(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2024-0046498
(43) 공개일자 2024년04월09일

(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 487/08 (2006.01) *A61K 31/501* (2006.01)
A61K 31/55 (2006.01) *A61P 35/00* (2006.01)
C07D 471/10 (2006.01) *C07D 487/10* (2006.01)
C07D 487/14 (2006.01)
(52) CPC특허분류
C07D 487/08 (2013.01)
A61K 31/501 (2013.01)
(21) 출원번호 10-2024-7004828
(22) 출원일자(국제) 2022년08월08일
심사청구일자 없음
(85) 번역문제출일자 2024년02월08일
(86) 국제출원번호 PCT/US2022/039696
(87) 국제공개번호 WO 2023/018648
국제공개일자 2023년02월16일
(30) 우선권주장
63/231,219 2021년08월09일 미국(US)
63/231,220 2021년08월09일 미국(US)

(71) 출원인
제넨테크, 인크.
미합중국 캘리포니아 (우편번호 94080-4990) 사우쓰샌프란시스코 디엔에이 웨이 1
(72) 발명자
빌레무어, 엘리시아
미국 94080-4990 캘리포니아 사우쓰샌프란시스코 디엔에이 웨이 1
루돌프, 요아킴
미국 94080-4990 캘리포니아 사우쓰샌프란시스코 디엔에이 웨이 1
젱, 밍슈오
미국 94080-4990 캘리포니아 사우쓰샌프란시스코 디엔에이 웨이 1
(74) 대리인
장덕순, 이귀동

전체 청구항 수 : 총 67 항

(54) 발명의 명칭 **BRM의 조절에 사용하기 위한 페놀 유도체**

(57) 요 약

본 개시는 표적 폴리펩티드 및 단백질, 특히 BRM을 조절하는 데 유용한 화합물 및 이의 염에 관한 것이다. 상기 화합물 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 약제학적 조성물, 그리고 다양한 BRM 매개 및/또는 BRG1 매개 질환 또는 장애의 치료에 이러한 화합물 및 염을 사용하는 방법이 또한 개시된다.

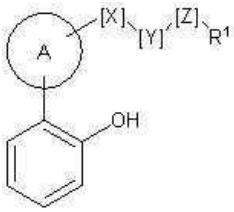
(52) CPC특허분류
A61K 31/55 (2013.01)
A61P 35/00 (2018.01)
C07D 471/10 (2013.01)
C07D 487/10 (2013.01)
C07D 487/14 (2013.01)

명 세 서

청구범위

청구항 1

화학식 (IV')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염:



(IV')

상기 식에서,



는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 R^n으로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^n은 $-N(R^x)(R^y)$, -OH, CN, 할로, C_{1-4}알킬 및 C_{1-4}할로알킬로 구성된 군으로부터 선택되고,

[X]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[Y]는 부재하거나, C_{3-6}시클로알킬, C_{1-6}알킬렌, C_{2-6}알케닐렌 또는 C_{2-6}알키닐렌이고, 이들 각각은 독립적으로 C_{1-6}알킬 및 할로로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고,

[Z]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

R^1은

(a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

(i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고,

R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서

R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서

R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서

R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되거나, 또는

(b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

n은 1-6의 정수이고,

R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고, 여기서

$-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

p는 1-6의 정수이고,

R^p 및 R^q는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고, 여기서

R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고,

R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되거나, 또는

(c) $-C\equiv C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

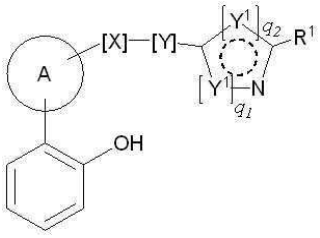
R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^e는 독립적으로 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서

각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알콕시이다.

청구항 2

제1항에 있어서, 화학식 (IV'-L)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염:



(IV'-L)

상기 식에서,

각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고,

q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이다.

청구항 3

제1항 또는 제2항 중 어느 한 항에 있어서,

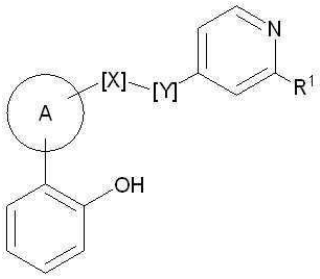
각 Y^1은 CH이고,

q_1과 q_2의 합은 3인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 4

제3항에 있어서, 화학식 (IV'-N)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염:



(IV'-N).

청구항 5

제1항 내지 제4항 중 어느 한 항에 있어서, [Y]는 부재하는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 6

제1항 내지 제5항 중 어느 한 항에 있어서, R^1은 $-C\equiv C-R^a$인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 7

제6항에 있어서, R^a는 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15- 원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 8

제6항에 있어서,

R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고,

R^b는 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15- 원 헤테로사이클인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 9

제7항 또는 제8항에 있어서,

R^a 또는 R^b의 3- 내지 15-원 헤테로사이클은 $-N(R^j)(R^k)$이고,

$-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하는 것인

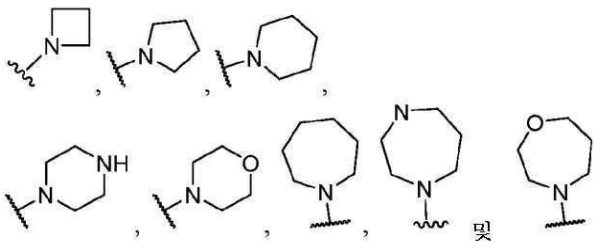
화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 10

제9항에 있어서, R^b는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 11

제10항에 있어서, 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



및

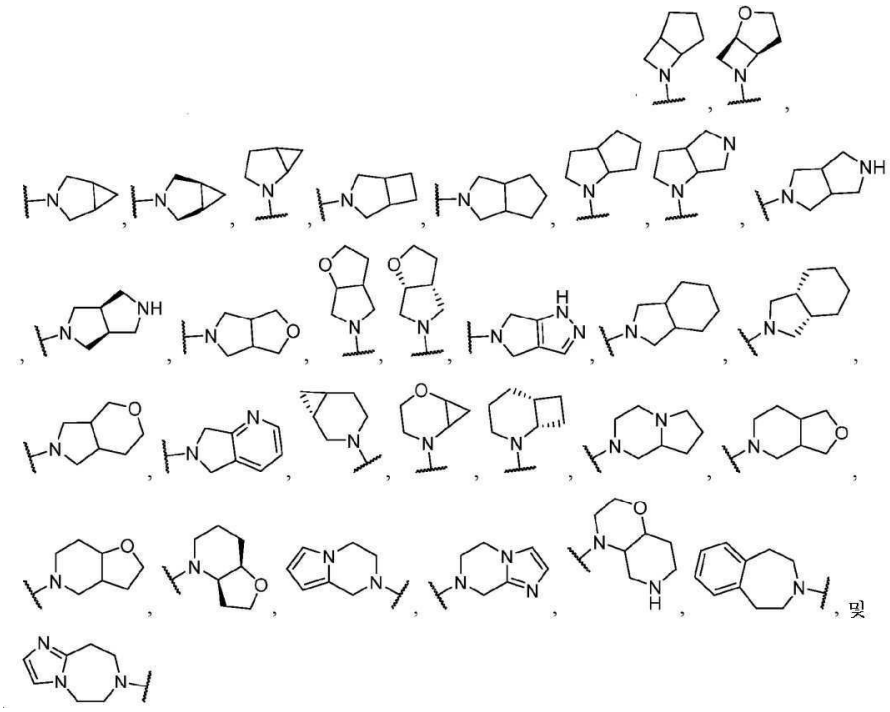
로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 12

제9항에 있어서, R^b는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 13

제12항에 있어서, R^b의 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



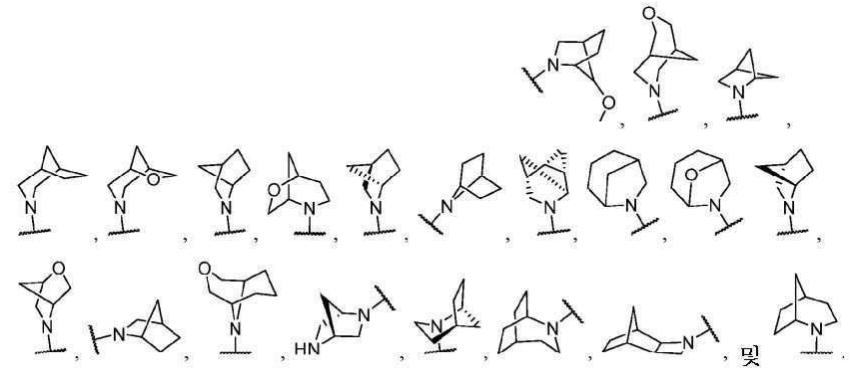
로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 14

제9항에 있어서, R^b는 다리걸친 4- 내지 12-원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 15

제14항에 있어서, R^b의 다리걸친 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



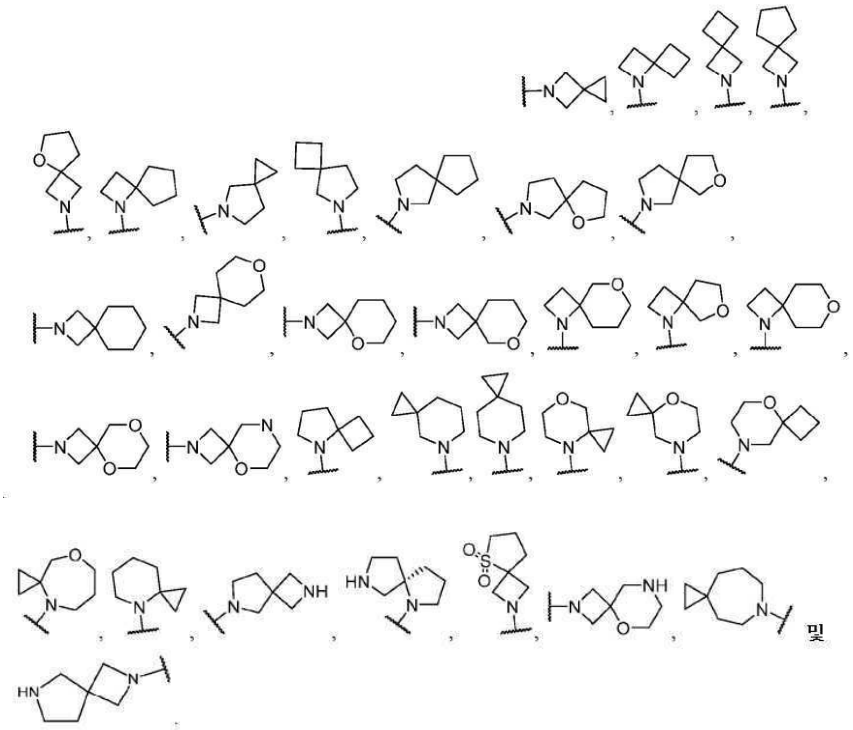
로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 16

