(m,3H), 2.34(s,3H)	381.8

【表 1 - 4 8】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
316	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-chloro-5-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.58(s,1H), 8.72(s,1H), 8.55(d,1H), 8.50(m,2H), 8.30(s,1H), 7.78(m,1H), 7.46(m,2H), 2.40(s,3H)	381.8
317	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-5-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.88(s,1H), 8.82(s,1H), 8.59(d,1H), 8.42(m,2H), 8.10(s,1H), 7.82(d,1H), 7.46(m,2H), 2.35(s,3H)	381.8
318	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (2,5-dichloro-pyridin-3-yl)-amide		11.88(s,1H), 8.98(s,1H), 8.48(s,1H), 8.36(m,2H), 8.25(s,1H), 7.76(s,1H), 7.40(m,2H)	402.2
319	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4,6-dichloro-pyrimidin-5-yl)-amide		11.55(s,1H), 8.97(s,1H), 8.57(d,1H), 8.49(m,2H), 7.81(d,1H), 7.43(m,2H)	403.2
320	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		8.58(d, 1H), 8.43(m, 2H), 8.35(m, 2H), 7.95(d, 1H), 7.38(m, 3H), 3.47(q, 2H), 1.56(t, 3H)	393.4
321	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-dimethylamino-pyridin-3-yl)-amide		11.44(s,1H), 8.75(s,1H), 8.55(d,1H), 8.48(m,2H), 8.22(m,1H), 7.80(d,1H), 7.62(m,2H), 7.47(m,2H), 7.30(d,1H), 7.02(d,1H), 3.25(s,3H), 3.05(s,3H)	376.4

【 0 0 6 9 】

【表 1 - 4 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
322	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-acetylamino-pyridin-3-yl)-amide		11.80(s, 1H), 8.85(s, 1H), 8.44(d, 1H), 8.41(m, 2H), 8.10(m, 1H), 7.68(d, 1H), 7.62(m, 2H), 7.35(m, 2H), 7.20(d, 1H), 7.10(d, 1H), 2.17(s, 3H)	390.4
323	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[6-(2-morpholin-4-yl-ethoxy)-pyridin-3-yl]-amide		8.59(br, 1H), 8.50(d, 1H), 8.34(m, 3H), 7.88~7.80(m, 2H), 7.36(t, 2H), 6.74(d, 1H), 4.42(t, 2H), 3.56(t, 2H), 3.40~3.33(m, 4H), 2.08(m, 4H)	462.5
324	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		8.52(d, 1H), 8.31(d, 2H), 8.12(s, 1H), 7.93(d, 1H), 7.76(m, 1H), 7.34(m, 2H), 2.66(s, 6H)	361.4
325	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		9.45(br, 1H), 8.48(d, 1H), 8.38(m, 2H), 7.95(d, 1H), 7.38(t, 2H), 7.08(s, 1H), 4.42(q, 2H), 2.52(s, 3H), 1.42(t, 3H)	391.4
326	2-(4-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.33(t, 3H), 3.19(s, 3H), 4.03(s, 2H), 7.34(s, 1H), 7.41(t, 2H), 7.70(s, 1H), 8.42(s, 1H), 8.50(t, 2H), 9.10(s, 1H)	407.5
327	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		3.00 (s, 1H), 3.20~3.40 (m, 4H), 3.50~3.60 (m, 2H), 4.21~4.05 (m, 2H), 7.23 (d, 2H), 7.86 (d, 1H), 8.00 (m, 1H), 8.24 (d, 2H), 8.42 (d, 1H), 8.58 (br, 1H), 8.70 (d, 1H), 9.58 (br, 1H)	413.5

【表 1 - 5 0】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
328	2-(4-methanesulfinylmethyl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		2.17 (s, 3H), 5.64 (s, 2H), 7.42 (t, 2H), 7.89 (br, 1H), 8.00 (d, 1H), 8.12~8.17 (m, 2H), 8.56~8.64 (m, 3H), 9.42 (br, 1H)	391.5
329	2-(4-diethylamino-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		1.25 (t, 6H), 3.56 (q, 4H), 6.95 (d, 2H), 7.85 (d, 1H), 8.00 (br, 1H), 8.16 (d, 2H), 8.50 (m, 1H), 8.61 (br, 1H), 8.70 (d, 1H), 9.61 (br, 1H)	386.5
330	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		3.36 (m, 4H), 3.87 (m, 4H), 7.14 (d, 2H), 7.87 (d, 1H), 8.10 (m, 1H), 8.21 (d, 2H), 8.60~8.40 (m, 2H), 8.72 (d, 1H), 9.61 (br, 1H)	400.4
331	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		1.41~1.25 (m, 6H), 3.13 (m, 4H), 6.95 (d, 2H), 7.51 (d, 1H), 7.65 (m, 1H), 7.88 (d, 2H), 8.18 (d, 1H), 8.23 (m, 1H), 8.38 (d, 1H), 9.22 (s, 1H)	398.5
332	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.09 (m, 4H), 3.40 (m, 4H), 6.70 (d, 2H), 7.85 (d, 1H), 8.03 (m, 3H), 8.38 (m, 1H), 8.50 (m, 1H), 9.95 (br, 1H)	398.5
333	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.82 (s, 6H), 3.23 (s, 3H), 6.85 (d, 1H), 7.37 (t, 1H), 7.84~8.10 (m, 4H), 8.27 (m, 1H), 8.38 (br, 1H), 8.56 (m, 1H)	372.4
334	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.97 (s, 3H), 3.39 (m, 4H), 7.20 (d, 2H), 7.99 (d, 1H), 8.16 (d, 1H), 8.19 (d, 2H), 8.58 (m, 2H), 9.80 (s, 1H)	414.5

【表 1 - 5 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
335	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.65~1.80 (m, 6H), 2.13 (m, 4H), 2.65 (s, 3H), 7.10 (d, 2H), 7.89 (d, 1H), 7.99 (m, 1H), 8.08 (d, 2H), 8.20~8.40 (m, 3H), 9.90 (br, 1H)	412.5
336	2-(4-dimethylamino-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid pyridin-3-ylamide		3.12 (s, 6H), 6.93 (d, 2H), 7.86 (d, 1H), 7.97 (m, 1H), 8.17 (d, 2H), 8.40~8.70 (m, 3H), 9.58 (br, 1H)	358.4
337	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.92 (s, 3 H), 3.00 (s, 3 H), 3.10~3.40 (bs, 4H), 3.64 (bs, 2 H), 4.09 (bs, 2 H), 7.17 (d, 2 H), 7.84 (d, 1H), 8.00 (bs, 1H), 8.10 (d, 2H), 8.40 (s, 1H), 8.52 (bs, 1H), 9.92 (bs, 1H)	427.5
338	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		3.01 (s, 3H), 3.31~3.20 (m, 4H), 3.54 (t, 2H), 3.71 (t, 2H), 4.10~3.80 (m, 4H), 6.90 (d, 2H), 7.92 (d, 1H), 8.01 (d, 1H), 8.18 (d, 2H), 8.42 (d, 1H), 8.58 (m, 1H), 9.95 (s, 1H)	457.5
339	2-[4-(3-morpholin-4-yl-propylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.98 (s, 3H), 4.18~3.45 (m, 8H), 6.84 (d, 2H), 7.86 (d, 1H), 8.04 (m, 3H), 8.72~8.30 (m, 2H), 9.98 (br, 1H)	471.6
340	2-[4-(3-pyrrolidin-1-yl-propylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.23~1.98 (m, 4H), 3.06 (s, 3H), 3.15 (m, 2H), 3.70 (m, 2H), 6.80 (d, 2H), 7.89 (d, 1H), 8.10~7.90 (m, 3H), 8.40 (d, 1H), 8.52 (d, 1H), 9.92 (s, 1H)	455.6

【 0 0 7 2】

【表 1 - 5 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
341	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.03 (s, 2 H), 2.64 (s, 3 H), 2.69 (t, 2H), 6.73 (d, 2 H), 7.39 (bs, 1 H), 7.80 (d, 1 H), 7.97 (d, 2H), 8.24 (bs, 1H), 8.31 (d, 1H), 9.49 (s, 1H)	415.5
342	2-[4-(3-dimethylamino-propylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.08 (m, 2 H), 2.90-2.94 (m, 9 H), 3.25-3.36 (m, 4H), 6.79 (d, 2 H), 7.86 (d, 1 H), 8.01-8.04 (m, 3 H), 8.39 (bs, 1H), 8.6 (bs, 1H), 9.90 (bs, 1H)	429.5
343	2-[4-(4-dimethylamino-butylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.66 (bd, 2 H), 2.01 (m, 2 H), 2.36 (t, 2H), 3.21 (m, 2 H), 6.70 (t, 2H), 7.41 (d, 1H), 7.78 (d, 1 H), 8.02 (d, 1 H), 8.24 (m, 2H), 8.30 (d, 1H), 9.49 (bd, 1H)	443.6
344	2-[4-[(2-diethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.27 (t, 6 H), 1.98-2.03 (m, 3 H), 2.58 (bs, 3H), 2.90-3.12 (m, 6 H), 3.34 (bs, 2H), 3.70 (ds, 2H), 6.79 (bs, 2H), 7.37 (bs, 1 H), 7.76 (bs, 1 H), 7.92 (bs, 2H), 8.24 (bs, 2H), 9.44 (bs, 1H)	457.6
345	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.95(s, 3H), 0.96(s, 3H), 1.23(s, 3H), 1.15-2.12(m, 1H), 1.45-1.63(m, 3H), 2.12-2.19(m, 4H), 3.00(s, 3H), 3.04-3.14(m, 4H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.89(d, J=3.6Hz, 2H), 7.69(d, J=2.4Hz, 1H), 8.02(d, J=3.6Hz, 2H), 8.30(d, J=2.4Hz, 1H)	472.6
346	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.99(s, 3H), 1.01(s, 3H), 1.23(s, 3H), 1.17-2.18(m, 1H), 1.35-1.62(m, 3H), 2.10-2.30(b, 4H), 3.14-3.23(b, 4H), 4.42-4.51(m, 1H), 6.99(d, J=3.6Hz, 2H), 7.80(d, J=2.4Hz, 1H), 8.02(d, J=3.6Hz, 2H), 8.33(d, J=2.4Hz, 1H)	459.6

【表 1 - 5 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
347	2-[4-(piperidin-4-ylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		0.96(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.13(s, 3H), 1.17-2.02(m, 9H), 1.41-1.63(m, 3H), 1.78-2.02(m, 3H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.82(d, 2H), 7.79(d, 1H), 8.12(d, 2H), 8.40(d, 1H)	472.6
348	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid adamantan-2-ylamide		CDCl ₃ : 1.25-2.01(m, 15H), 2.24-2.43(b, 4H), 2.88(s, 3H), 3.43-3.67(b, 4H), 6.83-7.78(m, 4H), 8.15-8.23(m, 3H), 8.39-8.51(b, 1H)	470.6
349	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid adamantan-2-ylamide		CDCl ₃ : 1.22-1.90(m, 15H), 2.45-2.56(b, 4H), 3.51-3.57(b, 4H), 7.23-7.56(m, 4H), 8.25-8.28(m, 3H), 8.31-8.45(b, 1H)	457.6
350	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cycloheptylamide		CD ₃ OD: 1.34-1.99(m, 12H), 2.34-2.43(b, 4H), 2.98(s, 3H), 3.32-3.56(b, 4H), 4.24-4.28(m, 1H), 6.82 (d, 3.6Hz, 2H), 7.21 (d, 2.1Hz, 1H), 7.82 (d, 3.6Hz, 2H), 8.29 (d, 2.1Hz, 1H)	432.6
351	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cycloheptylamide		CD ₃ OD: 1.37-1.99(m, 12H), 2.45-2.66(b, 4H), 3.52-3.63(b, 4H), 4.21-4.28(m, 1H), 6.92 (d, 3.4Hz, 2H), 7.23 (d, 2.4Hz, 1H), 7.79 (d, 3.4Hz, 2H), 8.38 (d, 2.4Hz, 1H)	419.5
352	2-(4-thiomorpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cycloheptylamide		CD ₃ OD: 1.37-1.99(m, 12H), 2.45-2.66(b, 4H), 3.52-3.63(b, 4H), 4.21-4.28(m, 1H), 6.92 (d, 3.4Hz, 2H), 7.23 (d, 2.4Hz, 1H), 7.79 (d, 3.4Hz, 2H), 8.38 (d, 2.4Hz, 1H)	435.6

【表 1 - 5 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
353	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-azabicyclo[2.2.2]octyn-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 2.18-2.24(m, 3H), 2.40-2.53(m, 2H), 3.00(s, 3H), 3.20-3.64(m, 11H), 3.92-3.99(m, 1H), 4.02-4.22(m, 1H), 4.61-4.31(m, 1H), 7.23(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.18(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	445.6
354	2-[4-(piperidin-4-ylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.36-1.66(m, 5H), 1.62-1.79(m, 5H), 2.02-2.19(m, 4H), 2.95-3.02(m, 2H), 3.36-3.61(m, 1H), 4.01-4.18(m, 3H), 7.18(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	418.5
355	2-[4-(2-piperazin-1-ylethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.46-1.60(m, 6H), 1.82-1.95(m, 4H), 1.98-2.19(m, 4H), 2.99-3.07(m, 2H), 3.39(t, 2.8Hz, 2H), 3.59-3.61(m, 1H), 3.64(t, 2.8Hz, 2H), 4.01-4.18(m, 1H), 6.81(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.13(d, J=3.4Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	447.6
356	2-[4-(2-morpholin-4-ylethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.46-1.60(m, 6H), 1.80-1.95(m, 2H), 2.00-2.19(m, 2H), 2.99-3.60(m, 4H), 3.41(t, 2.8Hz, 2H), 3.64(t, 2.8Hz, 2H), 3.80-4.15(m, 5H), 6.91(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.10(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39(d, J=2.4Hz, 1H)	448.6
357	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.34-1.62(m, 5H), 1.60-1.73(m, 5H), 2.12-2.19(m, 4H), 2.90-3.12(m, 2H), 3.46-3.61(m, 1H), 4.11-4.18(m, 3H), 7.18(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	405.5

【表 1 - 5 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
358	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.39-1.65(m, 6H), 1.80-2.19(m, 4H), 3.00(s, 3H), 3.19-3.44(b, 4H), 3.52-3.69(m, 2H), 4.05-4.19(b, 3H), 7.21(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.19(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	418.5
359	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.47-1.590(m, 6H), 1.81-1.92(m, 2H), 2.01-2.13(m, 2H), 2.99(s, 6H), 3.41(t, 2.8Hz, 2H), 3.63(t, 2.8Hz, 2H), 4.01-4.18(m, 1H), 6.91(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.13(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	406.5
360	2-[4-[(2-diethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.39(t, 2.8Hz, 6H), 1.46-1.71(m, 6H), 1.81-1.92(m, 2H), 2.01-2.13(m, 2H), 3.19(s, 3H), 3.31-3.40(m, 6H), 3.93(t, 2.8Hz, 2H), 4.05-4.17(m, 1H), 7.01(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.16(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39(d, J=2.4Hz, 1H)	448.6
361	2-[4-(4-ethyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid cyclohexylamide		CD ₃ OD: 1.39-1.69(m, 9H), 1.80-2.19(m, 4H), 3.33(s, 3H), 3.19-3.39(b, 4H), 3.62-3.80(m, 2H), 4.02-4.17(b, 3H), 7.20(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.18(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	432.6
362	2-(4-morpholin-4-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-azabicyclo[2.2.2]octyn-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 2.11-2.25(m, 3H), 2.42-2.51(m, 2H), 3.19-3.54(m, 10H), 3.91-3.95(m, 1H), 4.06-4.22(m, 1H), 4.61-4.31(m, 1H), 7.23(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.18(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	432.5