제9항에 있어서, R^b는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 17

제16항에 있어서, R^b의 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

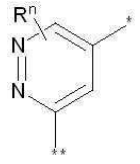
청구항 18

제1항 내지 제17항 중 어느 한 항에 있어서, R^b는 플루오린, -OH, 옥소, 메틸, 메탄올, 시클로프로필, 메톡시, 에톡시 및 $-CF_3$로 구성된 군으로부터 선택된 한 개, 두 개, 세 개 또는 네 개의 치환기로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

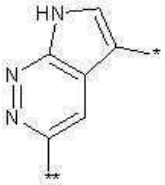
청구항 19

제1항 내지 제18항 중 어느 한 항에 있어서, 

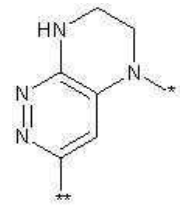
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염:

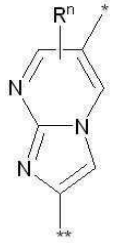
(a) 

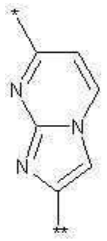
,

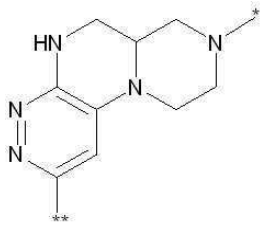
(b) 

,

(c)  ,

(d)  ,

(e)  ,및

(f) 

상기 식에서,

R^n은 $-NH_2$이고,

(a)-(f)에 대해,

*는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나,

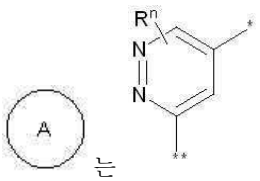
[X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나,

[X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고,

**는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다.

청구항 20

제1항 내지 제19항 중 어느 한 항에 있어서,

 는 이고,

R^n은 $-NH_2$이고,

*는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나,

[X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나,

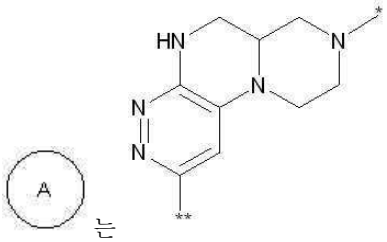
[X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고,

**는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 21

제1항 내지 제19항 중 어느 한 항에 있어서,



는 이고,

[X]는 부재하고, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나,

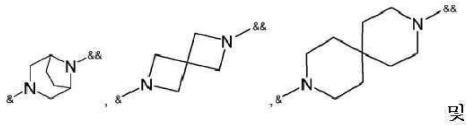
[Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고,

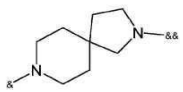
**는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 22

제1항 내지 제20항 중 어느 한 항에 있어서,

[X]는 부재하거나, 또는 

및 

로 구성된 군으로부터 선택되고,

여기서,

&는 

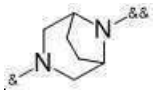
에 대한 부착점을 나타내고,

&&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 23

제19항에 있어서,

[X]는 

이고,

여기서,

&는 

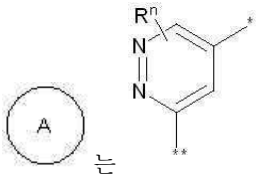
에 대한 부착점을 나타내고,

&&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 24

제1항에 있어서,

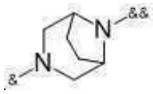

는 이고,

여기서,

R^n은 NH_2이고,

*는 [X]에 대한 부착점을 나타내고,

**는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고,

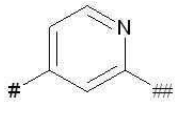
[X]는  이고,

여기서,

&는  에 대한 부착점을 나타내고,

&&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고,

[Y]는 부재하고,

[Z]는  이고,

여기서,

##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

#는 [X]에 대한 부착점을 나타내고,

R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

R^a의 C_{1-6}알킬은 하나의 R^b로 치환되고,

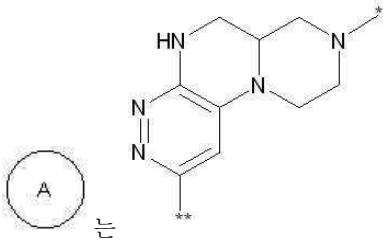
R^b는 $-N(R^j)(R^k)$이고,

$-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 25

제1항에 있어서,



는 이고,

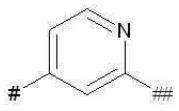
여기서,

*는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고,

**는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고,

[X]는 부재하고,

[Y]는 부재하고,

[Z]는 

이고,

여기서,

##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

#는 [X]에 대한 부착점을 나타내고,

R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

R^a의 C_{1-6}알킬은 하나의 R^b로 치환되고,

R^b는 $-N(R^j)(R^k)$이고,

$-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하는 것인

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 26

제1항에 있어서, 표 1, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 27

(i) 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염 및

(ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제

를 포함하는 약제학적 조성물.

청구항 28

제27항에 있어서,

추가의 생물활성제

를 더 포함하는 약제학적 조성물.

청구항 29

세포에서 BRM을 조절하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물에 세포를 노출시키는 것을 포함하는 방법.

청구항 30

세포에서 BRM을 억제하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물에 세포를 노출시키는 것을 포함하는 방법.

청구항 31

세포에서 BRM을 분해하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항에 따른 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물에 세포를 노출시키는 것을 포함하는 방법.

청구항 32

BRM 매개 질환, 장애 또는 병태의 치료를 필요로 하는 인간의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물을 인간에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 33

제32항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 방법.

청구항 34

제32항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 방법.

청구항 35

BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태의 치료를 필요로 하는 인간의 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물을 인간에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 36

제35항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 방법.

청구항 37

제36항에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및

음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 방법.

청구항 38

인간의 암 치료 효능을 증가시키는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물을 인간에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 39

인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물을 인간에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 40

인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법이며, 유효량의 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물을 인간에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 41

제38항 내지 제40항 중 어느 한 항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 방법.

청구항 42

BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에 있어서, 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물의 용도.

청구항 43

제42항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 용도.

청구항 44

제43항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 용도.

청구항 45

BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에 있어서, 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물의 용도.

청구항 46

제45항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 용도.

청구항 47

제46항에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 용도.

청구항 48

암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에 있어서, 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물의 용도.

청구항 49

제48항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 용도.

청구항 50

BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 51

제50항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 52

제51항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포

종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 53

BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 54

제53항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 55

제54항에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 56

암의 치료에 사용하기 위한, 제1항 내지 제26항 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 57

제56항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

청구항 58

BRM에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 59

제58항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 약제학적 조성물.

청구항 60

제59항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환

암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 약제학적 조성물.

청구항 61

BRG1에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 62

제61항에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인 약제학적 조성물.

청구항 63

제62항에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 약제학적 조성물.

청구항 64

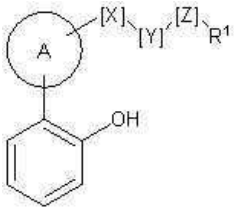
암의 치료에 사용하기 위한, 제27항 또는 제28항의 약제학적 조성물.

청구항 65

제64항에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는 것인 약제학적 조성물.

청구항 66

화학식 (IV')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 방법:



(IV')

상기 식에서,



는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 R^n으로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^n은 $-N(R^x)(R^y)$, -OH, CN, 할로, C_{1-4}알킬 및 C_{1-4}할로알킬로 구성된 군으로부터 선택되고,

[X]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[Y]는 부재하거나, C_{3-6}시클로알킬, C_{1-6}알킬렌, C_{2-6}알케닐렌 또는 C_{2-6}알키닐렌이고, 이들 각각은 독립적으로 C_{1-6}알킬 및 할로로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고,

[Z]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

R^1은

(a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

(i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고,

R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서

R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서

R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되거나, 또는

(iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서

R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고,

(b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

n은 1-6의 정수이고,

R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고, 여기서

$-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

p는 1-6의 정수이고,

R^p 및 R^q는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고, 여기서

R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고,

R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되거나, 또는

(c) $-C=C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서

각 R^e는 독립적으로 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서

각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알콕시이다.

청구항 67

제66항의 방법에 의해 제조되는 것인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

발명의 설명

기 술 분 야

배 경 기 술

[0001] 관련 출원에 대한 상호 참조

[0002] 본 출원은 2021년 8월 9일에 출원된 미국 가출원 번호 63/231,219 및 2021년 8월 9일에 출원된 미국 가출원 번호 63/231,220에 대한 우선권을 주장하고, 이들 각각의 내용은 본원에 그 전체가 참조로 포함된다.

[0003] 배경기술

[0004] 본 설명은 BRM을 조절하는 능력을 입증하는 화합물 및 이의 사용 방법을 제공한다.

[0005] 염색질의 SWI/SNF 관련, 매트릭스 연관, 액틴 의존성 조절인자, 서브패밀리 A는 두 개의 상호 배타적인 헬리카제/ATPase 촉매 소단위: (1) 염색질의 SWI/SNF 관련, 매트릭스 연관, 액틴 의존성 조절인자, 서브패밀리 A 멤버 2(SMARCA2)(즉 BRAHMA 또는 BRM); 및 (2) 염색질의 SWI/SNF 관련, 매트릭스 연관, 액틴 의존성 조절인자, 서브

패밀리 A, 멤버 4(SMARCA4)(즉 BRG1)의 활성을 통해 염색질 구조를 조절하는 다중 소단위 복합체이다. 코어 및 조절 소단위체는 ATP 가수분해를 히스톤-DNA 접촉의 교란과 결합하여, 유전자 활성화 및 억제를 촉진하는 전사 인자 및 동족 DNA 요소에 대한 접근 지점을 제공한다.