【表 1 - 5 6】

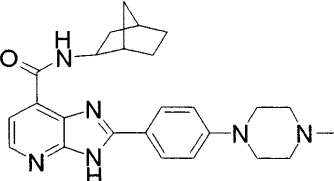
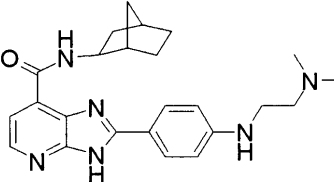
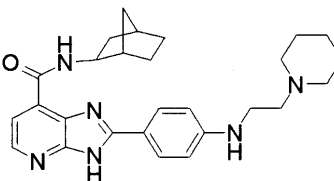
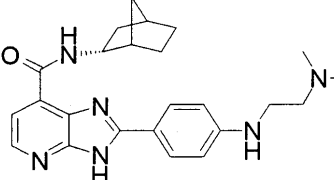
Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
363	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2,6,6-trimethyl-bicyclo[3.1.1]heptin-3-yl)-amide		CD ₃ OD: 1.17(m, 3H), 1.23(d, 2.6Hz, 3H), 1.27-1.38(m, 1H), 1.37(s, 3H), 1.79-1.83(m, 1H), 1.92-1.94(m, 1H), 2.01-2.10(m, 1H), 2.12-2.21(m, 1H), 2.56-2.61(m, 1H), 2.69-2.81(m, 1H), 3.24-3.60(b, 4H), 3.23(t, J=2.5Hz, 2H), 3.63(t, J=2.5Hz, 2H), 3.90-4.09(b, 4H), 4.62-4.65(m, 1H), 6.93(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.11(d, J=3.4Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	502.7
364	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD: 1.03-1.15(m, 2H), 1.47-1.52(m, 4H), 1.64-2.02(m, 4H), 2.22-2.24(m, 1H), 2.31-2.35(m, 1H), 2.53-2.57(m, 1H), 2.55-2.59(m, 1H), 3.22-3.25(m, 2H), 3.29-3.60(b, 4H), 3.43(t, J=3.5Hz, 2H), 3.68(t, J=3.5Hz, 2H), 3.80-4.00(b, 4H), 4.42-4.45(m, 1H), 6.91(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.17(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39(d, J=2.4Hz, 1H)	460.6
365	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2,6-dimethyl-phenyl)-amide		CD ₃ OD: 2.59(s, 6H), 3.42(t, J=3.6Hz, 2H), 3.40-3.45(m, 4H), 3.63(t, J=3.6Hz, 2H), 3.71-4.02(m, 4H), 6.92(d, J=3.6Hz, 2H), 7.90(d, J=2.4Hz, 1H), 8.18(d, J=3.6Hz, 2H), 8.45(d, J=2.4Hz, 1H)	470.6
366	2-[4-(2-piperidin-1-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.96(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.13(s, 3H), 1.17-2.02(m, 1H), 1.41-1.63(m, 3H), 1.78-2.02(m, 7H), 2.12-2.19(m, 1H), 2.43-2.59(m, 1H), 3.04-3.14(m, 2H), 3.39(t, J=3.0Hz, 2H), 3.59-3.62(m, 2H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.82(d, J=3.6Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.12(d, J=3.6Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	500.7

【表 1 - 5 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
367	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-hydroxy-cyclohexyl)-amide		CD ₃ OD: 1.53-1.59(m, 4H), 2.09-2.23(m, 4H), 3.42-3.50(m, 4H), 3.42(t, J=2.1Hz, 2H), 3.71(t, J=2.1Hz, 2H), 3.79-4.12(m, 6H), 6.92(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.16(d, J=3.4Hz, 2H), 8.41(d, J=2.4Hz, 1H)	464.6
368	2-[4-(2-morpholin-4-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 1.01(s, 3H), 1.10(s, 3H), 1.15-1.16(m, 1H), 1.42-1.62(m, 2H), 1.78-1.81(m, 1H), 1.88-2.19(m, 2H), 2.47-2.59(m, 1H), 3.24-3.44(b, 4H), 3.44(t, J=3.2Hz, 2H), 3.63(t, J=3.2Hz, 2H), 4.48-4.54(m, 1H), 6.85(d, J=3.4Hz, 2H), 7.77(d, J=2.4Hz, 1H), 8.13(d, J=3.4Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	502.7
369	2-[4-(2-piperazin-1-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 1.01(s, 3H), 1.10(s, 3H), 1.19-1.21(m, 1H), 1.44-1.69(m, 2H), 1.78-1.82(m, 1H), 1.88-2.29(m, 2H), 2.49-2.59(m, 1H), 3.24-3.44(m, 6H), 3.24(t, J=3.2Hz, 2H), 3.43-3.46(b, 4H), 4.48-4.54(m, 1H), 7.19(d, J=3.1Hz, 2H), 7.80(d, J=2.4Hz, 1H), 8.19(d, J=3.4Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	501.7
370	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.92(s, 3H), 1.00(s, 3H), 1.09(s, 3H), 1.19-1.20(m, 1H), 1.42-1.63(m, 2H), 1.79-1.82(m, 1H), 1.90-2.19(m, 2H), 2.46-2.59(m, 1H), 2.99(s, 6H), 3.41(t, J=3.6Hz, 2H), 3.63(t, J=3.6Hz, 2H), 4.48-4.59(m, 1H), 6.98(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.12(d, J=3.4Hz, 2H), 8.40(d, J=2.4Hz, 1H)	460.6

【 0 0 7 8 】

【表 1 - 5 8】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
371	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD: 1.18-1.24(m, 1H), 1.44-1.61(m, 4H), 1.69-1.80(m, 1H), 1.69-1.80(m, 1H), 1.89-2.01(m, 1H), 2.21-2.31(m, 1H), 2.41-2.43(m, 1H), 2.59-2.60(m, 1H), 3.00(s, 3H), 3.14-3.40(m, 4H), 4.48-4.54(m, 1H), 7.21(d, J=3.6Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.20(d, J=3.6Hz, 2H), 8.42(d, J=2.4Hz, 1H)	430.6
372	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD: 1.25-1.27(m, 1H), 1.43-1.45(m, 2H), 1.60-1.62(m, 2H), 1.71-1.74(m, 1H), 1.91-1.94(m, 1H), 2.25-2.27(m, 1H), 2.35-2.38(m, 1H), 2.59-2.60(m, 1H), 2.99(s, 6H), 3.41(t, J=2.4Hz, 2H), 3.64(t, J=2.4Hz, 2H), 6.92(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.11(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39(d, J=2.4Hz, 1H)	418.5
373	2-[4-(2-piperidin-1-ylethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD: 1.23-1.25(m, 2H), 1.49-1.52(m, 4H), 1.74-1.82(m, 4H), 1.91-1.94(m, 3H), 2.21-2.23(m, 1H), 2.35-2.37(m, 1H), 2.55-2.59(m, 1H), 3.02-3.05(m, 2H), 3.39(t, J=3.1Hz, 2H), 3.72(t, J=3.1Hz, 2H), 4.39-4.42(m, 1H), 6.95(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.13(d, J=3.4Hz, 2H), 8.35(d, J=2.4Hz, 1H)	458.6
374	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid bicyclo[2.2.1]heptin-2-ylamide		CD ₃ OD+CDCl ₃ : 1.15-1.17(m, 3H), 1.38-1.71(m, 4H), 1.98-2.03(m, 1H), 2.42(s, 2H), 3.14(d, J=3.1Hz, 1H), 3.61(d, J=3.1Hz, 1H), 3.99-4.01(m, 1H), 6.94(d, J=3.4Hz, 1H), 7.67(d, J=2.4Hz, 1H), 8.16(t, J=3.4Hz, 2H), 8.28(d, J=2.4Hz, 1H)	418.5

【表 1 - 5 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
375	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-amino-cyclohexyl)-amide		CD ₃ OD: 1.60-2.28(m, 8H), 3.39(s, 6H), 3.43(t, 1.2Hz, 2H), 3.62(t, 1.2Hz, 2H), 4.43-4.44(m, 1H), 6.86(d, J=3.4Hz, 2H), 7.75(d, J=2.4Hz, 1H), 8.09(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39(d, J=2.4Hz, 1H)	421.5
376	2-[4-(2-diethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 0.97(s, 3H), 1.12(s, 9H), 1.05-1.08(m, 1H), 1.21-1.64(m, 4H), 1.77-1.79(m, 1H), 1.82-2.19(m, 3H), 2.43-2.63(m, 6H), 4.42-4.47(m, 1H), 6.72(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.31(d, J=2.4Hz, 1H)	488.7
377	2-[4-(3-dimethylamino-propylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.08(s, 3H), 1.15-1.18(m, 1H), 1.28-1.60(m, 4H), 1.77-1.82(m, 2H), 1.92-2.19(m, 2H), 2.23- (s, 6H), 2.47-2.53(m, 4H), 4.49-4.52(m, 1H), 6.69(d, J=3.4Hz, 2H), 7.71(d, J=2.4Hz, 1H), 8.09(d, J=3.4Hz, 2H), 8.36(d, J=2.4Hz, 1H)	474.7
378	2-[4-(2-pyrrolidin-1-yl-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 0.98(s, 3H), 1.06(s, 3H), 1.12-1.16(m, 1H), 1.26-1.59(m, 4H), 1.78-2.19(m, 2H), 1.80-1.86(m, 4H), 2.67-2.71(m, 4H), 2.83(t, J=2.2Hz, 2H), 3.36(t, J=2.2Hz, 2H), 4.43-4.54(m, 1H), 6.75(d, J=3.4Hz, 2H), 7.74(d, J=2.4Hz, 1H), 8.03(d, J=3.4Hz, 2H), 8.32(d, J=2.4Hz, 1H)	486.7
379	2-[4-[3-(4-methyl-piperazin-1-yl)-propylamino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.93(s, 3H), 0.98(s, 3H), 1.06(s, 3H), 1.12-1.34(m, 5H), 1.47-1.59(m, 2H), 1.78-1.83(m, 4H), 1.97-2.16(m, 3H), 2.47-2.53(m, 10H), 3.22-3.28(m, 2H), 4.43-4.51(m, 1H), 6.72(d, J=3.6Hz, 2H), 7.71(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.6Hz, 2H), 8.30(d, J=2.4Hz, 1H)	529.7

【表 1 - 6 0】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
380	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-hydroxy-1,1-dimethyl-ethyl)-amide		CD ₃ OD: 1.58(s, 6H), 2.99(s, 6H), 3.41(t, J=2.6Hz, 2H), 3.68(d, J=2.6Hz, 1H), 3.81(s, 2H), 6.93(d, J=4.4Hz, 1H), 7.78(d, J=3.4Hz, 2H), 8.15(d, J=4.4Hz, 1H), 8.41(d, J=3.4Hz, 2H)	396.5
381	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,1-dimethyl-propyl)-amide		CD ₃ OD: 1.13(t, J=2.8Hz, 3H), 1.27(d, J=2.1Hz, 1H), 1.59(s, 6H), 1.27(d, J=2.1Hz, 1H), 6.79(d, J=3.4Hz, 2H), 7.62(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.34(d, J=2.4Hz, 1H)	394.5
382	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3,3,5-trimethyl-cyclohexyl)-amide		CD ₃ OD: 0.72(s, 3H), 1.45(s, 6H), 1.24-1.60(m, 6H), 2.39(s, 6H), 2.68(t, J=2.4Hz, 2H), 3.98-4.01(m, 1H), 6.79(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.34(d, J=2.4Hz, 1H)	448.6
383	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid tert-butylamide		CD ₃ OD: 1.59(s, 9H), 2.99(s, 6H), 3.42(t, J=2.1Hz, 2H), 3.61(t, J=2.1Hz, 2H), 6.91(d, J=3.4Hz, 2H), 7.78(d, J=2.4Hz, 1H), 8.10(d, J=3.4Hz, 2H), 8.21(d, J=2.4Hz, 1H)	380.5
384	2-[4-(3-diethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		CD ₃ OD: 0.92(s, 3H), 0.98(s, 3H), 1.05(s, 6H), 1.04-1.09(m, 1H), 1.24-1.56(m, 3H), 1.76-1.79(m, 1H), 1.84-1.97(m, 2H), 2.13-2.23(m, 2H), 2.49-2.52(m, 1H), 2.69-2.74(m, 4H), 3.05-3.21(m, 1H), 3.33-3.48(m, 2H), 3.33-3.48(m, 2H), 4.45-4.48(m, 1H), 6.68(d, J=3.4Hz, 2H), 6.79(d, J=2.4Hz, 1H), 7.92(d, J=3.4Hz, 2H), 8.21(d, J=2.4Hz, 1H)	514.7

10

20

30

40

【表 1 - 6 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
385	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-dimethylamino-1-methyl-ethyl)-amide		CD ₃ OD: 1.42(d, J=3.6Hz, 3H), 2.98(s, 6H), 3.04-3.69(m, 10H), 6.88(d, J=3.4Hz, 2H), 7.79(d, J=2.4Hz, 1H), 8.14(d, J=3.4Hz, 2H), 8.21(d, J=2.4Hz, 1H)	409.5
386	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-ethoxy-phenyl)-amide		CD ₃ OD: 2.21(t, J=2.7Hz, 3H), 2.99(s, 6H), 3.45(t, J=2.1Hz, 2H), 3.69(t, J=2.1Hz, 2H), 4.37(q, J=2.7Hz, 2H), 6.97(d, J=3.4Hz, 2H), 7.01-7.22(m, 3H), 7.96(d, J=2.4Hz, 1H), 8.22(d, J=3.4Hz, 2H), 8.39-8.40(m, 1H), 8.46(d, J=2.4Hz, 1H)	444.5
387	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-hydroxy-cyclopentyl)-amide		CD ₃ OD: 1.62-2.02(m, 6H), 2.99(s, 6H), 3.40(t, J=2.1Hz, 2H), 3.71(t, J=2.1Hz, 2H), 4.19-4.39(m, 2H), 6.87(d, J=3.4Hz, 2H), 7.76(d, J=2.4Hz, 1H), 8.12(d, J=3.4Hz, 2H), 8.26(d, J=2.4Hz, 1H)	408.5
388	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-hydroxymethyl-cyclopentyl)-amide		1.62-2.02(m, 6H), 2.99(s, 6H), 3.40(t, 2H), 3.60-3.80(m, 4H), 4.19-4.39(m, 2H), 6.87(d, 2H), 7.76(d, 1H), 8.12(d, 2H), 8.26(d, 1H)	422.5
389	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(3-imidazo-1-yl-propyl)-amide		CD ₃ OD: 2.06-2.15(m, 2H), 3.00(s, 6H), 2.31(t, J=1.4Hz, 2H), 3.34(t, J=1.4Hz, 2H), 3.46-3.55(m, 2H), 4.11(t, J=2.4Hz, 2H), 6.99(b, 1H), 7.21(b, 1H), 7.23(d, J=3.4Hz, 2H), 7.70(d, J=1.4Hz, 1H), 8.15(d, J=3.4Hz, 2H), 8.43(d, J=1.4Hz, 1H), 9.42(s, 1H)	432.5