[0006] 20 개의 정준 SWI/SNF 소단위를 암호화하는 유전자의 돌연변이는 모든 암의 거의 20%에서 관찰된다. 높은 정도의 상동성을 갖는 것 및 이들의 중복되는 것으로 추정되는 기능에도 불구하고, BRM 및 BRG1은 암에서 서로 다른 역할을 하는 것으로 보고되었다. 예를 들어, BRG1은 원발성 종양에서 빈번하게 돌연변이되는 반면, BRM 불활성화는 종양 발달에서 드물다. 실제로, 예를 들어 폐암(예컨대 비소세포 폐암)을 포함하여 수많은 유형의 암이 BRG1 관련된 것으로 나타났다 (예를 들어 BRG1-돌연변이 또는 BRG1-결핍, 예컨대 발현 결여가 있는 암).

[0007] BRM은 BRG1 관련 또는 BRG1 돌연변이 암 세포주에서 가장 필수적인 유전자 중 하나로 입증되었다. 이는 BRG1 결핍 환자 집단 또는 세포가 BRM 활성에만 의존하기 때문이다. 즉 BRG1 결핍을 보상하기 위해 복합체에 BRM이 더 많이 통합되기 때문이다. 따라서, BRM은 BRG1 관련/결핍 암의 억제 또는 분해를 표적으로 할 수 있다. 세포 사멸을 유발하는 두 개(이상)의 유전자의 발현 결핍의 동시 발생은 합성 치사율로 알려져 있다. 따라서, 특정 BRM/BRG1 관련 암의 치료에 합성 치사율이 활용될 수 있다.

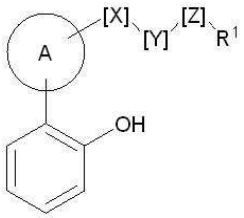
[0008] BRM을 조절, 억제 또는 분해함으로써 치료 가능한 장애, 질환 및 병태에 대한 효과적인 치료에 대한 지속적인 요구가 있다. 따라서, BRM을 표적으로 하는 소분자 치료제가 유용한 것으로 입증될 것이다.

발명의 내용

[0009] 요약

[0010] 본 개시는 암, 면역학적 장애 및 기타 BRM 매개 장애의 치료에 효과적인 화합물에 관한 것이다. 본 개시는 또한, 암, 특히 폐암 또는 비소세포 폐암과 같은 BRG1 관련/결핍 암과 같은 질환 또는 병태의 치료 또는 개선을 위해 유효량의 본원에 기재된 화합물을 사용하는 방법에 관한 것이다.

[0011] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물:



[0012] (IV'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0013] 

는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 R^n으로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^n은 $-N(R^x)(R^y)$, -OH, CN, 할로, C_{1-4}알킬 및 C_{1-4}할로알킬로 구성된 군으로부터 선택되고;

[0014] [X]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고;

[0015] [Y]는 부재하거나, C_{3-6}시클로알킬, C_{1-6}알킬렌, C_{2-6}알케닐렌 또는 C_{2-6}알키닐렌이고, 이들 각각은 독립적으로 C_{1-6}알킬 및 할로로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고;

[0016] [Z]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0017] R^1은:

[0018] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0019] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으

로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0020] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0021] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0022] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0023] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고,

[0024] 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0025] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0026] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0027] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0028] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 또는

[0029] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0030] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0031] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0032] 여기서

[0033] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0034] *p*는 1-6의 정수이고,

[0035] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0036] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

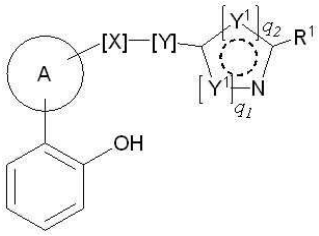
[0037] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0038] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0039] (c) $-C\equiv C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선

택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

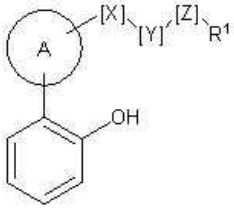
[0040] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (IV'-L)의 화합물:



[0041] (IV'-L), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, 

, [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

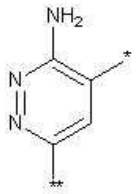
[0042] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물:



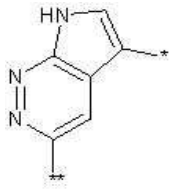
[0043] (I'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0044] 

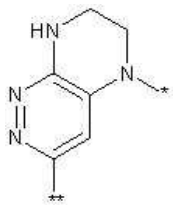
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

[0045] (a) 

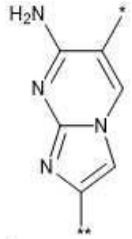
;

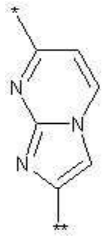
[0046] (b) 

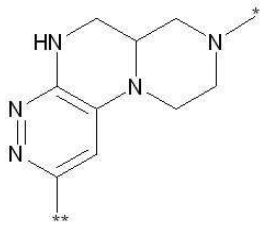
;

[0047] (c) 

;

[0048] (d)  ;

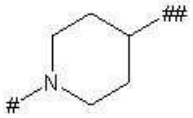
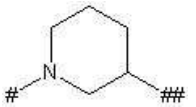
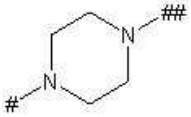
[0049] (e)  ; 및

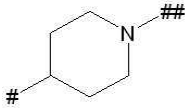
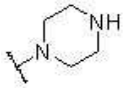
[0050] (f)  ,

[0051] 여기서, (a)-(f)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0052] 여기서:

[0053] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0054] 단,  가 (a)인 경우, [X]는  ,  , 또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, 그리고

[0055] 단,  가 (f)이고, [X]는  이고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, R^g는 OH 또는  이 아니고

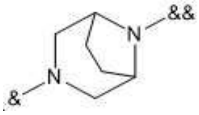
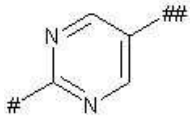
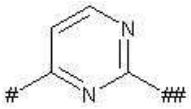
[0056] [Y]는 부재하고, 그리고

[0057] [Z]는 부재하고; 또는

[0058] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

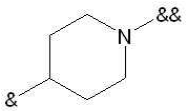
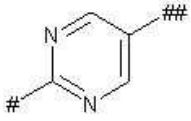
[0059] [Y]는 부재하고, 그리고

[0060] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0061] 단,  가 (a)이고, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가  또는  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우:

[0062] (a-i) R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0063] (a-ii) R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g가 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0064] 단,  가 (b)이고, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우:

[0065] (a-i) R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0066] (a-ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g는 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고; 또는

[0067] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0068] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0069] [Z]는 3-15원 헤테로시클릴이고; 또는

[0070] (iv) [X]는 부재하고,

[0071] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0072] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0073] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0074] (v) [X]는 부재하고,

[0075] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[0076] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0077] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0078] (vi) [X]는 부재하고,

[0079] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[0080] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0081] 단 

는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0082] (vii) [X]는 부재하고,

[0083] [Y]는 부재하고, 그리고

[0084] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0085] R^1은:

[0086] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0087] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0088] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0089] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0090] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0091] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0092] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0093] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0094] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0095] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0096] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0097] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0098] n은 1-6의 정수이고, 그리고

[0099] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0100] 여기서

[0101] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리

고

[0102] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0103] p는 1-6의 정수이고,

[0104] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0105] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

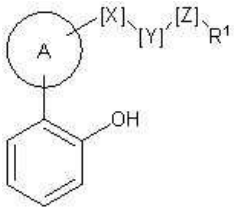
[0106] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0107] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0108] (c) $-C{\equiv}C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알콕시이다.

[0109] 일부 구현예에서, R^c는 OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^a는 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 또는 R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 각 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, 3-15 원 헤테로시클릴은 $-N(R^j)(R^k)$이다. 일부 구현예에서, 3-15 원 헤테로시클릴은 $-N(R^j)(R^k)$이고, 여기서 $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

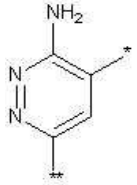
[0110] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물:



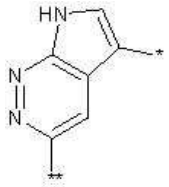
[0111] (I), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

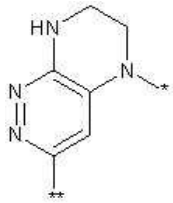
[0112] 

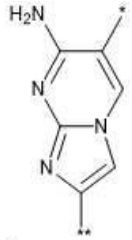
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

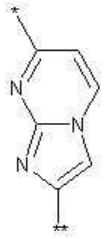
[0113] (a) 

;

[0114] (b)  ;

[0115] (c)  ;

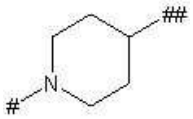
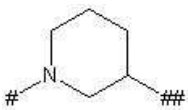
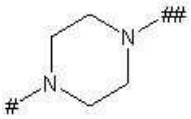
[0116] (d)  ; 및

[0117] (e)  ,

[0118] 여기서, (a)-(e)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0119] 여기서:

[0120] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0121] 단,  가 (a)인 경우, [X]는  ,  , 또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

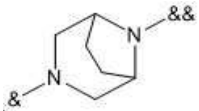
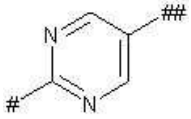
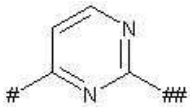
[0122] [Y]는 부재하고, 그리고

[0123] [Z]는 부재하고; 또는

[0124] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[0125] [Y]는 부재하고, 그리고

[0126] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0127] 단,  가 (a)이고 [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는  이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; 또는

[0128] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0129] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0130] [Z]는 3-15원 헤테로시클릴이고; 또는

[0131] (iv) [X]는 부재하고,

[0132] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0133] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0134] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0135] (v) [X]는 부재하고,

[0136] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[0137] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0138] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0139] (vi) [X]는 부재하고,

[0140] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[0141] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0142] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 그리고

[0143] R^1은:

[0144] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0145] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0146] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0147] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0148] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0149] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0150] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0151] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0152] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0153] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0154] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0155] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0156] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0157] 여기서

[0158] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

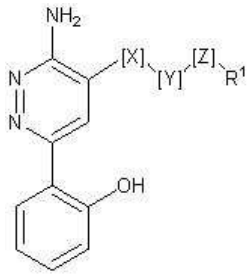
[0159] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0160] *p*는 1-6의 정수이고,

[0161] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[0162] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0163] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-A)의 화합물:



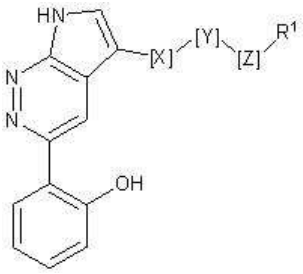
[0164] (I-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 I-A의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0165] 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허

용되는 염의 본원에 제공된 임의의 구현예, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예는 또한 화학식 (I') 또는 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 구현예, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예이다.

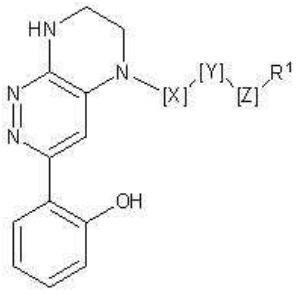
[0166] 화학식 (I), (I'), (II), (II') 또는 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 본원에 제공된 임의의 구현예, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예는 또한, 화학식 (IV')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 구현예, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예이다.

[0167] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-B)의 화합물:



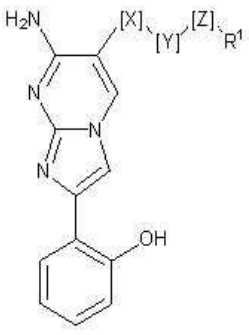
[0168] (I-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 I-B의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0169] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-C)의 화합물:



[0170] (I-C), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-C)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

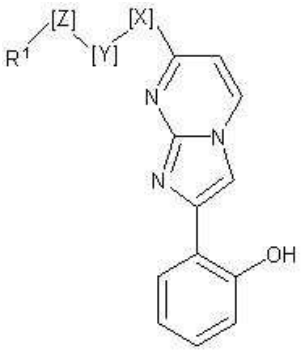
[0171] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-D)의 화합물:



[0172] (I-D), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-D)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는

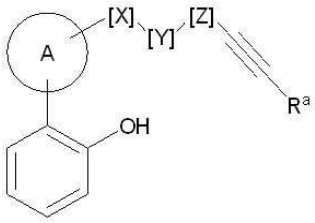
이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0173] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-E)의 화합물:



[0174] (I-E), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-E)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

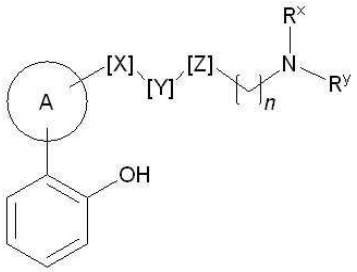
[0175] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-F)의 화합물:



[0176] (I-F), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 

는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-F)의 [X], [Y], [Z] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

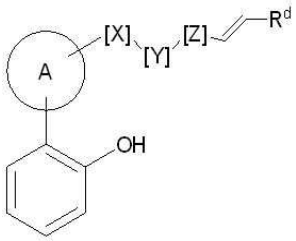
[0177] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-G)의 화합물:



[0178] (I-G), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z], 

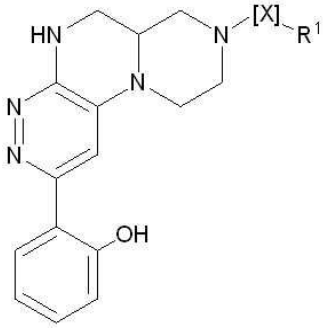
, n, R^x 및 R^y는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-G)의 [X], [Y], [Z], R^x 및 R^y는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0179] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-H)의 화합물:



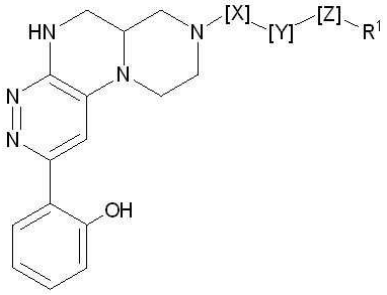
[0180] (I-H), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^d는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-H)의 [X], [Y], [Z] 및 R^d는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0181] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-I)의 화합물:



[0182] (I-I), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0183] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-I1)의 화합물:



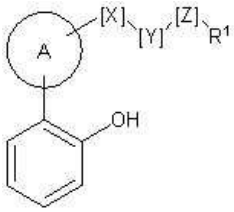
[0184] (I-I1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0185] 한 양태에서, 본원에서는 (i) 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 (i) 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다.

[0186] 한 양태에서, 본원에서는 (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1),

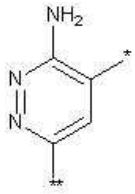
(I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다.

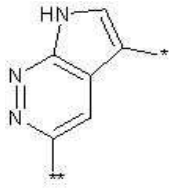
[0187] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물,

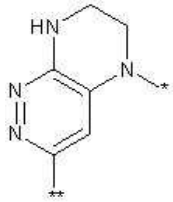


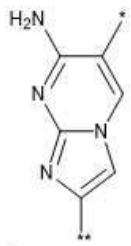
[0188] (III'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공되고, 여기서:

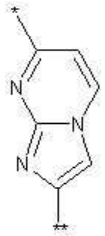
[0189]  는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

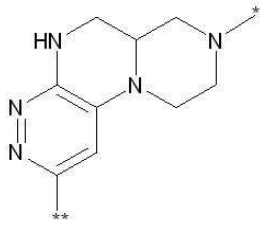
[0190] (a)  ;

[0191] (b)  ;

[0192] (c)  ;

[0193] (d)  ;

[0194] (e)  ; 및

[0195] (f)  ,

[0196] 여기서, (a)-(f)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0197] 여기서:

[0198] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0199] [Y]는 부재하고, 그리고

[0200] [Z]는 부재하고; 또는

[0201] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[0202] [Y]는 부재하고, 그리고

[0203] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고; 또는

[0204] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0205] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0206] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; 또는

[0207] (iv) [X]는 부재하고,

[0208] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0209] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 또는

[0210] (v) [X]는 부재하고,

[0211] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[0212] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 또는

[0213] (vi) [X]는 부재하고,

[0214] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[0215] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 또는

[0216] (v) [X]는 부재하고,

[0217] [Y]는 부재하고, 그리고

[0218] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0219] R^1은:

[0220] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0221] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0222] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0223] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0224] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0225] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0226] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0227] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0228] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0229] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0230] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0231] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0232] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0233] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0234] 여기서

[0235] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0236] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0237] *p*는 1-6의 정수이고,

[0238] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0239] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로

치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0240] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0241] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0242] (c) -C=C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

[0243] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) i) 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0244] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) i) 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의

입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0245] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) i) 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0246] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 또는 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 또는 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 또는 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0247] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임

의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0248] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0249] 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용

되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0250] 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0251] 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2),

(IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0252] 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0253] 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0254] 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

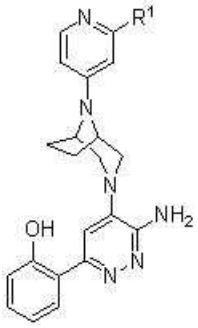
[0255] 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질

체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

[0256] 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

[0257] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-B), (I-C), (I-D) (I-E), (I-F) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정이 제공된다.

[0258] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II')의 화합물:



[0259] (II'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0260] (i) R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0261] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0262] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0263] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0264] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0265] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0266] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0267] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0268] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0269] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0270] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0271] (ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0272] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고, 그리고

[0273] *n*은 1-6의 정수이고;

[0274] 여기서

[0275] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0276] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0277] *p*는 1-6의 정수이고,

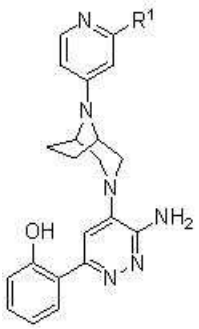
[0278] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0279] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0280] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0281] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환된다.

[0282] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물:



[0283] (II), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0284] (i) R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0285] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0286] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0287] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0288] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0289] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0290] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0291] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0292] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0293] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0294] (ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0295] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0296] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고,

[0297] 여기서

[0298] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0299] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0300] *p*는 1-6의 정수이고,

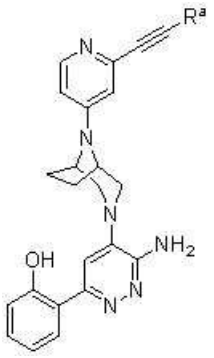
[0301] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[0302] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0303] 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 본원에 제공된 임의의 구현예, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예는 또한 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체의 구현예, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는

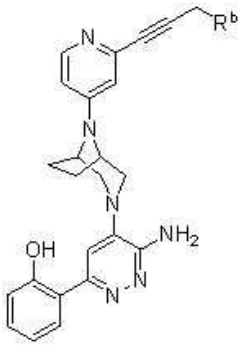
염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예이다.

[0304] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II-A)의 화합물:



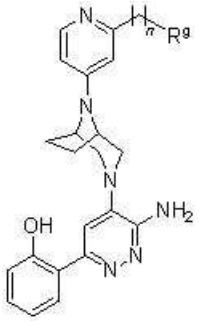
[0305] (II-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II-A)의 R^a는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0306] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II-A1)의 화합물:



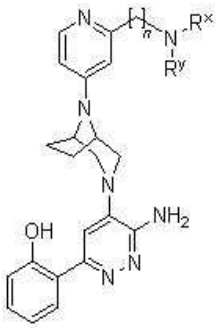
[0307] (II-A1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II-A1)의 R^b는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0308] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (I-B)의 화합물:



[0309] (II-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^g는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II-B)의 R^g는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0310] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II-B1)의 화합물:



[0311] (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^x, R^y 및 n은 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II-B1)의 R^x, R^y 및 n은 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0312] 한 양태에서, 본원에서는 (i) 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다.

[0313] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0314] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0315] 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서,

세포를 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0316] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 또는 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함한다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 또는 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0317] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0318] 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0319] 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또

는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0320] 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[0321] 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0322] 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0323] 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[0324] 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

[0325] 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

[0326] 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학

적으로 허용되는 염이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다.

[0327] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II')의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정이 제공된다. 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정이 제공된다.