【表 1 - 6 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
390	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid[3-(4,5-dichloro-imidazo-1-yl)-propyl]-amide		CD ₃ OD: 2.02-2.13(m, 2H), 2.99(s, 6H), 2.30(t, J=2.4Hz, 2H), 3.38(t, J=2.4Hz, 2H), 3.46-3.55(m, 2H), 4.11(t, J=2.4Hz, 2H), 7.22(d, J=3.4Hz, 2H), 7.63(d, J=1.4Hz, 1H), 8.05(d, J=3.4Hz, 2H), 8.18(d, J=1.4Hz, 1H)	501.4
391	2-[4-(3-pyrrolidin-1-yl-propylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-pyridin-3-yl-ethyl)-amide		2.23~ 1.98 (m, 4H), 3.15 (m, 2H), 3.31 (t, 2H), 3.70 (m, 2H), 4.00 (t, 2H), 7.38 (t, 2H), 7.75 (d, 1H), 8.02 (m, 1H), 8.31 (m, 2H), 8.45 (d, 1H), 8.70 (m, 2H), 8.88 (s, 1H)	469.6
392	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,3,3-trimethyl-butyl)-amide		CD ₃ OD: 1.12(s, 9H), 1.28(d, J=1.4Hz, 3H), 1.30(d, J=1.4Hz, 3H), 2.34(s, 6H), 2.62(t, J=2.4Hz, 2H), 3.34(t, J=2.4Hz, 2H), 4.10(q, J=1.8Hz, 2H), 6.75(d, J=3.4Hz, 2H), 7.73(d, J=2.4Hz, 1H), 8.01(d, J=3.4Hz, 2H), 8.31(d, J=2.4Hz, 1H)	422.6
393	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,4-dimethyl-pentyl)-amide		CD ₃ OD: 0.96(d, J=4.4Hz, 3H), 1.01(d, J=4.4Hz, 3H), 1.26-1.29(m, 2H), 1.29(d, J=3.1Hz, 3H), 1.48-1.67(m, 2H), 1.86-1.89(m, 1H), 2.33(s, 6H), 2.62(t, J=2.4Hz, 2H), 3.33(t, J=2.4Hz, 2H), 4.27(q, J=1.2Hz, 2H), 6.74(d, J=3.4Hz, 2H), 7.69(d, J=2.4Hz, 1H), 7.99(d, J=3.4Hz, 2H), 8.30(d, J=2.4Hz, 1H)	422.6
394	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1-ethyl-propyl)-amide		CD ₃ OD: 1.23(t, J=3.4Hz, 6H), 3.00(s, 6H), 3.27(q, J=1.2Hz, 4H), 3.32(t, J=2.4Hz, 2H), 3.53(t, J=2.4Hz, 2H), 4.21-4.28(m, 1H), 6.99 (d, J=3.1Hz, 2H), 7.61(d, J=2.0Hz, 1H), 7.89(d, J=3.1Hz, 2H), 8.28(d, J=2.0Hz, 1H)	394.5

【表 1 - 6 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
395	2-[4-(2-dimethylamino-ethylamino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(1,1,3,3-tetramethyl-butyl)-amide		CD ₃ OD: 1.03(s, 9H), 1.01(d, J=4.4Hz, 3H), 1.26-1.40(m, 2H), 1.63(s, 6H), 2.32(s, 6H), 2.61(d, J=2.4Hz, 3H), 3.33(t, J=2.4Hz, 2H), 4.27(q, J=1.2Hz, 2H), 6.79(d, J=3.1Hz, 2H), 7.82(d, J=2.2Hz, 1H), 7.99(d, J=3.1Hz, 2H), 8.29(d, J=2.2Hz, 1H)	436.6
396	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.58(s, 3H), 3.86(s, 3H), 7.17(d, 2H), 7.38(d, 1H), 7.82(d, 1H), 8.26(s, 1H), 8.29(t, 2H), 8.50(s, 1H), 9.38(s, 1H), 11.47(s, 1H)	359.4
397	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		12.07(s, 1H), 9.73(s, 1H), 8.61(d, 1H), 8.54(d, 1H), 8.33(d, 2H), 7.86(d, 1H), 7.77(d, 1H), 7.24(d, 2H), 4.67(q, 2H), 3.90(s, 3H), 1.49(t, 3H)	389.4
398	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		3.86(d, 6H), 6.92(d, 1H), 7.17(d, 2H), 7.73(d, 1H), 8.21(dd, 1H), 8.34(d, 2H), 8.45(d, 1H), 8.64(d, 2H), 11.68(br s, 1H)	375.4
399	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.79(s, 1H), 9.09(s, 1H), 8.49(d, 1H), 8.35(m, 3H), 7.78(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.20(d, 2H), 3.88(s, 3H), 2.60(s, 3H)	359.4
400	2-[4-(4-dimethylamino-butyl amino)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.58(br, 1H), 8.40~ 8.20(m, 2H), 8.11(d, 2H), 7.83(d, 1H), 6.78(d, 2H), 4.48(m, 2H), 2.99(m, 2H), 2.76(s, 6H), 1.95~ 1.73(m, 6H), 1.50(t, 3H)	473.6

【表 1 - 6 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
401	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		10.97(s, 1H), 8.48(d, 1H), 8.41(s, 1H), 8.24(d, 2H), 7.77(d, 1H), 7.18(d, 2H), 6.40(s, 1H), 3.87(s, 3H), 3.46(s, 3H), 2.37(s, 3H)	389.4
402	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.70(s, 1H), 9.30(s, 1H), 8.50(d, 1H), 8.22(m, 3H), 7.78(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.12(d, 2H), 3.34(m, 8H), 2.49(s, 3H)	427.5
403	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		11.87(br, 1H), 9.43(s, 1H), 8.49(d, 1H), 8.42(d, 1H), 8.28(d, 2H), 8.82(d, 1H), 7.77(d, 1H), 6.70(d, 2H), 3.36(m, 6H), 2.00(m, 4H), 1.42(t, 3H)	444.6
404	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.61(br, 1H), 8.31(d, 1H), 8.13(m, 3H), 7.80(d, 1H), 7.35(m, 1H), 6.68(d, 2H), 3.32(m, 4H), 2.09(m, 4H), 1.51(t, 3H)	428.5
405	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		8.87(br, 1H), 8.34(d, 1H), 8.16(d, 2H), 8.08(br, 1H), 7.72(d, 1H), 7.30(d, 1H), 6.72(d, 2H), 3.33(m, 4H), 2.56(s, 3H), 2.00(m, 4H)	398.5
406	2-[4-(3-diethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		9.32(br, 1H), 8.40~8.20(m, 4H), 7.82(d, 1H), 7.48(d, 1H), 6.72(d, 2H), 4.18(t, 1H), 3.84(t, 1H), 3.68(t, 1H), 3.58~3.40(m, 2H), 3.22(m, 6H), 2.60(m, 1H), 2.23(m, 1H), 1.39(m, 9H)	515.7

【表 1 - 6 5】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
407	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.33(br, 1H), 8.39(m, 2H), 8.19(d, 2H), 7.84(d, 1H), 7.35(m, 1H), 7.13(m, 2H), 4.46(q, 2H), 3.51(m, 4H), 3.00(m, 4H), 2.65(s, 3H), 1.47(t, 3H)	457.5
408	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.80(t, 3H), 1.90(t, 3H), 1.97(s, 5H), 3.57(t, 3H), 6.65(d, 2H), 7.10(d, 1H), 8.03(d, 2H), 8.11(d, 1H), 8.20(d, 1H), 8.30(d, 1H)	428.5
409	2-[4-(3-diethylamino-pyrrolidin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		1.22-1.26(m, 6H), 2.18(t, 2H), 3.38(s, 3H), 3.41-3.53(m, 2H), 3.64(t, 2H), 3.82(t, 2H), 4.15(d, 2H), 6.85(d, 2H), 7.35(d, 1H), 7.73(d, 1H), 8.25(d, 2H), 8.41(d, 1H), 8.88(s, 1H), 9.42(br s, 1H), 11.87(br s, 1H)	469.6
410	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.40(s, 3H), 2.74(s, 4H), 3.18(s, 4H), 3.46(s, 6H), 6.43(s, 1H), 7.18(d, 2H), 7.74(d, 1H), 8.18(d, 2H), 8.44(d, 1H), 8.50(s, 1H), 11.09(s, 1H)	457.5
411	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.60(br, 1H), 8.36(d, 1H), 8.25(d, 1H), 8.15(d, 2H), 7.84(d, 1H), 7.21(d, 1H), 7.07(d, 2H), 4.48(q, 2H), 3.37(m, 4H), 1.75(m, 6H), 1.48(t, 3H)	442.5

【 0 0 8 6 】

【表 1 - 6 6】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
412	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		8.93(br, 1H), 8.39(d, 1H), 8.26(d, 1H), 8.13(d, 2H), 7.82(d, 1H), 7.38(d, 1H), 7.11(d, 2H), 3.39(m, 4H), 2.55(s, 3H), 1.71(m, 6H)	412.5
413	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		8.53(d, 1H), 8.39(s, 1H), 8.25(d, 2H), 7.90(d, 1H), 7.45(d, 2H), 6.56(s, 1H), 3.62(s, 3H), 3.57(m, 4H), 2.63(s, 3H), 1.90~1.78(m, 6H)	442.5
414	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		9.73(s, 1H), 8.42(d, 1H), 8.06(q, 2H), 7.88(m, 2H), 7.09(d, 2H), 3.41(m, 4H), 2.78(s, 3H), 1.76(m, 6H)	426.5
415	2-(4-pyrrolidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		8.41(m, 1H), 8.09(d, 2H), 7.88(d, 1H), 7.42(s, 1H), 7.08(d, 2H), 6.73(d, 1H), 3.44(m, 4H), 2.70(m, 6H), 1.93(br, 4H)	412.5
416	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		8.63(d, 1H), 8.25(d, 2H), 8.07(m, 2H), 7.96(d, 1H), 7.27(d, 2H), 3.00(s, 3H), 2.76(s, 3H), 2.55(s, 3H)	441.5

【 0 0 8 7 】

【表 1 - 6 7】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
417	2-(4-piperidin-1-yl-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		11.69(s, 1H), 9.27(s, 1H), 8.43(d, 1H), 8.30(m, 3H), 7.77(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.07(2H), 3.37(m, 4H), 3.21(q, 2H), 1.61(m, 6H), 1.36(t, 3H)	458.6
418	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		11.63(s, 1H), 9.28(s, 1H), 8.46(d, 1H), 8.32(m, 3H), 7.80(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.10(d, 2H), 3.34(m, 8H), 3.21(q, 2H), 2.24(s, 3H), 1.38(t, 3H)	473.6
419	2-[4-[(2-dimethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4,6-dimethyl-pyridin-3-yl)-amide		2.46(s, 4H), 2.56(s, 3H), 2.85(s, 5H), 3.00(s, 3H), 3.39(s, 3H), 6.97(d, 2H), 7.23(s, 1H), 7.78(s, 1H), 8.17(d, 2H), 8.43(d, 1H), 9.26(s, 1H), 9.37(br s, 1H), 11.45(s, 1H)	443.6
420	2-[4-[(2-dimethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		9.57(br, 1H), 8.42~8.22(m, 2H), 8.12(d, 2H), 7.78(d, 1H), 6.90(d, 2H), 4.45(q, 2H), 3.82(t, 2H), 3.10(s, 3H), 2.89(m, 8H), 1.46(t, 3H)	459.6
421	2-[4-[(2-dimethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		8.83(br, 1H), 8.38(d, 1H), 8.21(de, 1H), 8.09(d, 2H), 7.76(d, 1H), 7.34(d, 1H), 6.93(d, 2H), 3.78(t, 2H), 3.20(t, 2H), 3.10(s, 10H), 2.55(s, 3H)	429.5
422	2-[4-[(2-dimethylamino-ethyl)-methyl-amino]-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		9.32(br, 1H), 8.48~8.38(m, 2H), 8.24(d, 2H), 7.83(d, 1H), 7.50(d, 1H), 6.90(d, 2H), 3.35(t, 2H), 3.30~2.89(m, 7H), 2.61(s, 6H), 1.43(t, 3H)	475.6

【表 1 - 6 8】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
423	2-[4-(4-methyl-piperazin-1-yl)-phenyl]-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		9.45(br, 1H), 8.38(dm 1H), 8.14(d, 2H), 7.78(d, 1H), 7.38(m, 1H), 7.12(d, 1H), 4.40(q, 2H), 3.55(br, 4H), 3.15(br, 4H), 2.76(s, 3H), 2.55(s, 1H), 1.45(t, 3H)	471.6
424	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.58(s, 3H), 3.86(s, 3H), 7.17(d, 2H), 7.38(d, 1H), 7.82(d, 1H), 8.26(s, 1H), 8.29(t, 2H), 8.50(s, 1H), 9.38(s, 1H), 11.47(s, 1H)	359.4
425	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		12.07(s, 1H), 9.73(s, 1H), 8.61(d, 1H), 8.54(d, 1H), 8.33(d, 2H), 7.86(d, 1H), 7.77(d, 1H), 7.24(d, 2H), 4.67(q, 2H), 3.90(s, 3H), 1.49(t, 3H)	389.4
426	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		3.86(d, 6H), 6.92(d, 1H), 7.17(d, 2H), 7.73(d, 1H), 8.21(dd, 1H), 8.34(d, 2H), 8.45(d, 1H), 8.64(d, 2H), 11.68(br s, 1H)	375.4
427	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.79(s, 1H), 9.09(s, 1H), 8.49(d, 1H), 8.35(m, 3H), 7.78(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.20(d, 2H), 3.88(s, 3H), 2.60(s, 3H)	359.4
428	2-(4-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		10.97(s, 1H), 8.48(d, 1H), 8.41(s, 1H), 8.24(d, 2H), 7.77(d, 1H), 7.18(d, 2H), 6.40(s, 1H), 3.87(s, 3H), 3.46(s, 3H), 2.37(s, 3H)	389.4

【表 1 - 6 9】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
429	6-bromo-2-(3-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		9.31(br, 1H), 9.12(br, 1H), 8.62(d, 1H), 8.35~8.29(m, 2H), 7.99(s, 1H), 7.95(d, 1H), 7.68~7.59(m, 2H), 7.47(t, 1H), 4.46(s, 3H), 2.29(s, 3H)	438.3
430	2-(3-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.73(s, 1H), 9.66(s, 1H), 8.60(d, 2H), 7.95(m, 4H), 7.50(m, 1H), 7.20(d, 1H), 3.90(s, 3H), 2.86(s, 3H)	359.4
431	2-(3-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methoxy-pyridin-3-yl)-amide		3.86(s, 3H), 3.88(s, 3H), 6.92(d, 1H), 7.16(q, 1H), 7.54(t, 1H), 7.77(d, 1H), 7.92(s, 1H), 7.99(d, 1H), 8.19(q, 1H), 8.51(d, 1H), 8.63(d, 1H), 11.58(br s, 1H)	375.4
432	2-(3-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		12.08(s, 1H), 9.75(s, 1H), 8.72(d, 1H), 8.58(d, 1H), 8.00(m, 2H), 7.87(m, 2H), 7.61(m, 1H), 7.25(d, 1H), 4.75(q, 2H), 3.90(s, 3H), 1.48(t, 3H)	389.4
433	2-(3-methoxy-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.91(s, 1H), 9.30(s, 1H), 8.67(d, 1H), 8.58(d, 1H), 8.05(m, 2H), 7.91(d, 1H), 7.82(d, 1H), 7.57(m, 1H), 7.20(m, 1H), 3.91(s, 3H), 2.74(s, 3H)	359.4
434	2-pyridin-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.42(s, 1H), 9.35(s, 1H), 8.83(s, 1H), 8.60(d, 1H), 8.49(d, 1H), 8.32(m, 2H), 8.08(m, 1H), 7.89(m, 1H), 7.63(m, 1H), 7.41(d, 1H), 2.61(s, 3H)	330.4

【表 1 - 7 0】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
435	2-pyridin-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		11.80(s, 1H), 9.59(s, 1H), 8.65(d, 1H), 8.50(d, 1H), 8.23(m, 2H), 7.87(m, 1H), 7.43(d, 1H), 7.30(m, 1H), 7.18(d, 1H), 4.42(q, 2H), 1.46(t, 3H)	360.4
436	2-pyridin-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-pyridin-3-yl)-amide		11.95(s, 1H), 8.88(d, 1H), 8.81(s, 1H), 8.60(m, 1H), 8.50(m, 1H), 8.22(d, 1H), 8.07(m, 1H), 7.85(d, 1H), 7.62(m, 1H), 7.57(m, 1H)	350.8
437	2-pyridin-2-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.60(s, 1H), 9.05(s, 1H), 8.83(d, 1H), 8.62(m, 2H), 8.39(d, 1H), 8.08(m, 1H), 7.85(d, 1H), 7.66(m, 1H), 7.54(d, 1H), 2.58(s, 3H)	330.4
438	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		12.00(s, 1H), 9.73(s, 1H), 9.56(d, 1H), 8.82(dd, 1H), 8.68(m, 2H), 8.62(d, 1H), 7.90(d, 1H), 7.83(d, 1H), 7.72(m, 1H), 4.73(q, 2H), 1.45(t, 3H)	360.4
439	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(2-chloro-pyridin-3-yl)-amide		11.92(s, 1H), 9.52(s, 1H), 8.92(d, 1H), 8.76(d, 1H), 8.61(m, 2H), 8.23(d, 1H), 7.90(d, 1H), 7.71(m, 1H), 7.57(m, 1H)	350.8
440	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-chloro-pyridin-3-yl)-amide		11.60(s, 1H), 9.55(s, 1H), 8.93(d, 1H), 8.75(m, 2H), 8.59(d, 1H), 8.38(dd, 1H), 7.82(d, 1H), 7.70(m, 1H), 7.60(d, 1H)	350.8

【表 1 - 7 1】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
441	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.61(s, 1H), 9.56(s, 1H), 9.52(s, 1H), 8.81(d, 1H), 8.68(m, 2H), 8.54(d, 1H), 7.93(d, 1H), 7.81(d, 1H), 7.70(m, 1H), 2.76(s, 3H)	330.4
442	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.66(s, 1H), 9.59(s, 1H), 9.19(s, 1H), 8.79(m, 2H), 8.60(d, 1H), 8.55(m, 1H), 7.86(d, 1H), 7.70(m, 2H), 2.64(s, 3H)	330.4
443	2-pyridin-3-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methoxy-4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		10.87(s, 1H), 9.50(s, 1H), 8.79(d, 1H), 8.68(d, 1H), 8.59(d, 1H), 8.38(s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.65(m, 1H), 6.41(s, 1H), 3.46(s, 3H), 2.36(s, 3H)	360.4
444	2-pyridin-4-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.57(s, 3H), 7.39(d, 1H), 7.91(s, 1H), 8.23(s, 2H), 8.30(d, 1H), 8.34(d, 2H), 8.64(d, 1H), 9.32(s, 1H), 11.28(s, 1H)	330.4
445	2-pyridin-4-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		1.37(t, 3H), 4.42(q, 2H), 7.26(d, 1H), 7.89(d, 1H), 8.25(d, 2H), 8.28(d, 1H), 8.62(d, 1H), 8.86(d, 2H), 8.55(d, 1H), 11.62(d, 1H)	360.4
446	2-pyridin-4-yl-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		3.29(s, 3H), 7.30(d, 1H), 7.83(d, 1H), 8.21(d, 1H), 8.29(d, 2H), 8.61(d, 1H), 8.84(d, 2H), 8.91(d, 1H), 11.50(br s, 1H)	330.4

【表 1 - 7 2】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
447	2-(3-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		1.37(t, 3H), 4.45(q, 2H), 7.26(d, 1H), 7.68(d, 2H), 7.87(d, 1H), 8.31(t, 2H), 8.40(s, 1H), 8.57(d, 1H), 9.56(s, 1H), 11.62(s, 1H)	393.8
448	2-(3-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		2.58(s, 3H), 7.39(d, 1H), 7.66(s, 2H), 7.87(d, 1H), 8.28(d, 2H), 8.39(s, 1H), 8.56(q, 1H), 9.37(s, 1H), 11.31(s, 1H)	363.8
449	2-(3-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		0.96(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.13(s, 3H), 1.17-2.02(m, 1H), 1.41-1.63(m, 3H), 1.78-2.02(m, 3H), 4.48-4.54(m, 1H), 7.67(m, 3H), 7.83(d, 1H), 8.40(m, 3H), 8.59(d, 1H), 9.11(s, 1H), 11.60(s, 1H)	408.9
450	2-(3-chloro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.60(s, 1H), 9.11(s, 1H), 8.59(d, 1H), 8.40(m, 3H), 7.83(d, 1H), 7.67(m, 3H), 2.62(s, 3H)	363.8
451	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.44(br, 1H), 9.43(br, 1H), 8.62(d, 1H), 8.41(br, 1H), 8.20(m, 2H), 7.90(m, 1H), 7.80~7.38(m, 4H), 2.66(s, 1H)	347.4

【0093】

【表 1 - 7 3】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
452	6-bromo-2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-methyl-pyridin-3-yl)-amide		10.54(br, 1H), 8.69~8.59(m, 1H), 8.36(d, 1H), 8.14~8.03(m, 3H), 7.67(m, 1H), 7.47~7.37(m, 3H)	426.3
453	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid (1,7,7-trimethyl-bicyclo[2.2.1]heptin-2-yl)-amide		0.96(s, 3H), 0.99(s, 3H), 1.13(s, 3H), 1.17~2.02(m, 1H), 1.41~1.63(m, 3H), 1.78~2.02(m, 3H), 4.48~4.54(m, 1H), 7.767(m, 3H), 7.83(d, 1H), 8.50(m, 3H), 8.39(d, 1H), 9.71(s, 1H), 11.20(s, 1H)	392.5
454	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		11.63(s, 1H), 9.15(s, 1H), 8.60(d, 1H), 8.51(d, 1H), 8.29(m, 2H), 7.84(d, 1H), 7.70(m, 2H), 7.47(m, 1H), 2.63(s, 3H)	347.4
455	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-pyridin-3-yl)-amide		11.93(s, 1H), 9.71(s, 1H), 8.64(m, 2H), 8.20(m, 2H), 7.90(d, 1H), 7.75(m, 2H), 7.51(m, 1H), 4.68(q, 2H), 1.47(t, 3H)	377.4
456	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethylsulfanyl-pyridin-3-yl)-amide		11.49(s, 1H), 9.33(s, 1H), 8.59(d, 1H), 8.38(d, 1H), 8.32(d, 2H), 7.88(d, 1H), 7.68(m, 2H), 7.45(m, 1H), 3.30(q, 2H), 1.40(t, 3H)	393.4

【 0 0 9 4 】

【表 1 - 7 4】

Ex.	Compound	Structure	¹ H-NMR	MW
457	6-bromo-2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		9.23(s, 1H), 8.58(s, 1H) 8.06!7.97(m, 2H), 7.60(m, 1H), 7.33(m, 1H), 7.06(s, 1H), 4.30(m, 2H), 2.53(s, 3H), 1.43(t, 3H)	470.3
458	2-(3-fluoro-phenyl)-3H-imidazo[4,5-b]pyridine-7-carboxylic acid(4-ethoxy-6-methyl-pyridin-3-yl)-amide		9.49(br, 1H), 8.52(s, 1H), 8.10(m, 2H), 7.92(m, 1H), 7.63(m, 1H), 7.34(m, 1H), 7.14(br, 1H), 4.48(m, 2H), 2.64(s, 3H), 1.29(t, 3H)	391.4

10

20

【0095】

本発明による化学式1の化合物は、無機、または、有機酸、もしくは、塩基から誘導された、薬学的に許容可能な塩の形態で用いることができ、この場合、前記無機、または、有機酸から誘導された、薬学的に許容可能な塩として特に制限はないが、例えば、前記化学式1の化合物に当該分野で公知の塩酸、臭化水素酸、リン酸、硫酸のような無機酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、クエン酸、ギ酸、マレイン酸、シュウ酸、琥珀酸、安息香酸、酒石酸、フマル酸、マンデル酸、アスコルビン酸、または、リンゴ酸、等の有機カルボン酸、メタンスルホン酸、または、パラトルエンスルホン酸等を与えて得た塩を用いることができる。これら酸付加塩は通常の方法により製造することができ、それ自体では薬剤学的には許容できないその他の酸、例えば、シュウ酸等も本発明による化合物の薬剤学的に許容された酸付加塩を製造することに用いられうる。

30

また、前記化学式1の化合物は、その誘導体または、プロドラッグの形態で用いることができ、この場合、誘導体または、プロドラッグとして特に制限はないが、生理的に加水分解可能なエステルもしくはアミドとして、例えば、インダニル、フタリジル、メトキシメチル、ピバロイルオキシメチル、グリシルオキシメチル、フェニルグリシルオキシメチル、および、5-メチル-2-オキソ-1,3-ジオキサレン-4-イルメチル等が用いられうる。

【0096】

本発明による前記化学式1の化合物の調製方法は、

1) 下記化学式2の化合物を触媒の存在下で水素添加反応させて、下記化学式3の化合物を製造する段階；

2) 化学式3の化合物とR₁-(CO₂H) または、 R₁-(CHO)の混合物を有機酸の存在下で加熱還流するか、ニトロベンゼン下でマイクロウェーブを用いて混合物を加熱し、下記化学式4の化合物を製造する段階；

3) 化学式4の化合物を、アルカリ水酸化物または、有機溶媒中で酸化剤と反応させ、得た混合物を水の中に入れ冷却した後、SOCl₂または、H₂SO₄を加えて得られた混合物を加熱還流して下記化学式5の化合物を製造する段階；

4) 化学式5の化合物を、溶媒中でLiOH・H₂Oとともに加熱還流し、それに酸を添加して下記化学式6の化合物を製造する段階；および、

5) 化学式6の化合物を有機溶媒中でカップリング剤の存在下でR₂R₃NHと反応させ、化

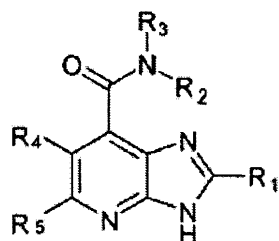
40

50

学式 1 の化合物を得る段階を含む：

【 0 0 9 7 】

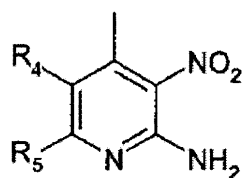
【 化 1 】



10

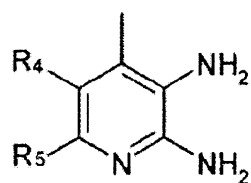
【 0 0 9 8 】

【 化 2 】



【 0 0 9 9 】

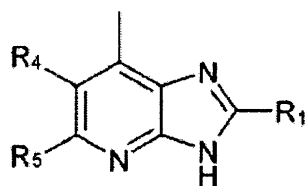
【 化 3 】



20

【 0 1 0 0 】

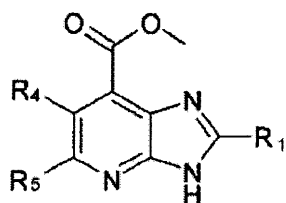
【 化 4 】



30

【 0 1 0 1 】

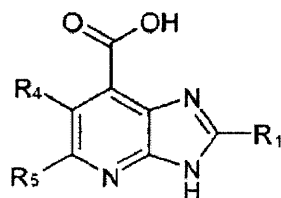
【 化 5 】



40

【 0 1 0 2 】

【化 6】



【0103】

前記化学式の中で、 R_1 乃至 R_5 は、前記化学式 1 で定義したものと同様である。

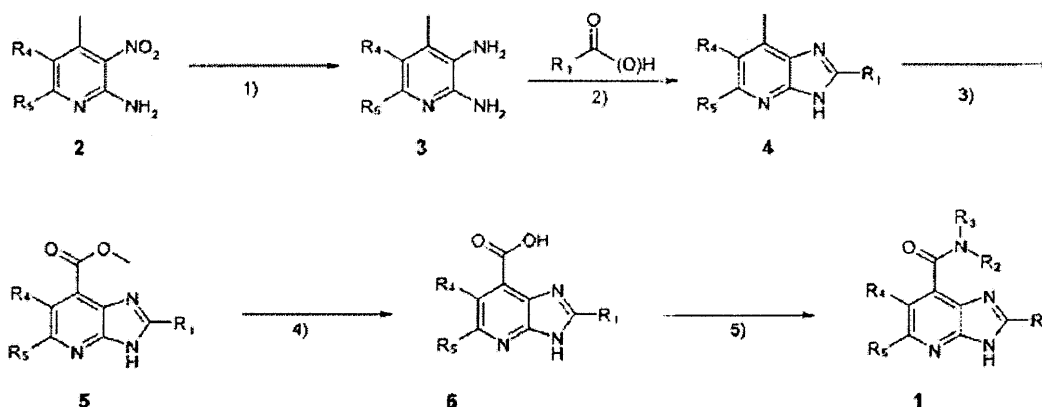
10

【0104】

本発明の化学式 1 の製造方法は、下記化学式 7 で示すことができる。

【0105】

【化 7】



20

【0106】

前記化学式 7 において、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、および、 R_5 は、前記で定義したものと同様である。

30

【0107】

前記化学式 7 に示したように、段階 1) では、化学式 2 の化合物を有機溶媒中で 5 % 乃至 10 % Pd/C または、 PtO_2 等の触媒の存在下で、水素反応器にて水素添加反応させて、得た混合物をろ過して減圧濃縮し、化学式 3 の化合物を得る。出発物質として用いられる化学式 2 の化合物は、通常の方法(文献「TANGA, M.J 等 J Heterocycl Chem 2003, 40 (4), 569-573」を参照)で製造するか、市販されているものを用いることができる。用いられうる有機溶媒は、メタノール、エタノール、メチレンクロライド等で、反応は、常温で行うことができる。