[0328] 상세한 설명

[0329] 현재 개시된 주제는 이제 이하에서 보다 완전하게 설명될 것이다. 그러나, 본원에 제시된 현재 개시된 주제의 많은 변형 및 다른 구현예들이 전술한 설명에서 제시된 교시의 이점을 가지면서 현재 개시된 주제가 속한 기술 분야의 숙련자에게 떠오를 것이다. 따라서, 현재 개시된 주제는 개시된 특정 구현예들에 제한되지 않으며 변형 및 기타 구현예들은 첨부된 청구범위에 속하는 것으로 의도됨을 이해하여야 한다. 즉, 본원에 기재된 주제는 대안, 수정 및 등가물을 포함한다. 정의된 용어, 용어 용례 또는 설명된 기술 등을 포함하지만 이에 제한되지 않는, 원용된 문헌, 특허 및 유사한 자료들 중에서 하나 이상이 본 출원과 상이하거나 상충하는 경우, 본 출원이 우선한다. 달리 정의되지 않는 경우, 본원에서 사용되는 기술 용어 및 과학 용어는 본 개시가 속하는 기술분야에서 통상의 지식을 가진 자에게 공통적으로 이해되는 것과 동일한 의미를 가지며, 해당 용어를 본 개시를 설명하는 데 사용하는 문맥에서 적용한다. 본 명세서에 사용되는 용어들은 오직 특징 구현예들을 설명하기 위하여 사용되는 것이며 본 개시를 제한하려는 것이 아니다. 본원에 언급된 모든 간행물, 특허 출원, 특허 및 기타 참조문헌은 그 전체가 참조로 포함된다.

[0330] I. 정의

[0331] 용어 "모이어티" 또는 "기"는 또 다른 구성요소에 공유 결합되거나 연결된 구성요소를 지칭한다.

[0332] "환자" 또는 "개체" 또는 "대상체"는 포유류이다. 포유동물은 가축(예컨대, 소, 양, 고양이, 개, 및 말), 영장류(예컨대, 인간 및 원숭이와 같은 비인간 영장류), 토끼, 및 설치류(예컨대, 마우스 및 래트)를 포함하지만 이에 제한되지는 않는다. 특정 구현예에서, 환자, 개체 또는 대상체는 인간이다. 구현예에서, 환자는 "암 환자", 즉 하나 이상의 암 증상을 앓고 있거나 앓을 위험이 있는 환자일 수 있다.

[0333] 용어 "암"은 전형적으로 조절되지 않는 세포 성장/증식을 특징으로 하는 포유동물의 생리학적 병태를 지칭하거나 설명한다. 특히, 용어 "암"은 암성 또는 악성 신생물, 즉 세포 증식에 의해 흔히 정상보다 더 빠르게 성장하고 새로운 성장을 개시하는 자극이 멈춘 후 성장을 지속하는 비정상 조직의 형성 및 성장을 야기하는 병리학적 과정을 지칭하기 위해 명세서 전반에 걸쳐 사용된다. 악성 신생물은 정상 조직과의 구조적 조직 및 기능적 조화의 부분적 또는 완전한 결여를 나타내고, 대부분 주변 조직을 침범하고, 여러 부위로 전이되며, 제어 시도 후에도 재발하고 적절하게 치료되지 않으면 환자의 사망을 초래할 가능성이 높다. "종양"은 하나 이상의 암성 세포를 포함한다. 암의 예는 본원의 다른 곳에서 제공된다.

[0334] 본원에서 사용된 "치료"(및 이의 문법적 변형, 예를 들어, "치료하다" 또는 "치료하는")는 치료받는 개체의 자연적 과정을 변화시키기 위한 시도에서의 임상적 개입을 지칭하며, 예방을 위해 또는 임상 병리 과정 동안 수행될 수 있다. 바람직한 치료 효과는 질병의 발생 또는 재발의 예방, 증상의 경감, 질병의 임의의 직접적 또는 간접적 병리학적 결과의 축소, 전이 예방, 질환 진행의 속도 감소, 질병 상태의 개선 또는 완화, 그리고 관해 또는 개선된 예후를 포함하지만 이에 한정되지 않는다. 구현예에서, 본원에 기재된 주제의 화합물 및 조성물은 질병의 발병을 지연시키거나 질병의 진행을 늦추기 위해 사용된다. 구현예에서, 치료는 예방을 위해서만 수행된다. 구현예에서, 치료는 임상 병리 과정 동안에만 수행된다 (즉 예방을 위한 것이 아님). 구현예에서, 치료는 임상 병리 과정 동안 그리고 예방을 위해 수행된다.

[0335] 본원에서 사용된 용어 "조절하다"(및 이의 문법적 변형, 예컨대 "조절" 또는 "조절하는")은 주어진 작용, 활성, 과정, 사전 또는 특징의 속도, 정도 또는 크기를 직접적으로 또는 간접적으로 수정, 변경, 제어, 변화, 증가 또는 감소시키는 것을 의미한다. 예를 들어, 비제한적 구현예에서, 세포에서 BRM 활성을 조절하는 것은 세포에서 BRM의 활성을 증가시키는 것을 의미한다. 다른 비제한적 구현예에서, 세포에서 BRM 활성을 조절하는 것은 세포에서 BRM의 활성을 감소시키는 것을 의미한다. 용어 "조절하다"는 아래에 정의된 바와 같이 용어 "억제하다"를 포함한다.

[0336] 본원에서 사용된 용어 "억제하다"(및 이의 문법적 변형, 예컨대 "억제" 및 "억제하는")는 주어진 작용, 활성, 과정, 사건 또는 특징을 직접적으로 또는 간접적으로 방해, 감소 또는 예방하는 것을 의미한다. 억제는 전체적이거나 부분적일 수 있다. 예를 들어, 비제한적 구현예에서, 세포에서 BRM 활성을 억제하는 것은 세포에서 BRM의 활성을 방해하거나 감소시키거나 방지하는 것을 의미한다.

[0337] 본원에서 사용된 용어 "분해하다"(및 이의 문법적 변형, 예컨대 "분해" 및 "분해하는")는 표적 개체를 분해하거나 표적 개체가 (직접적으로 또는 직접적으로) 분해되도록 하는 것을 의미한다. 구현예에서, 표적 개체의 분해는 주어진 작용, 활성, 과정, 사건 또는 특징의 억제를 야기한다. 예를 들어, 비제한적 구현예에서, 세포에서 BRM의 분해는 세포에서 BRM의 활성의 감소 또는 방지되도록 세포에서 BRM을 분해하거나 세포에서 (직접적으로 또는 간접적으로) BRM이 분해되도록 하는 것을 의미한다.

[0338] 하나 이상의 다른 약물과 "동시에" 투여되는 약물은 동일한 치료 주기 동안, 하나 이상의 다른 약물과 동일한 치료 일자에, 그리고 선택적으로 하나 이상의 다른 약물과 동일한 시간에 투여된다. 예를 들어, 3주마다 제공되는 암 요법의 경우에, 동시에 투여되는 약물은 각각 3주 주기의 1일차에 투여된다.

[0339] 용어 "유효"는 의도된 용도의 맥락 내에서 사용될 때, 원하는 치료 또는 예방 결과를 달성하는 화합물, 조성물 또는 성분의 양을 설명하기 위해 사용된다. 용어 유효는 본 출원에서 달리 기재되거나 사용되는 다른 유효량 또는 유효 농도 용어를 포함한다. 본원에서 사용된 용어 "치료적 유효량"은 이러한 양을 투여받지 않은 상응하는 대상체와 비교할 때, 질환, 장애, 병태 또는 부작용의 치료, 또는 질환, 장애, 병태 또는 부작용의 진행 속도 감소를 야기하는 최소량을 의미한다. 상기 용어는 또한 정상적인 생리적 기능을 향상시키는 데 효과적인 양을 이의 범위 내에 포함한다. 요법에서 사용하기 위해, 치료적 유효량의 본 개시의 화합물뿐만 아니라, 이의 약제학적으로 허용되는 염이, 미가공 화학물질로서 투여될 수 있다. 또한, 활성 성분은 약제학적 조성물로서 제공될 수 있다.

[0340] 청구항에서 달리 정의되지 않는 한 본원에서 사용된 용어 "선택적으로"는 후속적으로 설명되는 사건(들)이 발생하거나 발생하지 않을 수 있음을 의미하며, 발생하는 두 사건(들) 및 발생하지 않는 사건(들)을 포함한다.

[0341] 달리 정의되지 않는 한 본원에서 사용된 문구 "선택적으로 치환된", "치환된", "추가로 선택적으로 치환된" 또는 이의 변형은 하나 이상의 치환기, 예를 들어, 하나, 둘, 셋, 넷 또는 다섯 개의 치환기를 갖는 다중 치환도를 포함하는 선택적인 치환을 나타낸다. 이 문구는 본원에 기재되고 묘사된 치환의 중복으로 해석되어서는 안 된다.

[0342] 용어 "약제학적 제제" 또는 "약제학적 조성물"은 이에 함유된 활성 성분의 생물학적 활성이 효과적이도록 허용하는 형태이고, 제제가 투여될 대상체에게 허용 불가능하게 독성인 추가 성분을 함유하지 않는 제제를 지칭한다.

[0343] "약제학적으로 허용되는 부형제"는 대상체에게 비독성인, 활성 성분 이외의 약제학적 제제 중의 성분을 지칭한다. 약학적으로 허용되는 부형제는 완충제, 담체, 안정화제 또는 보존제를 포함하지만, 이에 제한되지 않는다.

[0344] 본원에서 사용된 용어 "약제학적으로 허용되는 염"은, 본원에 기재된 화합물에서 발견되는 특정 치환기에 따라, 비교적 비독성인 산 또는 염기를 이용하여 제조된 활성 화합물의 염을 포함하는 것을 의미한다. 본 발명의 화합물이 비교적 산성인 작용기를 포함하는 경우, 그러한 화합물의 중성 형태를 용매 없이 또는 적합한 불활성 용매 중에서 충분한 양의 원하는 염기와 접촉시켜 염기 부가염이 수득될 수 있다. 약학적으로 허용되는 무기 염기로부터 유도되는 염의 예는 알루미늄, 암모늄, 칼슘, 구리, 제이철, 제일철, 리튬, 마그네슘, 망간, 이가망간, 칼륨, 나트륨, 아연 등을 포함한다. 약제학적으로 허용되는 유기 염기로부터 유도되는 염은 치환된 아민, 환형 아민, 자연 발생 아민 등을 비롯한 일차, 이차와 삼차 아민의 염, 예컨대 아르기닌, 베타인, 카페인, 콜린, N,N'-디벤질에틸렌디아민, 디에틸아민, 2-디에틸아미노에탄올, 2-디메틸아미노에탄올, 에탄올아민, 에틸렌디아민, N-에틸모르폴린, N-에틸피페리딘, 글루카민, 글루코사민, 히스티딘, 히드라바민, 이소프로필아민, 리신, 메틸글루카민, 모르폴린, 피페라진, 피페리딘, 폴리아민 수지, 프로카인, 퓨린, 테오브로민, 트리에틸아민, 트리메틸아민, 트리프로필아민, 트로메타민 등을 포함한다. 본 발명의 화합물이 비교적 염기성인 작용기를 포함하는 경우, 그러한 화합물의 중성 형태를 용매 없이 또는 적합한 불활성 용매 중에서 충분한 양의 원하는 산과 접촉시켜 산 부가염이 수득될 수 있다. 약제학적으로 허용되는 산 부가염의 예는 염산, 브롬화수소산, 질산, 탄산, 일수소탄산, 인산, 일수소인산, 이수소인산, 황산, 일수소황산, 요오드화수소산, 또는 아인산 등과 같은 무기산으로부터 유도된 것, 및 아세트산, 프로피온산, 이소부티르산, 말론산, 벤조산, 석신산, 수베르산, 푸마르산, 만델산, 프탈산, 벤젠설폰산, p-톨릴설폰산, 시트르산, 타르타르산, 메탄설폰산 등과 같은 비교적 비독성인 유기산으로부

터 유도된 염을 포함한다. 아르지네이트 등과 같은 아미노산의 염 및 글루쿠론산 또는 갈락투노르산 등과 같은 유기산의 염이 또한 포함된다 (예를 들어 전체가 본원에 참조로 포함되는 Berge, S. M., et al., "Pharmaceutical Salts", Journal of Pharmaceutical Science, 1977, 66, 1-19를 참조하라. 본 발명의 특정 화합물은 화합물이 염기 또는 산 부가 염으로 전환될 수 있게 하는 염기 또는 산 작용기를 모두 포함한다.

[0345] 화합물의 중성 형태는 바람직하게는 염을 염기 또는 산과 접촉시키고 모 화합물을 통상적인 방식으로 분리하여 재생될 수 있다. 화합물의 모 형태는 극성 용매에서의 용해도와 같은 특정한 물리적 특성에 있어서 다양한 염 형태와 상이하지만, 그 외에는 염이 본 발명의 목적을 위해 화합물의 모 형태와 동등하다.

[0346] 염 형태 이외에도, 본 발명은 전구약물 형태인 화합물을 제공한다. 본원에서 사용된 용어 "전구약물"은 생리학적 조건하에 쉽게 화학적 변화를 거쳐 본 발명의 화합물을 제공하는 화합물을 지칭한다. 또한, 전구약물은 생체외 환경에서 화학적 또는 생화학적 방법에 의해 본 발명의 화합물로 전환될 수 있다. 예를 들어, 전구약물은 적합한 효소 또는 화학 시약과 함께 경피 패치 저장소에 배치될 때 본 발명의 화합물로 천천히 전환될 수 있다.

[0347] 본 발명의 전구약물은 아미노산 잔기 또는 두 개 이상(예를 들어, 두 개, 세 개 또는 네 개)의 아미노산 잔기의 폴리펩티드 사슬이 본 발명의 화합물의 유리 아미노, 히드록시 또는 카르복실산 기에 대한 아미드 또는 에스테르 결합을 통해 공유 결합된 화합물을 포함한다. 아미노산 잔기는 일반적으로 3 문자 기호로 지정되는 20 개의 천연 발생 아미노산을 포함하지만 이에 제한되지 않고 포스포세린, 포스포트레오닌, 포스포티로신, 4-히드록시프롤린, 히드록실리신, 데모신, 이소데모신, 감마-카르복시글루타메이트, 히푸르산, 옥타히드로인돌-2-카르복실산, 스타틴, 1,2,3,4-테트라히드로이소퀴놀린-3-카르복실산, 페니실라민, 오르니틴, 3-메틸히스티딘, 노르발린, 베타-알라닌, 감마-아미노부티르산, 시트룰린, 호모시스테인, 호모세린, 메틸-알라닌, 파라-벤조일페닐알라닌, 페닐글리신, 프로파길글리신, 사르코신, 메티오닌 설폰 및 tert-부틸글리신을 또한 포함한다.

[0348] 추가적인 유형의 전구약물도 포함된다. 예를 들어, 본 발명의 화합물의 유리 카르복실 기는 아미드 또는 알킬 에스테르로서 유도체화될 수 있다. 또 다른 예로서, 유리 히드록시 기를 포함하는 본 발명의 화합물은 그 전체가 본원에 참조로 포함되는 Fleisher, D. et al., (1996) Improved oral drug delivery: solubility limitations overcome by the use of prodrugs Advanced Drug Delivery Reviews, 19:115에 약술된 바와 같이, 제한되는 것은 아니지만 포스페이트 에스테르, 헤미석시네이트, 디메틸아미노아세테이트 또는 포스포릴옥시메틸옥시카르보닐 기와 같은 기로 히드록시 기를 전환시킴으로써 전구약물로서 유도체화될 수 있다. 히드록시 및 아미노 기의 카르바메이트 전구약물이 히드록시 기의 카르보네이트 전구약물, 설포네이트 에스테르 및 설페이트 에스테르로서 또한 포함된다. (아실옥시)메틸 및 (아실옥시)에틸 에테르로서 히드록시 기의 유도체화(여기서 아실 기는 에테르, 아민 및 카르복실산 작용기를 포함하지만 이에 제한되지 않는 기로 선택적으로 치환된 알킬 에스테르일 수 있거나, 아실 기는 위에 기재된 바와 같은 아미노산 에스테르임)가 또한 포함된다. 이러한 유형의 전구약물은 그 전체가 본원에 참조로 포함된 J. Med. Chem., (1996), 39:10에 설명된다. 더욱 구체적인 예는 알코올 기의 수소 원자를 (C_{1-6})알카노일옥시메틸, 1-((C_{1-6})알카노일옥시)에틸, 1-메틸-1-((C_{1-6})알카노일옥시)에틸, (C_{1-6})알콕시카르보닐옥시메틸, N-(C_{1-6})알콕시카르보닐아미노메틸, 석시노일, (C_{1-6})알카노일, 알파-아미노(C_{1-4})알카노일, 아릴아실 및 알파-아미노아실, 또는 알파-아미노아실-알파-아미노아실과 같은 기로 대체하는 것을 포함하고, 여기서 각 알파-아미노아실 기는 천연 발생 L-아미노산, $P(O)(OH)_2$, $-P(O)(O(C_{1-6})알킬)_2$ 또는 글리코실(탄수화물의 헤미아세탈 형태의 히드록실 기의 제거로부터 생성된 라디칼)로부터 독립적으로 선택된다.

[0349] 전구약물 유도체의 추가 예에 대해, 예를 들어, 각각 본원에 참조로 구체적으로 포함되는, a) Design of Prodrugs, edited by H. Bundgaard, (Elsevier, 1985) and Methods in Enzymology, Vol. 42, p. 309-396, edited by K. Widder, et al. (Academic Press, 1985); b) A Textbook of Drug Design and Development, edited by Krogsgaard-Larsen and H. Bundgaard, Chapter 5 "Design and Application of Prodrugs," by H. Bundgaard p. 113-191 (1991); c) H. Bundgaard, Advanced Drug Delivery Reviews, 8:1-38 (1992); d) H. Bundgaard, et al., Journal of Pharmaceutical Sciences, 77:285 (1988); 및 e) N. Kakeya, et al., Chem. Pharm. Bull., 32:692 (1984)를 참조하라.

[0350] 추가적으로, 본 발명은 본 발명의 화합물의 대사산물을 제공한다. 본원에서 사용된 "대사산물"은 명시된 화합물 또는 이의 염의 신체에서의 대사를 통해 생성된 생성물을 지칭한다. 이러한 생성물은 예를 들어 투여된 화합물의 산화, 환원, 가수분해, 아미드화, 탈아미드화, 에스테르화, 탈에스테르화, 효소적 절단 등으로부터 생성될 수 있다.

[0351] 대사 생성물은 전형적으로 본 발명의 화합물의 방사성표지된(예를 들어, ^{14}C 또는 ^{3}H) 동위원소를 제조하고, 이를 검출 가능한 용량(예를 들어 약 0.5 mg/kg 초과)으로 래트, 마우스, 기니피그, 원숭이와 같은 동물 또는 사람에게 비경구로 투여하고, 대사가 발생하기에 충분한 시간(전형적으로 약 30 초 내지 30 시간)을 허용하고, 소변, 혈액 또는 기타 생물학적 샘플로부터 이의 전환 생성물을 분리함으로써 확인된다. 이러한 생성물은 표지되어 있기 때문이 쉽게 분리된다 (다른 생성물은 대사산물 내에 생존하는 에피토프를 결합시킬 수 있는 항체의 사용에 의해 분리된다). 대사산물 구조는 종래의 방식으로, 예를 들어 MS, LC/MS 또는 NMR 분석에 의해 결정된다. 일반적으로, 대사산물의 분석은 당업자에게 공지된 종래의 약물 대사 연구와 동일한 방식으로 수행된다. 대사 생성물은, 생체내에서 달리 발견되지 않는 한, 본 발명의 화합물의 치료적 투여를 위한 진단 분석에 유용하다.