【0108】

段階 2) では、化学式 3 の化合物を有機酸の存在下で、化学式 3 の化合物対比 1 乃至 2 当量の $R_1-(CO_2H)$ または、 $R_1-(CHO)$ と $180^\circ C \sim 200^\circ C$ で 4 ~ 6 時間加熱還流するか、ニトロベンゼン下でマイクロウェーブを用いて、 $200 \sim 300 W$ 、 $180^\circ C \sim 200^\circ C$ で 20 分 ~ 40 分間、混合物を反応させる。その後、得た混合物を NaOH(aq) で中和して、抽出および、ろ過して溶媒を除いた後、濃縮液をフラッシュカラムクロマトグラフィで精製し、化学式 4 の化合物を得る。この場合、有機酸は、 $POCl_3$ または、リン酸 (PPA) 等が用いられうる。

40

【0109】

段階 3) では、化学式 4 の化合物を、アルカリ水酸化物または、有機溶媒中で酸化剤と反応させ、得た混合物を氷の中に入れ冷却した後、 $SOCl_2$ または、 H_2SO_4 を加えて、メタノール中で混合物を加熱還流して化学式 5 の化合物を得る。この場合、アルカリ水酸化物とし

50

て、NaOH、NaHCO₃または、Na₂CO₃等があり、有機溶媒としては、ピリジンまたは、t-BuOH等が用いられうる。また、酸化剤としては、KMnO₄、MnO₂または、SeO₂等があり、化学式4の化合物対比1乃至2当量を用いることが好ましい。また、SOCl₂または、H₂SO₄は、化学式4の化合物対比0.1乃至4当量を用いることが好ましい。

【0110】

段階4)では、化学式5の化合物を、水、MeOHおよび、THFの混合溶媒中で、好ましくは、化学式5の化合物対比2乃至3当量のLiOH・H₂Oとともに80℃で加熱還流した後、得られた混合物を好ましくは、化学式5の化合物対比1乃至3当量のHClで処理して化学式6の化合物を得る。なお、水、MeOHおよび、THFの重量比は、1:0.5~2:1~5で、好ましくは、約1:1:3である。

10

【0111】

段階5)では、化学式6の化合物を、有機溶媒中でカップリング剤の存在下でR₂R₃NHと反応させ、化学式1の化合物を得る。ここで、有機溶媒としては、ジメチルフォルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)、メチレンクロライド(MC)等を用いることができる。また、カップリング剤としては、1-ヒドロキシベンゾトリアゾール(HOBT)/1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミドHCl塩(EDC)/トリエチルアミン(Et₃N)、(ベンゾトリアゾール-1-イル-オキシ)トリピロリジノホスホニウムヘキサフルオロホスフェート(pyBop)、0-ベンゾトリアゾール-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムヘキサフルオロホスフェート(HBTU)また0-(ベンゾトリアゾール-1-イル)-N,N,N',N'-テトラメチルウロニウムテトラフルオロボレート(TBTU)等があり、カップリング剤およびR₂R₃NHは、それぞれ化学式5の化合物対比2乃至3当量で用いられうる。

20

【0112】

本発明の製造方法において、出発物質として用いられる化学式2の化合物は、商業的に市販されているものを用いることができる。

【0113】

本発明によると、前記化学式1のイミダゾピリジン係化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を有効成分として含むたんぱく質キナーゼ阻害用組成物を提供する。

【0114】

ここで、たんぱく質キナーゼとしては、グリコーゲン合成酵素キナーゼ-3(GSK-3)、オーロラキナーゼ、細胞外信号調節キナーゼ(ERK)、たんぱく質キナーゼB(AKT)、サクリン依存キナーゼ(CDK)、p38(protein38)ミトゲン活性たんぱく質キナーゼ(MAPK)、キナーゼドメイン領域キナーゼ(KDR)、または、血管内皮成長因子収容体-2(VEGFR-2)、c-ジュン-Nターミナルキナーゼ(JNK)、及び、ピルベートデハイドロゲナーゼキナーゼ(PDK)等が含まれる。本発明の化合物は、このような、たんぱく質キナーゼに対して3nM~50,000nMのIC₅₀の値を示している。

30

【0115】

さらに、本発明による前記化学式1のイミダゾピリジン化合物、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を有効成分として含む薬学組成物は、オーロラキナーゼ等の様々なたんぱく質キナーゼの活性を効果的に阻害し、これらを介した信号伝達を調節するため、糖尿病、肥満、認知症、がん、炎症疾患の治療および予防用薬学組成物として用いられうる。よって、本発明では、前記化学式1のイミダゾピリジン誘導体、または、その薬学的に許容可能な塩、水化物、溶媒化物、または、異性体を有効成分として含む薬学組成物を提供する。

40

【0116】

前記化学式1の化合物の塩、水化物、溶媒化物、または、異性体は、通常の方法を用いて化学式1の化合物から製造し用いることができる。

【0117】

本発明の薬学組成物は、様々な経口、または、非経口投与形態で剤形化できる。経口投

50

与用の剤形としては、例えば、錠剤、丸剤、硬・軟質カプセル剤、液剤、懸濁剤、乳化剤、シロップ剤、および、顆粒剤等があるが、これら剤形は、有効成分の他、希釈剤(例：ラクトース、デキストロース、スクロース、マンニトール、ソルビトール、セルロース、および/また、グリシン)、活沢剤(例：シリカ、タルク、ステアル酸、およびそのマグネシウムまたは、カルシウムおよび/また、ポリエチレングリコール)を含むことができる。また、錠剤として剤形化する場合には、マグネシウムアルミウムシリケート、でん粉ペースト、ゼラチン、トラガカンス(tragacanth)、メチルセルロース、ナトリウムカルボキシメチルセルロースおよび/また、ポリビニルピロリジンのような結合剤を含むことができ、場合によって、でん粉、寒天、アルギン酸、または、そのナトリウム塩のような崩壊剤、または、沸騰混合物および/また、吸収剤、着色剤、香味剤、甘味剤をさらに含むことができる。

10

【0118】

また、本発明の薬学組成物が非経口投与用として剤形化する場合には、例えば、等張性水溶液または、懸濁液等をさらに含む注射剤として剤形化することが好ましい。

【0119】

本発明の薬学組成物は、滅菌され/されるか、防腐剤、安定化剤、水化剤、または、乳化促進剤、浸透圧調節のための塩および/また、緩衝剤等の補助剤および、その他治療的に有用な物質をさらに含むことができ、通常の混合、顆粒化、または、コーティング方法により製剤化できる。

【0120】

20

本発明の薬学組成物に有効成分として含まれる化学式1の化合物は、人間を含む哺乳類に対して1日2.5～100mg/kg体重、好ましくは、5～60mg/kg体重の量で1日1回または、分割して経口、または、非経口経路を通して投与できる。しかし、有効成分の実際の投与量は、投与経路、患者の年齢および体重、並び疾患の重症度等の様々な関連因子に合せて決められるべきのものとして理解されなければならない、よって、前記投与量はどうのような面から見ても、決して本発明の範囲を限定することではない。

【0121】

以下、本発明を実施例に基いてより具体的に説明する。但し、これら実施例は、本発明の例示に過ぎないだけで、本発明はこれらに限定されるものではない。

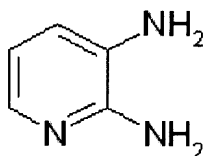
【0122】

30

実施例1：2-フェニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノフェニル)-エチル]-アミドの製造
(段階1) 4-メチルピリジン-2,3-ジアミン(化学式8)の合成

【0123】

【化8】



40

【0124】

4-メチル-3-ニトロピリジン-2-アミン(25g, 163.4mmol)を、MeOH(100mL)に溶かして、5%Pd/Cを所定の触媒量で入れた後、混合物を2時間反応させた。反応溶液を、セライトパッド(celite pad)を用いてろ過した後、パッドをMeOHで十分に洗い混合物を減圧し蒸留させた。反応化合物を真空乾燥させ92%の収率で、表題化合物(18.49g, 150.33mmol)を得た。

【0125】

¹H-NMR (CDCl₃): 2.17 (s, 3H), 3.27 (br, 2H), 4.14 (br, 2H), 6.54 (d, 2H), 7.55 (d, 2H)

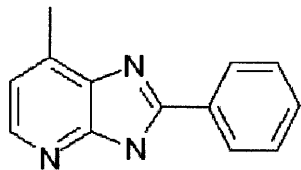
分子量：124

50

(段階 2) 7-メチル-2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン (化学式 9) の合成

【0126】

【化 9】



【0127】

10

前記段階 1 で得た化合物 (5g、40.65mmol)、安息香酸 (4.96g、40.65mmol) および、 POCl_3 20mL を混合して、該混合物を $170^\circ\text{C} \sim 180^\circ\text{C}$ で約 4 時間加熱還流させた。反応混合物を減圧し蒸留させ POCl_3 を除去してから $\text{NaOH}(\text{aq})$ で中和し酢酸エチルを用い抽出した。得られた抽出物を塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧し蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ (ヘキサン：酢酸エチル = 1 : 1) で精製し、60% の収率で表題化合物 (5.09g, 24.39mmol) を得た。

【0128】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 2.78 (s, 3H), 7.09 (d, 1H), 7.54 (m, 3H), 8.30 (m, 3H)

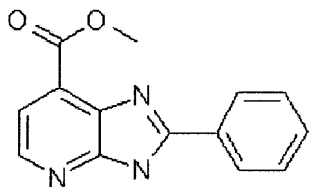
分子量：210

(段階 3) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸メチルエステル (化学式 10) の合成

20

【0129】

【化 10】



30

【0130】

前記段階 2 で得た化合物 (200g、0.96mmol) と NaOH (76.80mg、1.92mmol) を入れた後、水 (20mL) を加えて混合物を 60°C で加熱した。水 (3mL) に KMnO_4 (311mg、1.92mmol) を溶かしゆっくり加熱し、得た混合物を約 100°C で 6 時間攪拌した。反応混合物を熱いままセライトパッドを用いてろ過してパッドを熱い水で充分洗った後、溶媒を減圧し蒸留させ除去して、真空乾燥した。得た混合物を MeOH (20mL) に溶かした後、氷の中に入れ 0°C に冷却した。これに、 SOCl_2 (7μl 10eq) をゆっくり加えた後、4 時間還流攪拌した。得た混合物を $\text{NaOH}(\text{aq})$ で中和して溶媒を減圧し蒸留させ除去した後、酢酸エチル (EA) で抽出して塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧し蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ (ヘキサン：EA = 1 : 1) で精製し、45% の収率で表題化合物 (109mg, 0.43mmol) を得た。

40

【0131】

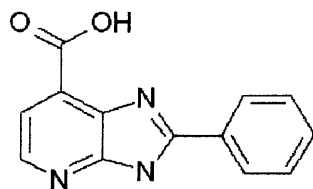
$^1\text{H-NMR}$ (MeOH-d_4): 4.10 (s, 3H), 7.64 (m, 3H), 7.89 (d, 1H), 8.25 (m, 2H), 8.61 (d, 2H)

分子量：254

(段階 4) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸 (化学式 11) の合成

【0132】

【化 1 1】



【0 1 3 3】

前記段階 3 で得た化合物 (30mg、0.12mmol) を THF (10ml)、水 (3mL) および、MeOH (3mL) の混合物に溶かし攪拌した。LiOH・H₂O (14mg、0.33mmol) を加えた後、約 8 時間加熱還流した。その後、4M HCl 酸 (0.66mmol、165 μ l) を常温で添加して反応の完結を確認し減圧し蒸留させてから真空乾燥して、85% の収率で表題化合物 (25.8mg、0.10mmol) を得た。

【0 1 3 4】

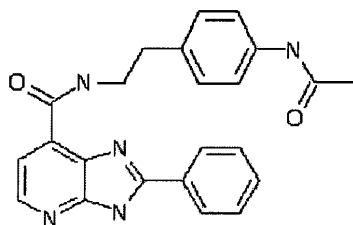
¹H-NMR (MeOH-d₄): 7.79~7.67 (m, 3H), 8.14 (d, 1H), 8.28 (m, 2H), 8.78 (d, 1H)

分子量: 254

(段階 5) 2-フェニル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸 [2-(4-アセチルアミノ-フェニル)-エチル]-アミド (化学式 12) の合成

【0 1 3 5】

【化 1 2】



【0 1 3 6】

前記段階 4 で得た化合物を DMF 3 ml に溶かし攪拌しながら EDC および HOBt をそれぞれ 2 eq ずつ入れて DMF に溶かした後、4-アセチルペンチルアミン (1.2eq) を入れて、室温で 12~24 時間攪拌した。反応の完結を確認してから、溶媒を真空乾燥して残った余液を少しの MeOH に溶かしろ過し Prep. HPLC で精製して表題化合物を 60% の収率で得た。

実施例 2 乃至 3 1

前記実施例 1 の段階 5 において、4-アセチルペンチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記前記実施例 1 と同様の工程を行った。

実施例 3 2 乃至 4 2

前記実施例 1 の段階 2 において、安息香酸の代わりに 2,4-ジクロロ安息香酸 (7.76g, 40.65mmol) を使い、また、段階 5 において、4-アセチルペンチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記前記実施例 1 と同様の工程を行った。

実施例 4 3: 2-(クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸 [2-(4-エタンスルホニルアミノ)-エチル]-アミドの製造

(段階 1) 2-(クロロフェニル)-7-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの合成

前記実施例 1 の段階 1 で得た化合物 (0.75g、6.14mmol)、4-クロロ安息香酸 (1.153g、7.37mmol) および、PPA (10g) を混合して、該混合物を 150℃~160℃ で約 24 時間攪拌した。反応混合物を室温に下げながら水 (20ml) をゆっくり加えた後、飽和 NaOH (aq) を利用しアイスバス (ice bath) で中性化した。生成された固形化合物をろ過し、減圧乾燥して 83% の収率で表題化合物 (1.24g、5.10mmol) を未精製状で得た。

【0 1 3 7】

10

20

30

40

50

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 2.69 (s, 3H), 7.12 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 8.16 (d, 2H), 8.21 (m, 1H)

分子量: 244

(段階2) メチル 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボキシレートの合成

前記実施例1の段階1で得た化合物(0.138g、0.67mmol)をt-BuOH (3ml)に溶かし撹拌した。 KMnO_4 (450mg、2.85mmol)を H_2O (4ml)に熱を加えながら溶かしたものを、3回に分けて熱い状態で前記化合物に加えた。反応混合物を約60~80℃で24時間撹拌した。反応混合物を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し熱い水で充分洗った。溶媒を減圧蒸留し除去して真空乾燥する。得た残渣をMeOH(5ml)に溶かしながら撹拌した。これにSOC l_2 (7~10eq)をゆっくり加えた後、4時間還流撹拌した。得た化合物を減圧蒸留し溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出して塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA = 1:1)で精製し、23%の収率で表題化合物(45mg、0.16mmol)を得た。

10

【0138】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 4.09 (s, 3H), 7.41 (d, 1H), 7.52 (d, 2H), 7.97 (d, 2H), 8.12 (d, 1H), 10.43 (br, 1H)

分子量: 289

(段階3) 2-(4-クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

20

前記段階2で得た化合物(45mg、0.16mmol)をTHF (2ml)に溶かし撹拌した。これに、水(1ml)に溶かした $\text{LiOH} \cdot \text{H}_2\text{O}$ (20mg、0.48mmol)を加えた後、室温で約8時間撹拌した。反応混合物を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(PH=2)する。得た溶液を減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣を真空乾燥し102%の収率で表題化合物(45mg、0.16mmol)を未精製状で得た。

【0139】

$^1\text{H-NMR}$ (MeOH-d_4): 7.32 (d, 2H), 7.56 (d, 1H), 7.90 (d, 2H), 8.39 (d, 1H)

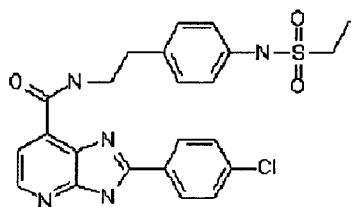
分子量: 275

(段階4) 2-(クロロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノ)-エチル]-アミド(化学式13)の合成

30

【0140】

【化13】



【0141】

40

前記段階3で得た化合物をDMFに溶かし撹拌しながらベンゾトリアゾール-1-イル-オキシ)トリピロリジノホスホニウム(PyBop) (1.2eq)とTEA (3eq)およびエタンスルホン酸[4-(2-アミノエチル)-フェニル]-アミド(1.2eq)を入れて室温で12時間撹拌した。反応混合物を真空乾燥し、得た残渣を少々MeOHに溶かしてからろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物65%の収率で得た。

【0142】

実施例44乃至61

前記実施例43の段階4において、エタンスルホン酸[4-(2-アミノエチル)-フェニル]-アミドの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例43と同様の工程を行った。

50

実施例 6 2

(段階 1) 2-(フラン-2-イル)-7-メチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンの合成

前記実施例 1 の段階 1 で得た化合物 (1 g、8.15mmol) と、フラン-2-カルボキシアルデヒド (783mg、8.15mmol) をニトロベンゼン (3ml) に溶かした後、混合物を 180℃ で 300W のパワーで 15 分間反応させた。反応溶液を、フラッシュカラムクロマトグラフィ (ヘキサン:EA=1:1) で精製し、45% の収率で表題化合物 (730mg、3.67mmol) を得た。

【0143】

¹H-NMR (CDCl₃): 2.69 (s, 3H), 7.12 (d, 1H), 7.57 (d, 2H), 8.16 (d, 2H), 8.21 (m, 1H)

10

分子量: 200

(段階 2) メチル 2-(フラン-2-イル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン 7-カルボキシレート-の合成

前記段階 1 で得た化合物 (0.469g、2.35mmol) を、ピリジン (5ml) に溶かし攪拌した。これに、SeO₂ (1.303g、11.75mmol) を加えて、その反応混合物を、約 120℃ で 24 時間還流攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し、パッドを熱い水と MeOH で充分洗った。混合物を減圧濃縮し溶媒を除去してから真空乾燥する。得た残渣を MeOH (5ml) に溶かしながら攪拌した。これに SOCl₂ (7~10eq) をゆっくり加えた後、4 時間還流攪拌した。得た化合物を減圧蒸留し溶媒を除去した後、酢酸エチル (EA) で抽出した。得た抽出物を塩水で洗い MgSO₄ で乾燥した後、ろ過して減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ (ヘキサン:EA=1:1) で精製し、33% の収率で表題化合物 (188mg、0.776mmol) を得た。

20

【0144】

¹H-NMR (CDCl₃): 4.08 (s, 3H), 6.74 (d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 8.51 (d, 1H)

分子量: 244

(段階 3) 2-(フラン-2-イル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン 7-カルボキシレート-の合成

前記段階 2 で得た化合物 (140mg、0.58mmol) を、THF (2ml) に溶かし攪拌した。これに、水 (1ml) に溶かした LiOH·H₂O (73mg、1.74mmol) を加えた後、室温で約 8 時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを 1N HCl (aq) を用いて酸性化 (pH=2) する。得た溶液を、減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣を真空乾燥し、83% の収率で表題化合物 (109mg、0.48mmol) を未精製状で得た。

30

【0145】

¹H-NMR (MeOH-d₄): 6.71 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.39 (d, 1H)

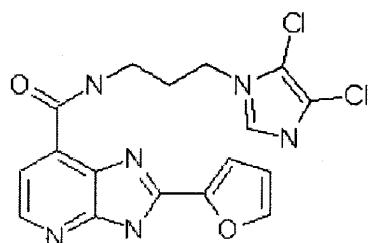
分子量: 230

(段階 4) 2-フラン-2-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン 7-カルボン酸 [3-(4, 5-ジクロロ-3H-イミダゾール-1-イル)-プロピル]-アミド (化学式 14) の合成

40

【0146】

【化 14】



50

【0147】

前記段階3で得た化合物を、DMFに溶かし攪拌し、これにPyBop(1.2eq)とTEA (3eq)および3-(2,4-ジクロロイミダゾールイル)プロピルアミン(1.2eq)を入れて、その混合物を室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、得た残渣を少々MeOHに溶かししてろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物45%の収率で得た。

【0148】

実施例63乃至85

前記実施例62の段階4において、3-(2,4-ジクロロイミダゾールイル)プロピルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例62と同様の工程を行った。

10

【0149】

実施例86

(段階1) 7-メチル-2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの合成

実施例1の段階1で得た化合物(1g、8.15mmol)と、チオフエン-2-カルボキシアルデヒド(912mg、8.15mmol)を、ニトロベンゼン(3ml)に溶かした後、混合物を180℃で300Wのパワーで15分間反応させた。反応溶液を、フラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、50%の収率で表題化合物(877mg、4.08mmol)を得た。

20

【0150】

¹H-NMR (CDCl₃): 2.17 (s, 3H), 7.36 (t, 1H), 8.00 (m, 2H), 8.48 (d, 1H), 8.82 (d, 1H)

分子量: 216

(段階2) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸メチルエステルの合成

前記段階1で得た化合物(500mg、2.33mmol)をピリジン(5ml)に溶かし攪拌した。これに、SeO₂(1.04g、9.32mmol)を加えて、その反応混合物を、約120℃で24時間還流攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し、パッドを熱い水とMeOHで充分洗った。溶媒を減圧蒸留し除去してから真空乾燥する。その後、得た残渣をMeOH(10ml)に溶かしながら攪拌した。これにSOCl₂(7~10eq)をゆっくり加えた後、4時間還流攪拌した。得た化合物を減圧蒸留し溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出した。得た抽出物を塩水で洗いMgSO₄で乾燥した後、ろ過して減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、27%の収率で表題化合物(163mg、0.63mmol)を得た。

30

【0151】

¹H-NMR (CDCl₃): 4.08 (s, 3H), 6.74(d, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 7.87 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)

分子量: 260

(段階3) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

40

前記段階2で得た化合物(163mg、0.63mmol)を、THF(2ml)に溶かし攪拌した。これに、水(1ml)に溶かしたLiOH・H₂O (126mg、2.52mmol)を加えた後、混合物を室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(pH=2)する。余液を減圧蒸留させた後、真空乾燥し除去した後、67%の収率で表題化合物(103mg、0.42mmol)を未精製状で得た。

【0152】

¹H-NMR (MeOH-d₄): 6.71 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.39 (d, 1H)

分子量: 246

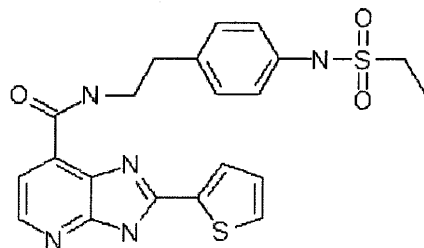
(段階4) 2-チオフエン-2-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カ

50

ルボン酸[2-(4-エタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド(化学式15)

【0153】

【化15】



10

【0154】

前記段階3で得た化合物を、DMFに溶かし攪拌し、これにPyBop(1.2eq)とTEA(3eq)および4-エタンスルホニルアミノフェニルエチルアミン(1.2eq)を入れて、室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、残りの余液を少々MeOHに溶かしろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物55%の収率で得た。

【0155】

実施例87乃至113

前記実施例86の段階4において、4-エタンスルホニルアミノフェニルエチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例86と同様の工程を行った。

20

【0156】

実施例114

(段階1) 2-フラン-3-イル-7-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの合成

実施例1の段階1で得た化合物(500g、4.07mmol)と、フラン-3-カルボキシアルデヒド(391mg、4.07mmol)を、ニトロベンゼン(3ml)に溶かした後、混合物を180℃で300Wのパワーで15分間反応させた。反応溶液を、フラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、30%の収率で表題化合物(243mg、1.22mmol)を得た。

30

【0157】

¹H-NMR(CDCl₃): 2.88(s, 3H), 7.09(s, 1H), 7.17(d, 2H), 8.38(s, 1H), 8.44(d, 1H)

(段階2) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン-7-カルボン酸メチルエステルの合成

前期段階1で得た化合物(243mg、1.22mmol)をFMPピリジン(5ml)に溶かし攪拌した。これに、SeO₂(542mg、4.88mmol)を加えて、その反応混合物を、約120℃で24時間還流攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し、パッドを熱い水とMeOHで充分洗った。混合物を減圧蒸留し溶媒を除去して真空乾燥する。その後、得た残渣をMeOH(10ml)に溶かしながら攪拌した。これにSOCl₂(7~10eq)をゆっくり加えた後、4時間還流攪拌した。得た混合物を減圧蒸留し溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出した。得た抽出物を塩水で洗いMgSO₄で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、52%の収率で表題化合物(154mg、0.63mmol)を得た。

40

【0158】

¹H-NMR(CDCl₃): 4.13(s, 3H), 7.09(s, 1H), 7.17(d, 2H), 8.38(s, 1H), 8.44(d, 1H)

分子量: 244

(段階3) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

50

前記段階 2 で得た化合物(154mg、0.63mmol)を、THF(2ml)に溶かし攪拌した。これに、水(1ml)に溶かしたLiOH・H₂O (106mg、2.52mmol)を加えた後、混合物を室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(pH=2)する。得た溶液を減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣を真空乾燥し、76%の収率で表題化合物(109mg、0.48mmol)を未精製状で得た。

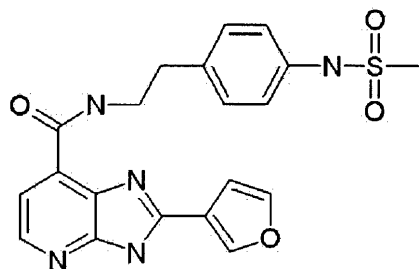
¹H-NMR (MeOH-d₄): 6.71 (d, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.67 (d, 1H), 7.83 (d, 1H), 8.39 (d, 1H)

分子量: 230

(段階 4) 2-フラン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド(化学式 16)の合成

【0159】

【化 16】



【0160】

前記段階 3 で得た化合物を、DMFに溶かし攪拌し、これにPyBop(1.2eq)とTEA (3eq)および4-メタンスルホニルアミノフェニルエチルアミン(1.2eq)を入れて、室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、得た残渣を少々MeOHに溶かしろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物45%の収率で得た。

【0161】

実施例 115 乃至 141

前記実施例 114 の段階 4 において、4-メタンスルホニルアミノフェニルエチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例 114 と同様の工程を行った。

実施例 142

(段階 1) 2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-7-メチル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンの合成

前記実施例 1 の段階 1 で得た化合物(0.75g、6.14mmol)、2, 4-ジフルオロ安息香酸(1.456g、9.21mmol) および、PPA(10g)を混合して、該混合物を150℃~160℃で約24時間攪拌した。反応溶液を室温に下げながら水(20ml)をゆっくり加えた後、飽和NaOH(aq)を利用しアイスバスで中性化した。生成された固形化合物をろ過し、減圧乾燥して13%の収率で表題化合物(200mg、0.816mmol)を未精製状で得た。

【0162】

¹H-NMR (CDCl₃): 2.68 (s, 3H), 7.14 (m, 3H), 8.16 (m, 1H), 8.25 (d, 1H)

分子量: 246

(段階 2) メチル 2-(2, 4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボキシレート

前記段階 1 で得た化合物(0.20g、0.82mmol)をt-BuOH (5ml)に溶かし攪拌した。KMnO₄ (648mg、4.1mmol)をH₂O(4ml)に熱を加えながら溶かした後、3回に分けて熱い状態で加えた。反応混合物を約60~80℃で24時間攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過しパッドを熱い水で充分洗った後、混合物を減圧濃縮し溶媒を除去して、真空乾燥する。得た残渣をMeOH(5ml)に溶かしながら攪拌した。これにSOCl₂(7~10eq)をゆっくり加えた後、4時間還流攪拌した。得た混合物を減圧濃縮し溶媒を除去した後、

10

20

30

40

50

酢酸エチル (EA) で抽出した。得た抽出物を塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ (ヘキサン : EA = 1 : 1) で精製し、21% の収率で表題化合物 (50mg、0.17mmol) を得た。

【0163】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 4.09 (s, 3H), 7.02 (m, 1H), 7.14 (m, 1H), 7.72 (d, 1H), 8.65 (m, 1H), 8.69 (d, 1H), 10.43 (br, 1H)

分子量 : 290

(段階3) 2-(2,4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

前記段階2で得た化合物 (50mg、0.17mmol) を THF (2ml) に溶かし攪拌した。これに、水 (1ml) に溶かした $\text{LiOH} \cdot \text{H}_2\text{O}$ (20mg、0.48mmol) を加えた後、室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを 1N HCl (aq) を用いて酸性化 (pH=2) する。余液を減圧蒸留させ真空乾燥し除去した後、150% の収率で表題化合物 (70mg、0.256mmol) を未精製状で得た。

【0164】

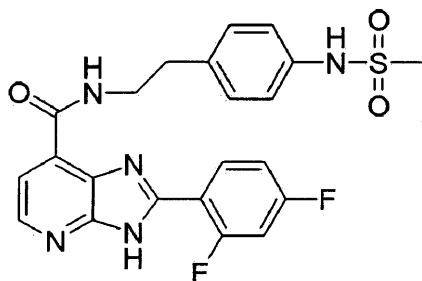
$^1\text{H-NMR}$ (MeOH-d_4): 7.23 (d, 2H), 7.79 (d, 1H), 8.38 (m, 2H), 8.48 (d, 1H)

分子量 : 275

(段階4) 2-(2,4-ジフルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸 [2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル] アミド (化学式17) の合成

【0165】

【化17】



【0166】

前記段階3で得た化合物を DMF に溶かし、これに PyBop (1.2eq) と TEA (3eq) および 4-メタンスルホニルアミノフェニルエチルアミン (1.2eq) を入れて、混合物を室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、残りの得た余液を少々 MeOH に溶かしてからろ過した。このようにして得た余液を Prep. HPLC で精製して表題化合物 45% の収率で得た。

【0167】

実施例143乃至144

前記実施例142の段階4において、メタンスルホニルアミノフェニルエチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例142と同様の工程を行った。