[0352] 본원에서 사용된 용어 "알킬"은 한 개 내지 열두 개의 탄소 원자(C_1-C_{12})의 임의의 길이의 포화 직쇄 또는 분지쇄 1가 탄화수소 라디칼을 지칭하고, 여기서 알킬 라디칼은 선택적으로 본원에 기재된 하나 이상의 치환기로 독립적으로 치환될 수 있다. 구현예에서, 알킬 라디칼은 한 개 내지 여덟 개의 탄소 원자(C_{1-8}), 또는 한 개 내지 여섯 개의 탄소 원자(C_{1-6}), 또는 한 개 내지 네 개의 탄소 원자(C_{1-4}), 또는 한 개 내지 세 개의 탄소 원자(C_{1-3})이다. 알킬 기의 예는 메틸(Me, $-CH_3$), 에틸(Et, $-CH_2CH_3$), 1-프로필(n-Pr, n-프로필, $-CH_2CH_2CH_3$), 2-프로필(i-Pr, i-프로필, 이소프로필, $-CH(CH_3)_2$), 1-부틸(n-Bu, n-부틸, $-CH_2CH_2CH_2CH_3$), 2-메틸-1-프로필(i-Bu, i-부틸, $-CH_2CH(CH_3)_2$), 2-부틸(s-Bu, s-부틸, $-CH(CH_3)CH_2CH_3$), 2-메틸-2-프로필(t-Bu, t-부틸, tert-부틸, $-C(CH_3)_3$), 1-펜틸(n-펜틸, $-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$), 2-펜틸($-CH(CH_3)CH_2CH_2CH_3$), 3-펜틸($-CH(CH_2CH_3)_2$), 2-메틸-2-부틸($-C(CH_3)_2CH_2CH_3$), 3-메틸-2-부틸($-CH(CH_3)CH(CH_3)_2$), 3-메틸-1-부틸($-CH_2CH_2CH(CH_3)_2$), 2-메틸-1-부틸($-CH_2CH(CH_3)CH_2CH_3$), 1-헥실($-CH_2CH_2CH_2CH_2CH_2CH_3$), 2-헥실($-CH(CH_3)CH_2CH_2CH_2CH_3$), 3-헥실($-CH(CH_2CH_3)(CH_2CH_2CH_3)$), 2-메틸-2-펜틸($-C(CH_3)_2CH_2CH_2CH_3$), 3-메틸-2-펜틸($-CH(CH_3)CH(CH_3)CH_2CH_3$), 4-메틸-2-펜틸($-CH(CH_3)CH_2CH(CH_3)_2$), 3-메틸-3-펜틸($-C(CH_3)(CH_2CH_3)_2$), 2-메틸-3-펜틸($-CH(CH_2CH_3)CH(CH_3)_2$), 2,3-디메틸-2-부틸($-C(CH_3)_2CH(CH_3)_2$), 3,3-디메틸-2-부틸($-CH(CH_3)C(CH_3)_3$, 1-헵틸, 1-옥틸 등을 포함하지만 이에 제한되지 않는다.

[0353] 용어 "카르보사이클", "카르보시클릴", "카르보시클릭 고리" 및 "시클로알킬"은 모노시클릭 고리로서 3 내지 12 개의 탄소 원자(C_{3-12})를 갖거나 비시클릭 고리로서 7 내지 12 개의 탄소 원자를 갖는 1가 비방향족, 포화 또는 부분적 불포화 고리를 지칭한다. 일부 비제한적 구현예에서, 시클로알킬은 3 개 내재 10 개의 탄소 원자, 3 개 내지 8 개의 탄소 원자, 3 개 내지 6 개의 탄소 원자, 3 개 내지 5 개의 탄소 원자, 4 개 내지 6 개의 탄소 원자, 또는 4 개 내지 5 개의 탄소 원자를 갖는다. 7 내지 12 개의 원자를 갖는 비시클릭 카보사이클은, 예를 들어, 비시클로 [4,5], [5,5], [5,6] 또는 [6,6] 시스템으로서 배열될 수 있고, 9 또는 10 개의 고리 원자를 갖는 비시클릭 카르보사이클은 비시클로 [5,6] 또는 [6,6] 시스템으로서 또는 비시클로[2.2.1]헵탄, 비시클로[2.2.2]옥탄 및 비시클로[3.2.2]노난과 같은 다리걸친 시스템으로서 배열될 수 있다. 스피로 모이어티가 또한 상기 정의 범위 내에 포함된다. 본원에 정의된 바와 같이, 카르보시클릴 기는 분자의 나머지에 대한 폴리시클릭 고리 시스템의 부착점에 관계없이, 폴리시클릭 고리 시스템 내의 다른 고리 모이어티 중 하나 이상이 방향족일지라도 폴리시클릭 고리 시스템 내의 고리 모이어티 중 하나 이상이 비방향족인 임의의 폴리시클릭 고리 시스템을 포함한다. 모노시클릭 카르보사이클의 예는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 1-시클로펜트-1-에닐, 1-시클로펜트-2-에닐, 1-시클로펜트-3-에닐, 시클로헥실, 1-시클로헥스-1-에닐, 1-시클로헥스-2-에닐, 1-시클로헥스-3-에닐, 시클로헥사디에닐, 시클로헵틸, 시클로옥틸, 시클로노닐, 시클로데실, 시클로운데실, 시클로도데실, 인다닐, 1,2,3,4,-테트라히드로나프틸 등을 포함하지만 이에 제한되지 않는다. 카르보시클릴 기는 선택적으로, 본원에 기재된 하나 이상의 치환기로 독립적으로 치환된다.

[0354] "아릴"은 모 방향족 고리 시스템의 단일 탄소 원자로부터 하나의 수소 원자를 제거하여 유도된 6-20 개의 탄소 원자(C_{6-20})의 1가 방향족 탄화수소 라디칼을 의미한다. 일부 아릴 기는 예시적인 구조에서 "Ar"로 표시된다. 전형적인 아릴 기는 벤젠(페닐), 치환된 벤젠, 나프탈렌, 안트라센, 비페닐, 인데닐 등으로부터 유도된 라디칼을 포함하지만 이에 제한되지 않는다. 아릴 기는 선택적으로, 본원에 기재된 한 개 이상의 치환기로 독립적으로 치환된다.

[0355] 용어 "헤테로사이클," "헤테로시클릴" 및 "헤테로시클릭 고리"는 본원에서 상호교환적으로 사용되며, 적어도 하나의 고리 원자가 질소, 산소, 인 및 황으로부터 선택된 헤테로원자이고, 나머지 고리 원자가 C인 약 3 내지 약 20 개의 고리 원자의 비방향족, 포화 또는 부분적 불포화 카르보시클릭 라디칼을 지칭하고, 여기서 하나 이상의

고리 원자는 선택적으로 본원에 기재된 하나 이상의 치환기로 독립적으로 치환된다. 본원에 정의된 바와 같이, 헤테로시클릴 기는 분자의 나머지에 대한 폴리시클릭 고리 시스템의 부착점에 관계없이, 폴리시클릭 고리 시스템 내의 다른 고리 모이어티 중 하나 이상이 방향족일지라도 폴리시클릭 고리 시스템 내의 고리 모이어티 중 하나 이상이 비방향족인 임의의 폴리시클릭 고리 시스템을 포함한다. 일부 비제한적 구현예에서, 헤테로시클릴은 3 개 내지 15 개의 고리 원자, 3 개 내지 12 개의 고리 원자, 3 개 내지 10 개의 고리 원자, 3 개 내지 8 개의 고리 원자, 3 개 내지 6 개의 고리 원자, 4 개 내지 6 개의 고리 원자, 또는 5 개 내지 6 개의 고리 원자를 갖는다. 헤테로사이클은 모노사이클 또는 적어도 두 개의 고리가 두 개의 단일 원자(비시클릭) 또는 단일 원자(스피로시클릭 또는 스피로)를 공유하는 폴리시클릭 고리 시스템일 수 있다. 모노시클릭 헤테로사이클은 3 내지 8 개의 고리 구성원(2 내지 7 개의 탄소 원자 및 N, O, P 및 S로부터 선택된 1 내지 4 개의 헤테로원자)을 가질 수 있다. 비사이클 또는 스피로 모이어티와 같은 폴리시클릭 헤테로사이클은 7 내지 12 개의 고리 구성원(4 내지 9 개의 탄소 원자 및 N, O, P 및 S로부터 선택된 1 내지 6 개의 헤테로원자)을 가질 수 있다. 7 내지 12 개의 원자를 갖는 비시클릭 헤테로사이클은 예를 들어 비시클로 [4,5], [5,5], [5,6] 또는 [6,6] 시스템으로 배열될 수 있고, 9 또는 10 개의 고리 원자를 갖는 비시클릭 헤테로사이클은 비시클로 [5,6] 또는 [6,6] 시스템으로, 또는 아자비시클로[2.2.1]헵탄, 아자비시클로[2.2.2]옥탄 및 아자비시클로[3.2.2]노난과 같은 다리걸친 시스템으로 배열될 수 있다. 헤테로사이클은 각각 본원에 그 전체가 참조로 포함되는 Paquette, Leo A.; "Principles of Modern Heterocyclic Chemistry" (W.A. Benjamin, New York, 1968), 특히 Chapters 1, 3, 4, 6, 7, 및 9; "The Chemistry of Heterocyclic Compounds, A series of Monographs" (John Wiley & Sons, New York, 1950 to present), 특히 Volumes 13, 14, 16, 19, 및 28; 및 J. Am. Chem. Soc. (1960) 82:5566에 기재된다.

[0356] 헤테로시클릭 고리의 예는 모르폴린-4-일, 피페리딘-1-일, 피페라지닐, 피페라진-4-일-2-온, 피페라진-4-일-3-온, 피롤리딘-1-일, 티오모르폴린-4-일, S-디옥소티오모르폴린-4-일, 아조칸-1-일, 아제티딘-1-일, 옥타하이드로피리도[1,2-a]피라진-2-일, [1,4]디아제판-1-일, 피롤리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 디하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 테트라하이드로피라닐, 디하이드로피라닐, 테트라하이드로티오피라닐, 피페리디노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 티옥사닐, 피페라지닐, 호모피페라지닐, 아제티디닐, 옥세타닐, 티에타닐, 호모피페리디닐, 옥세파닐, 티에파닐, 옥사제피닐, 디아제피닐, 티아제피닐, 2-피롤리닐, 3-피롤리닐, 인돌리닐, 2H-피라닐, 4H-피라닐, 디옥사닐, 1,3-디옥솔라닐, 피라졸리닐, 디티아닐, 디티올라닐, 디하이드로피라닐, 디하이드로티에닐, 디하이드로푸라닐, 피라졸리디닐이미다졸리닐, 이미다졸리디닐, 3-아자바이사이코[3.1.0]헥사닐, 3-아자바이사이클로[4.1.0]헵타닐, 아자바이사이클로[2.2.2]헥사닐, 3H-인돌릴 퀴놀리지닐 및 N-피리딜 우레아를 포함하지만 이에 제한되지 않는다. 2개 고리 원자가 옥소(=O) 모이어티로 치환된 헤테로시클릭 기의 예는 피리미디노닐 및 1,1-디옥소-티오모르폴리닐이다. 본원의 헤테로사이클 기는 선택적으로 본원에 기재된 하나 이상의 치환기로 독립적으로 치환된다.