【0168】

実施例145

(段階1) 2-シクロプロピル-7-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの合成

実施例1の段階1で得た化合物 (500mg、40.08mmol)、シクロプロパンカルボン酸 (351mg、4.08mmol) および、 POCl_3 (25ml) を混合して、該混合物を $170^\circ\text{C} \sim 180^\circ\text{C}$ で約4時間加熱還流させた。反応溶液を減圧濃縮させ POCl_3 を除去してから NaOH (aq) で中和し、エチルアセタートを用い抽出した。得られた抽出物を塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧し蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ (

ヘキサン：酢酸エチル＝2：1)で精製し、60%の収率で表題化合物(423mg, 2.45mmol)を得た。

【0169】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 1.25 (m, 2H), 1.31 (m, 2H), 2.31 (m, 1H), 2.91 (t, 2H), 7.70 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)

分子量：174

(段階2) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸メチルエステルの合成

前記段階1で得た化合物(423mg, 2.45mmol)とNaOH(196mg, 4.9mmol)を混合し、これに水(20mL)を加えて混合物を60℃で加熱した。加熱しながら水(3mL)に溶かしたKMnO₄(774mg, 4.9mmol)を前記混合物に加えて、混合物を約100℃で6時間攪拌した。反応溶液を熱いままセライトパッドを用いてろ過してパッドを熱い水で充分洗った。混合物を減圧し蒸留させ溶媒を除去して、真空乾燥した。得た残渣をMeOH(20mL)に溶かした後、アイスバスで0℃に冷却した。これに、SOCl₂ (7~10eq)をゆっくり加えた後、混合物を4時間還流攪拌した。得た混合物をNaOH(aq)で中和して減圧し蒸留させ溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出して、塩水で洗いMgSO₄で乾燥した後、ろ過して、溶媒を減圧し蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン：EA＝2：1)で精製し、32%の収率で表題化合物(170mg, 0.78mmol)を得た。

【0170】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 1.25 (m, 2H), 1.31 (m, 2H), 2.31 (m, 1H), 2.91 (t, 2H), 3.80 (s, 3H), 7.70 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)

分子量：218

(段階3) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

前記段階2で得た化合物(170mg, 0.78mmol)をTHF(2mL)に溶かし攪拌した。これに、水(1mL)に溶かしたLiOH・H₂O(66mg, 1.56mmol)を加えた後、混合物を室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(pH=2)する。余液を減圧蒸留させ真空乾燥し除去した後、88%の収率で表題化合物(140mg, 0.69mmol)を未精製状で得た。

【0171】

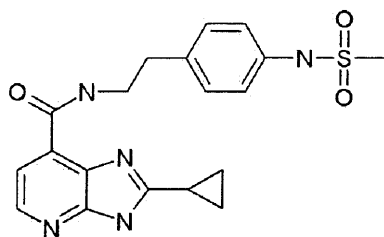
$^1\text{H-NMR}$ (MeOH-d_4): 1.25 (m, 2H), 1.31 (m, 2H), 2.31 (m, 1H), 7.70 (d, 1H), 8.41 (d, 1H)

分子量：204

(段階4) 2-シクロプロピル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-メタンスルホニルアミノフェニル)-エチル]-アミド(化学式18)の合成

【0172】

【化18】



【0173】

前記段階3で得た化合物をDMFに溶かし、これにPyBop(1.2eq)とTEA(3eq)および4-メタンスルホニルアミノフェニルエチルアミン(1.2eq)を入れて、混合物を室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、得た残渣を少々MeOHに溶かしてからろ過した。得た余

10

20

30

40

50

液をPrep. HPLCで精製して表題化合物 65%の収率で得た。

【0174】

実施例 146乃至150

前記実施例 145の段階4において、4-メタンスルホニルアミノフェンエチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例 145と同様の工程を行って、実施例 146乃至150の化合物を得た。

【0175】

実施例 151

(段階1) 7-メチル-2-チオフェン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジンの合成

実施例 1の段階1で得た4-メチルピリジン-2, 3-ジアミン(500g、4.08mmol)と、チオフェン-2-カルボキシアルデヒド(456mg、4.08mmol)を、ニトロベンゼン(2ml)に溶かした後、180℃で300Wのパワーで15分間反応させた。反応溶液を、フラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、60%の収率で表題化合物(526mg、2.45mmol)を得た。

【0176】

¹H-NMR (CDCl₃): 2.66 (s, 3H), 7.11 (t, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.29 (d, 1H)

分子量: 216

(段階2) 2-チオフェン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸メチルエステルの合成

前期段階1で得た化合物(526mg、2.45mmol)をピリジン(5ml)に溶かし攪拌した。これに、SeO₂(1.09mg、9.80mmol)を加えて、その反応混合物を、約120℃で24時間還流攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し、パッドを熱い水とMeOHで充分洗った。混合物を減圧濃縮し溶媒を除去して真空乾燥する。その後、得た残渣をMeOH(10ml)に溶かしながら攪拌した。これにSOCl₂(7~10eq)をゆっくり加えた後、還流攪拌した。反応混合物を減圧蒸留し溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出した。得た抽出物を塩水で洗いMgSO₄で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、41%の収率で表題化合物(260mg、1.01mmol)を得た。

¹H-NMR (CDCl₃): 4.18 (s, 3H), 7.11 (t, 1H), 7.64 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.29 (d, 1H)

分子量: 260

(段階3) 2-チオフェン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

前記段階2で得た化合物(260mg、1.01mmol)を、THF(2ml)に溶かし攪拌した。これに、水(1ml)に溶かしたLiOH・H₂O(196mg、4.04mmol)を加えた後、混合物を室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(pH=2)する。得た溶液を減圧蒸留させ溶媒を除去した。得た残渣を真空乾燥し、81%の収率で表題化合物(200mg、0.82mmol)を未精製状で得た。

【0177】

¹H-NMR (CDCl₃): 7.13 (t, 1H), 7.68 (d, 1H), 7.86 (d, 1H), 8.19 (s, 1H), 8.29 (d, 1H)

分子量: 246

(段階4) 2-チオフェン-3-イル-3H-イミダゾ[4, 5-b]ピリジン-7-カルボン酸[2-(3-ヒドロキシフェニル)-エチル]-アミド(化学式19)の合成

【0178】

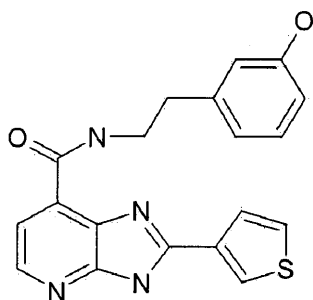
10

20

30

40

【化 19】



10

【0179】

前記段階3で得た化合物を、DMFに溶かし攪拌し、これにPyBop(1.2eq)とTEA (3eq)および2'-ヒドロキシペンチルアミン(1.2eq)を入れて、混合物を室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、残りの余液を少々MeOHに溶かしてろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物35%の収率で得た。

【0180】

実施例152乃至178および181乃至195

前記実施例151の段階4において、2'-ヒドロキシフェニルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例151と同様の工程を行った。

20

【0181】

実施例179乃至180

記実施例151の化合物(89.65mg、0.246mmol)にmCPBA(メタクロロパーベンゾイック酸)(2eq、85mg)を用いたことを除いて、前記実施例151と同様の工程を行った。

【0182】

実施例196

(段階1) 2-(4-フルオロフェニル)-7-メチル-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジンの合成

実施例1の段階1で得た化合物(1.25g、10.24mmol)、4-フルオロ安息香酸(1.721g、12.29mmol)およびPPA(50g)を混合して、該混合物を150℃~160℃で約24時間攪拌した。反応溶液を室温に下げ、水(20ml)をゆっくり加えた後、これを、飽和NaOH(aq)を利用しアイスバスで中性化した。生成された固形化合物をろ過し、減圧乾燥して52%の収率で表題化合物(1.21g、5.32mmol)を未精製状で得た。

30

【0183】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 2.67 (s, 3H), 7.11 (d, 1H), 7.28 (t, 2H), 8.21 (m, 3H)

分子量: 228

(段階2) メチル2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボキシレートの合成

前記段階1で得た化合物(0.1g、0.44mmol)をt-BuOH (3ml)に溶かし攪拌した。 KMnO_4 (139mg、0.88mmol)を H_2O (3ml)に熱を加えながら溶かした後、3回に分けて熱い状態で前記化合物に加えた。反応混合物を約60~80℃で24時間攪拌した。反応溶液を、熱い状態でセライトパッドを用いてろ過し、パッドを熱い水で充分洗った。混合物を減圧濃縮し溶媒を除去して、これを真空乾燥した。得た残渣をMeOH(6ml)に溶かしながら攪拌した。これに SOCl_2 (7~10eq)をゆっくり加えた後、4時間還流攪拌した。得た混合物を減圧蒸留させ溶媒を除去した後、酢酸エチル(EA)で抽出した。得た抽出物を塩水で洗い MgSO_4 で乾燥した後、ろ過して溶媒を減圧蒸留させ除去した。得た残渣をフラッシュカラムクロマトグラフィ(ヘキサン:EA=1:1)で精製し、42%の収率で表題化合物(50mg、0.19mmol)を得た。

40

【0184】

$^1\text{H-NMR}$ (CDCl_3): 4.09 (s, 3H), 7.23 (m, 2H), 7.67 (d, 1H), 8.20 (m, 2H), 8.66 (

50

d, 2H), 10.43 (br, 1H)

分子量：272

(段階3) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸の合成

前記段階2で得た化合物(30mg、0.11mmol)をTHF (2ml)に溶かし攪拌した。これに、水(1ml)に溶かしたLiOH・H₂O (13.86mg、0.33mmol)を加えた後、室温で約8時間攪拌した。反応溶液を酢酸エチルで抽出して、水の層を酢酸エチルで洗った後、これを1N HCl(aq)を用いて酸性化(pH=2)する。得た残渣を減圧蒸留させ、真空乾燥し除去した後、106%の収率で表題化合物(60mg、0.12mmol)を未精製状態で得た。

【0185】

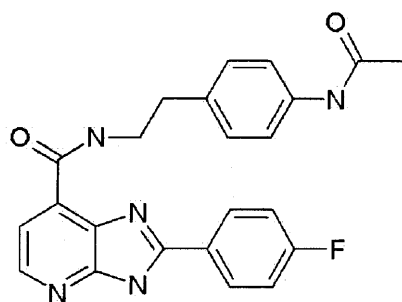
¹H-NMR (MeOH-d₄): 7.32 (dd, 2H), 7.68 (d, 1H), 8.30 (dd, 2H), 8.41 (d, 1H)

分子量：258

(段階4) 2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノフェニル)-エチル]-アミド(化学式20)の合成

【0186】

【化20】



【0187】

前記段階3で得た化合物をDMFに溶かし、これにPyBop(1.2eq)とTEA (3eq)および4-アセチルペンチルアミン(1.2eq)を入れて、混合物を室温で12時間攪拌した。反応溶液を真空乾燥し、得た残渣を少々MeOHに溶かしてからろ過した。このようにして得た余液をPrep. HPLCで精製して表題化合物50%の収率で得た。

【0188】

実施例197乃至326

前記実施例196の段階4において、4-アセチルペンチルアミンの代わりに各々相応するアミン化合物を用いたことを除いて、前記実施例196と同様の工程を行った。

【0189】

実施例327

実施例196で得た化合物(10mg、0.03mmol)を、2mlのDMSOとN-メチルピペラジン1:1溶液に希釈して添加した。反応溶液を200W、150℃、100psiの条件で1時間反応させた。これを、Prep. HPLCを用い分離精製して、30%の収率で表題化合物(3.72mg、0.009mmol)を得た。

【0190】

実施例328乃至458

前記実施例327の出発物質である2-(4-フルオロフェニル)-3H-イミダゾ[4,5-b]ピリジン7-カルボン酸[2-(4-アセチルアミノフェニル)-エチル]-アミド、および、N-メチルピペラジン出発物質の代わりに各々相応する物質を用いたことを除いて、前記実施例327と同様の工程を行った。

【0191】

<テスト1>たんぱく質キナーゼの酵素活性の阻害能分析

<グリコーゲン合成酵素キナーゼ3β(GSK3β)>

10

20

30

40

50

前記各実施例で製造された化合物のGSK-3 β 酵素活性の阻害能は、シュルツ(Shultz)等の方法(USP 6153618)を変形して分析し、テストに用いられたGSK-3 β は、遺伝子組み換え方法により大腸菌から製造した。

【0192】

まず、ヒトGSK-3 β をコードするポリヌクレオチドの5'末端及び3'末端に対応するプライマーを設計し、ヒトGSK-3 β (GenBank Reg. No.L33801)のヌクレオチド塩基配列から合成した。次に、プライマーを、ヒトのDNA配列を鋳型とするポリメラーゼ連鎖反応(PCR: polymerase chain reaction)によって増幅させた。プライマーのPCR工程は、制限酵素BamHI/XhoIで処理した。

【0193】

次に、上記処理で得られた遺伝子フラグメントを、pGex ベクトル(GE Healthcare Life Science)の同一制限酵素切断部位に挿入して発現ベクトルを製造した後、これを大腸菌B L21 (DE3)株(Invitrogen)に形質転換した。形質転換された大腸菌株を、100 μ g/mlのアンピシリンが含まれたルリア培地(LB; 1%バクトトリプトン、0.5%酵母抽出物、1%塩化ナトリウム)に接種した後、37 $^{\circ}$ Cでのバクテリア吸光度が600nmから約0.5になるまで培養した。その後、培養温度を18 $^{\circ}$ Cに下げて、IPTG(isopropyl- β -D-thiogalactoside)を最終濃度が0.5mMになるように添加した。IPTGを添加して16時間後に、10,000 $\times$ gにて10分間遠心分離して細胞沈殿物を回収した。回収した細胞沈殿物を、30mM トリス-HCl (pH 7.5), 100mM NaCl, 5%グリセロール, 2mM DTT組成の緩衝溶液に懸濁させた後、アイスバスで超音波粉砕機(Sonic Dismembrator、Fisher、米)を用いて細胞を破壊した。前記溶液を、遠心分離機を用い16,000rpmで30分間遠心分離した後、その上層液を以後のたんぱく質精製過程に利用した。

【0194】

続いて、得た上層液を前記の緩衝溶液で予め平衡されたGSTカラム(パーマシア、米)で処理した後、5mMグルタチオンを用い溶出して、該溶出液をSDS-PAGEにかけてGSK-3 β たんぱく質部分のみ回収した後、トロンピンを用いGSTたんぱく質部分を切断した。これにより得たGSK-3 β たんぱく質部分を、20mM HEPES (pH 7.5)、5%グリセロール、2mMDTT組成の緩衝溶液でNaCl濃度が50mM程度になるように希釈した後、前記緩衝溶液で平衡されたモノSカラム(パーマシア、米)で処理して、0~1MNaCl濃度勾配に溶出して電気泳動で確認した後、GSK-3 β たんぱく質部分のみ集めた。このように精製したたんぱく質を適正濃度に濃縮して酵素活性の阻害能測定に用いた。

【0195】

一方、前記実施例から取得された各々の化合物を、ジメチルスルホキシド(DMSO)に12.5mM濃度に溶解して試料化合物を用意した。酵素反応は、50mMトリス-HCl(pH7.5)、10mM MgCl₂、1mM EGTA、1mM EDTA および、1mM DTTを含む緩衝溶液にて行った。前期緩衝溶液に、基質として、100 μ Mホスホクレブペプチド(phospho-CREB peptide、NEB、USA)および、100 μ MのATPと1 μ Ciの³²P-ATPを添加した後、組み換え100nMのGSK-3 β を加えて30 $^{\circ}$ Cで1時間反応させた。反応液25 μ lに5 μ lの5%リン酸溶液(phosphoric acid)を添加することにより反応を停めた後、15,000rpmで10分間遠心分離した。これにより得た上層液20 μ lをワットマンp81ろ紙に点滴した後、前記ろ紙を0.5%のリン酸溶液に入れ10分間洗浄した。洗浄過程をさらに3回繰り返してから乾燥させ、 β -カウンタ(Packard、米)を用いてろ紙のcpm(counter per minutes)を測定した。

【0196】

酵素阻害能は、試料化合物をジメチルスルホキシド(DMSO)に溶解して製造した溶液を、全体の反応液の5%以内に添加して評価した。また、試料化合物のない状態でのcpm値に対する試料化合物存在時のcpm値を百分率で示し、50%の酵素活性を阻害する化合物の濃度を、IC₅₀(μ M)値として判定した。

【0197】

<オーロラキナーゼA>

前記実施例から取得された各々の化合物を、ジメチルスルホキシド(DMSO)に12.5mM

10

20

30

40

50

濃度に溶解して試料化合物を用意した。酵素反応は、20 mM HEPES(pH 7.5)、5 mM MgCl_2 、0.5 mM エチレングリコールビス(b-アミノエチルエーテル)四酢酸(EGTA)、200 mM KCl、1 mM DTT および、0.05%のトリトンX-100を含む緩衝溶液にて行った。前期緩衝溶液に、基質として、100 μM ケンプチドペプチド(Kemptide peptide; Upstate) および、ATP 1 μM を添加した後、組み換えオーロラキナーゼ(Upstate)を10 nM濃度で加えて30℃で1時間反応させた。反応液25 μl にキナーゼグロ(Kinase glo)(promega)を25 μl 添加することにより、ルシフェラーゼによる2回目の反応を起こし、オーロラキナーゼA反応の後に残っているATPの量をフュージョン(Fusion)a-FP(Packard)を用いて測定した。

【0198】

10

酵素阻害能を、GSK-3 β の場合と同様の方法で確認して IC_{50} (μM)値を得た。

【0199】

<細胞外信号調節キナーゼ-1(ERK-1)>

前記実施例からから取得された各々の化合物を、ジメチルスルホキシド(DMSO)に12.5 mM濃度に溶解して試料化合物を用意した。酵素反応は、50 mM トリス-HCl(pH 7.5)、10 mM MgCl_2 、1 mM(EGTA)、1 mM(EDTA)、および、1 mM DTTを含む緩衝溶液にて行った。前期緩衝溶液に、基質として、0.33 mg/ml MBP (Upstate)および、ATP 100 μM と、 ^3P -ATPを0.25 μCi を加えた後、組み換えErk-1(Upstate)を5 nMの濃度で添加し30℃で1時間反応させた。反応液25 μl に5%のリン酸溶液(phosphoric acid)を添加することにより反応を停めた後、この溶液の15 μl をワットマンp81ろ紙に点滴した後、前記ろ紙を0.5%のリン酸溶液に入れ10分間洗浄した。洗浄過程をさらに3回繰り返してから乾燥させ、液体シンチレーション計数機(Packard、米)を用いる紙のcpm(counter per minutes)を測定した。酵素阻害能を、GSK-3 β の場合と同様の方法で確認して IC_{50} (μM)値を得た。

20

【0200】

<サイクリン依存キナーゼ-2(CDK-2)>

緩衝溶液の基質として、2.5 μg ヒストン(Histone) H1(Upstate)を用い、100 nM濃度の組み換えCDK-2/サイクリンA(Upstate)を添加したことを除いて、前記ERK-1の場合と同様の方法で酵素阻害能を測定した。

【0201】

30

<p38(protein 38)ミトゲン活性化たんぱく質キナーゼ(MAPK)>

緩衝溶液の基質として、2.5 μg ヒストン(Histone) H1(Upstate)を用い、5 nM濃度の組み換えp38 α (Upstate)を添加したことを除いて、前記ERK-1の場合と同様の方法で酵素阻害能を測定した。

【0202】

<c-ジューン-N-ターミナルキナーゼ-1(JNK-1)>

緩衝溶液の基質として、272 nMのGST-ATF2(Upstate)を用い、7 nM濃度の組み換えJNK1(Upstate)を添加したことを除いて、前記ERK-1の場合と同様の方法で酵素阻害能を測定した。

【0203】

40

<ピルベートデハイドロゲナーゼキナーゼ-1(PDK-1)>

50 mMトリス-HCl(pH 7.5)、10 mM MgCl_2 、1 mM EGTA、1 mM DTAを含む緩衝溶液を用い、緩衝溶液の基質として、2.5 μM のPDKtide(peptide, Upstate)を用い、組み換えPDK1(Upstate)を31.5 nM濃度で添加したことを除いて、前記オーロラキナーゼAの場合と同様の方法で酵素阻害能を測定した。

【0204】

<KDR>

前記実施例からから取得された各々の化合物を、ジメチルスルホキシド(DMSO)に12.5 mM濃度に溶解して試料化合物を用意した。酵素反応は、50 mM トリス-HCl(pH 7.5)、5 mM MgCl_2 、1 mM MnCl_2 、0.01%ツイーン-20(tween-20)、および、2 mM DTTを含

50

む緩衝溶液にて行った。前期緩衝溶液に、基質として、1nMのBiotin-polyE4Y (Packard) および、ATP0.1 μ Mを加えた後、組み替えKDR (Upstate)を2nMの濃度で添加し30 $^{\circ}$ Cで1時間反応させた。アルファスクリーンホスホチロシン(alphascreen phosphotyrosine ; T-Tyr-100、Packard)ビード(bead)を、62.5mM HEPES(pH7.4)、250mM NaCl、100mM DETA、0.25%BSAに希釈した後、KDR反応液15 μ lに10 μ lを添加し、10分間室温で反応させた。アルファスクリーンシグナル(alphascreen signal)は、フュージョン(Fusion)a-FP (Packard)を用いて測定した。酵素阻害能を、GSK-3 β の場合と同様の方法で確認してIC₅₀(μ M)値を得た。

【0205】

前記GSK-3 β に対する酵素活性阻害能を、比較例の化合物であるカイロン(Caiyeron)社の99021誘導体(文献[Diabetes、52、588~595(2003)]参照)と比較して以下の表2に示す。

【0206】

【表2】

実施例	IC ₅₀ (μ M)
1	0.020
44	0.038
61	0.003
109	0.052
154	0.003
332	0.012
308	0.008
320	0.005
325	0.002
327	0.050
332	0.012
396	0.002
404	0.003
99021誘導体(比較例)	0.030

【0207】

上記表2から、本発明による化学式1の化合物は、比較例に用いたカイロン社の99021誘導体と比べ、極めて優秀なたんぱく質キナーゼ活性の抑制効果を示すことが分かる。

【0208】

また、オーロラキナーゼA、ERK-1、CDK-2、JNK-1、PDK-1、KDRおよび、p38(protein 38)ミトゲン活性たんぱく質キナーゼ(MAPK)に対する酵素活性阻害能を、表3~9に示す。

【0209】

【表 3】

実施例	IC ₅₀ (μ M)
264	0.070
343	0.198
368	0.040
371	0.113
381	0.033
313	1.100
409	0.250
418	0.200
423	0.105
425	>6

10

【0 2 1 0】

20

【表 4】

実施例	IC ₅₀ (μ M)
241	16.5
320	25.5
452	19.0

【0 2 1 1】

30

【表 5】

実施例	IC ₅₀ (μ M)
198	2.4
246	0.225
340	0.4
343	0.3
287	0.12
308	0.95
320	0.17
451	0.36
452	0.35

40

【0 2 1 2】

【表 6】

実施例	IC ₅₀ (μM)
246	0.18
340	0.10
287	0.46
308	0.95
320	14.5
451	10.5

10

【0213】

【表 7】

実施例	IC ₅₀ (μM)
343	3.1
241	28.5

20

【0214】

【表 8】

実施例	IC ₅₀ (μM)
198	12.5
246	0.52
343	0.17
287	1.5
320	0.29
451	1.65

30

【0215】

【表 9】

実施例	IC ₅₀ (μM)
308	50
320	50
451	3.25

40

【0216】

上記表 3～9 から、本発明による化学式 1 の化合物は、様々な種類のたんぱく質キナーゼ活性の抑制効果を示すことが分かる。

【0217】

本発明を前記の具体的な実施例に関して述べたが、添付の特許請求範囲により定義され

50

ている本発明の範囲内において、当分野の熟練者が本発明を多様に変形および、変化することができる。

【産業上の利用可能性】

【0218】

以上説明したように、本発明は、イミダゾピリジン誘導体、これの製造方法およびこれを含む薬学組成物について有用である。

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT		International application No. PCT/KR2007/000393
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER		
<i>C07D 487/04(2006.01)</i>		
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC		
B. FIELDS SEARCHED		
Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols) IPC 8: C07D 487/04		
Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched		
Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used) STN, Medline		
C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 03/035065 A1(AVENTIS PHARMACEUTICALS INC)01 May 2003 See Abstract and Claims 1, 180, 183, 189, 191 and 197	1-16
X	WO 01/96336 A2(WARNER-LAMBERT COMPANY)20 December 2001 See Abstract and Claims 20, 21, 37 and 42	1-16
A	WO 2005/085230 A1(AVENTIS PHARMA DEUTSCHLAND GMBH)15 September 2005 See the whole document.	1-16
A	GINER-SOROLLA, A. et al. Synthesis and screening of 8-(4'-thiazolyl)purines. Journal of Medicinal Chemistry. 1978, Vol. 21, No. 4, pages 344-8. See Table I and III	1-16
☐ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☒ See patent family annex.		
* Special categories of cited documents: "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance "E" earlier application or patent but published on or after the international filing date "L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of citation or other special reason (as specified) "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art "&" document member of the same patent family		
Date of the actual completion of the international search 16 APRIL 2007 (16.04.2007)		Date of mailing of the international search report 16 APRIL 2007 (16.04.2007)
Name and mailing address of the ISA/KR  Korean Intellectual Property Office 920 Dunsan-dong, Seo-gu, Daejeon 302-701, Republic of Korea Facsimile No. 82-42-472-7140		Authorized officer KANG, TAI HYUN Telephone No. 82-42-481-5607 

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No.

PCT/KR2007/000393

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 03/035065 A1	01.05.2003.	US 20060014756 A1	19.01.2006
		US 20040048868 A1	11.03.2004
		US 6897208	24.05.2005
		JP 2005509633 T2	14.04.2005
		EP 1441725 A1	04.08.2004
WO 01/96336 A2	20.12.2001.	US 20040014759 A1	22.01.2004
		US 6943174	13.09.2005
		JP 2004503553 T2	05.02.2004
		EP 1294718 A2	26.03.2003
		CA 2412462 AA	20.12.2001
WO 2005/085230 A1	15.09.2005.	US 20070072866 A1	29.03.2007
		EP 1725543 A1	29.11.2006
		DE 102004010194 A1	13.10.2005
		AR 0047917 A1	01.03.2005
/			

フロントページの続き

(51)Int.Cl.	F I	テーマコード (参考)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)	A 6 1 P 3/04	
A 6 1 P 35/00 (2006.01)	A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 29/00 (2006.01)	A 6 1 P 35/00	
A 6 1 K 31/444 (2006.01)	A 6 1 P 29/00	
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)	A 6 1 K 31/444	
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)	A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 K 31/496 (2006.01)	A 6 1 K 31/4545	
C 0 7 D 519/00 (2006.01)	A 6 1 K 31/496	
	C 0 7 D 519/00 3 1 1	

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW

(74)代理人 100077931
弁理士 前田 弘

(74)代理人 100110939
弁理士 竹内 宏

(74)代理人 100110940
弁理士 嶋田 高久

(74)代理人 100113262
弁理士 竹内 祐二

(74)代理人 100115059
弁理士 今江 克実

(74)代理人 100115691
弁理士 藤田 篤史

(74)代理人 100117581
弁理士 二宮 克也

(74)代理人 100117710
弁理士 原田 智雄

(74)代理人 100121728
弁理士 井関 勝守

(74)代理人 100124671
弁理士 関 啓

(74)代理人 100131060
弁理士 杉浦 靖也

(72)発明者 イ スンチョル
大韓民国 1 3 4-0 2 0 ソウル, ガンドング, チョンホドン, 4 1 4, チョンホ ドゥサン
ウィヴ センティウム 1 5 1 0

(72)発明者 チェ ジンソク
大韓民国 1 3 8-8 5 0 ソウル, ソンバグ, ソンパ1トン, 9 4-2 9, サミック ヴィラ
A-2 0 3

(72)発明者 オ ジョンフン
大韓民国 1 3 8-8 3 6 ソウル, ソンバグ, バンイ1トン, 2 2 2-3, 2 0 3-ホ

- (72)発明者 パク ブンセン
大韓民国 138-040 ソウル, ソンパグ, プンナップトン, 35-1, 301-ホ
- (72)発明者 キム ヨンウン
大韓民国 138-042 ソウル, ソンパグ, プンナップ2ドン, 257-107, 102-ホ
- (72)発明者 イ ジュンヒ
大韓民国 143-200 ソウル, クァンジング, グイドン, 240-11, 301-ホ
- (72)発明者 シン ドンキュ
大韓民国 138-040 ソウル, ソンパグ, プンナップ2ドン, ヒョンデ リバビル アパート 306-1602
- (72)発明者 キム チョルミン
大韓民国 449-160 ギョンギド, ヨンインシ, ジュクジョンドン, ポスホーム タウン 208-904
- (72)発明者 ヒョン ヨンラン
大韓民国 138-040 ソウル, ソンパグ, プンナップトン, 398-14, 103-b03
- (72)発明者 イ チョルスン
大韓民国 464-702 ギョンギド, グァンジュシ, サンリョンドン, ドンソン アパート 101-203
- (72)発明者 チョウ ジュンミョン
大韓民国 138-764 ソウル, ソンパグ, ムンジョン1トン, サムソン レミアン アパート 115-702
- (72)発明者 ノ ソング
大韓民国 472-731 ギョンギド, ナミヤングジュシ, ワブウップ, ドックソリ, ヒョンデ アパート 105-1006

Fターム(参考) 4C065 AA04 BB06 CC01 DD03 EE02 HH08 JJ01 KK02 KK03 KK06
KK10 LL01 PP03 PP04 PP06 PP07 PP09 PP12 PP13 PP15
PP16 PP18 QQ05
4C072 MM02 UU01
4C086 AA01 AA02 AA03 AA04 CB05 CB17 MA01 MA04 NA14 ZA15
ZA70 ZB11 ZB26 ZC20 ZC35