[0357] 용어 "헤테로아릴"은 5-, 6- 또는 7-원 고리의 1가 방향족 라디칼을 지칭하고, 질소, 산소 및 황으로부터 독립적으로 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 포함하는 5-20 원자의 접합 고리 시스템을 포함한다. 일부 비제한적 구현예에서, 헤테로아릴은 5 내지 18 개의 고리 원자, 5 내지 12 개의 고리 원자, 5 내지 10 개의 고리 원자, 5 내지 8 개의 고리 원자, 또는 5 내지 6 개의 고리 원자를 갖는다. 헤테로아릴 기의 예는 피리디닐(예를 들어 2-히드록시피리디닐 포함), 이미다졸릴, 이미다조피리디닐, 1-메틸-1H-벤조[d]이미다졸, [1,2,4]트리아졸로[1,5-a]피리딘, 피리미디닐(예를 들어 4-히드록시피리미디닐 포함), 피라졸릴, 트리아졸릴, 피라지닐, 테트라졸릴, 푸릴, 티에닐, 이속사졸릴, 티아졸릴, 옥사디아졸릴, 옥사졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 퀴놀리닐, 이소퀴놀리닐, 테트라히드로이소퀴놀리닐, 인돌릴, 벤즈이미다졸릴, 벤조푸라닐, 신놀리닐, 인다졸릴, 인돌리지닐, 프탈라지닐, 피리다지닐, 트리아지닐, 이소인돌릴, 프테리디닐, 푸리닐, 옥사디아졸릴, 티아디아졸릴, 티아디아졸릴, 푸라자닐, 벤조푸라자닐, 벤조티아졸릴, 벤족사졸릴, 퀴나졸리닐, 퀴녹살리닐 등이다. 헤테로아릴 기는 선택적으로 본원에 기재된 하나 이상의 치환기로 독립적으로 치환된다.

[0358] 헤테로사이클 또는 헤테로아릴 기는 가능한 경우 탄소(탄소 연결) 또는 질소(질소 연결) 결합될 수 있다. 제한이 아닌 예로서, 탄소 결합된 헤테로사이클 또는 헤테로아릴은 피리딘의 위치 2, 3, 4, 5, 또는 6, 피리다진의 위치 3, 4, 5, 또는 6, 피리미딘의 위치 2, 4, 5, 또는 6, 피라진의 위치 2, 3, 5, 또는 6, 푸란, 테트라하이드로푸란, 티오푸란, 티오펜, 피롤 또는 테트라하이드로피롤의 위치 2, 3, 4, 또는 5, 옥사졸, 이미다졸 또는 티아졸의 위치 2, 4, 또는 5, 이속사졸, 피라졸, 또는 이소티아졸의 위치 3, 4, 또는 5, 아지리딘의 위치 2 또는 3, 아제티딘의 위치 2, 3, 또는 4, 퀴놀린의 위치 2, 3, 4, 5, 6, 7, 또는 8 또는 이소퀴놀린의 위치 1, 3, 4, 5, 6, 7, 또는 8에서 결합된다.

[0359] 제한이 아닌 예로서, 질소 결합된 헤테로사이클 또는 헤테로아릴은 아지리딘, 아제티딘, 피롤, 피롤리딘, 2-피롤린, 3-피롤린, 이미다졸, 이미다졸리딘, 2-이미다졸린, 3-이미다졸린, 피라졸, 피라졸린, 2-피라졸린, 3-피라졸린, 피페리딘, 피페라진, 인돌, 인돌린, 1H-인다졸의 위치 1, 이소인돌, 또는 이소인돌린의 위치 2, 모르폴린의 위치 4, 및 카르바졸 또는 β-카르볼린의 위치 9에서 결합된다.

[0360] 용어 "알콕시"는 -O-알킬을 지칭한다. 한 변형에서, "메톡시"는 -O-CH_3을 지칭한다.

[0361] 용어 "히드록시"는 -OH를 지칭한다.

[0362] 용어 "시아노"는 -CN을 지칭한다

[0363] 용어 "옥소"는 =O를 지칭한다.

[0364] 용어 "할로"는 주기율표의 VIIA 족을 차지하는 원자를 지칭하고 플루오린(플루오로), 염소(클로로), 브로민(브로모) 및 아이오딘(아이오도)을 포함한다.

[0365] 용어 "t-부틸" 또는 "tBu"는 tert-부틸을 지칭한다

[0366] 용어 "키랄"은 거울상 파트너의 비중첩성 특성을 갖는 분자를 지칭하는 한편, 용어 "아키랄"은 거울상 파트너에 중첩 가능한 분자를 지칭한다.

[0367] 용어 "입체이성질체"는 동일한 화학적 구성을 갖지만 공간내 원자 또는 기의 배열에 있어서 상이한 화합물을 지칭한다.

[0368] "부분입체이성질체"는 둘 이상의 키랄성 중심을 갖고 분자가 서로 거울상이 아닌 입체이성질체를 지칭한다. 부분입체이성질체는 상이한 물리적 특성, 예를 들어 녹는점, 끓는점, 스펙트럼 특성 및 반응성을 갖는다. 부분입체이성질체의 혼합물은 전기영동 및 크로마토그래피와 같은 고해상도 분석적 절차하에 분리될 수 있다.

[0369] "거울상이성질체"는 서로 중첩 불가능한 거울상인 화합물의 두 입체이성질체를 지칭한다.

[0370] 본원에 사용된 입체화학적 정의 및 규약은 일반적으로 각각 그 전체가 본원에 참조로 포함되는 S. P. Parker, Ed., McGraw-Hill Dictionary of Chemical Terms (1984) McGraw-Hill Book Company, New York; 및 Eliel, E. and Wilen, S., Stereochemistry of Organic Compounds (1994) John Wiley & Sons, Inc., New York을 따른다. 많은 유기 화합물이 광학 활성 형태로 존재한다. 즉 평면 편광의 평면을 회전시키는 능력을 갖는다. 광학 활성 화합물 기재에서, 접두사 D 및 L, 또는 R 및 S는 키랄 중심(들)에 대한 분자의 절대 배열을 나타내기 위해 사용된다. 접두사 d 및 l 또는 (+) 및 (-)는 화합물에 의한 평면 편광의 회전 기호를 지정하는 데 사용되며, (-) 또는 l은 화합물이 좌선성임을 의미한다. (+) 또는 d의 접두사를 갖는 화합물은 우선성이다. 주어진 화학 구조에 대해, 이들 입체이성질체는 서로 거울상임을 제외하고 동일하다. 특정 입체이성질체는 거울상이성질체로도 지칭될 수 있으며, 그러한 이성질체의 혼합물은 흔히 거울상이성질체 혼합물로 불린다. 거울상이성질체의 50:50 혼합물은 라세미 혼합물 또는 라세미체로 지칭되며, 이는 화학 반응 또는 공정에서 입체선택성 또는 입체특이성이 없는 경우에 발생할 수 있다. 용어 "라세미 혼합물" 및 "라세미체"는 광학 활성이 없는, 두 거울상이성질체 종의 등몰 혼합물을 지칭한다.

[0371] 용어 "병용 투여" 및 "병용 투여하는" 또는 "병용 요법"은 치료제가 환자에게 어느 정도, 바람직하게는 유효량으로 동시에 존재하는 한 동시 투여(동시에 둘 이상의 치료제의 투여) 및 시간 가변 투여(추가 치료제 또는 제제의 투여와 상이한 시간에 하나 이상의 치료제의 투여) 모두를 지칭한다. 특정한 바람직한 양태에서, 본원에 기재된 화합물 중 하나 이상은 특히 항암제를 포함하는 적어도 하나의 추가 생물활성제와 조합으로 병용 투여된다. 특히 바람직한 양태에서, 화합물의 병용 투여는 항암 활성을 포함하는 상승적 활성 및/또는 요법을 야기한다.

[0372] 본원에서 사용된 용어 "화합물"은, 달리 지시되지 않는 한, 본원에 개시된 임의의 특정 화합물을 지칭하고 호변이성질체, 위치이성질체, 기하 이성질체 및 적용 가능한 경우, 이의 광학 이성질체(거울상이성질체) 및 다른 입체이성질체(부분입체이성질체)를 포함하는 입체이성질체, 그뿐만 아니라 문맥에서 적용 가능한 경우 이의 약제학적으로 허용되는 염 및 유도체(전구약물 형태 포함)를 포함한다. 문맥상의 사용 내에서, 용어 화합물은 일반적으로 단일 화합물을 지칭하지만, 다른 화합물, 예컨대 입체이성질체, 위치이성질체 및/또는 광학 이성질체(라세미 혼합물 포함)뿐만 아니라 개시된 화합물의 특정 거울상이성질체 또는 거울상이성질체적으로 풍부한 혼합물을 또한 포함할 수 있다. 이 용어는 또한, 문맥상, 활성 부위로의 화합물의 투여 및 전달을 용이하게 하기 위해 변형된 화합물의 전구약물 형태를 지칭한다. 본 화합물을 기재함에 있어서, 특히, 이와 연관된 다수의 치환기

및 변수가 기재된다는 것에 유념한다. 본원에 기재된 분자는 일반적으로 하기 기재된 바와 같은 안정한 화합물이라는 것이 당업자에 의해 이해된다. 결합 이 도시된 경우, 이중 결합 및 단일 결합 둘 모두가 도시된 화합물의 맥락 내에서 표현된다.

[0373] 본원에서 사용된 바와 같이 화학 구조에서 결합과 교차하는 물결선 "〰"은 물결 결합이 화학 구조에서 분자의 나머지, 또는 분자 단편의 나머지에 연결된 원자의 부착점을 나타낸다.

[0374] 본원에 개시된 특정 구현예에서, 특정 기(예를 들어 페닐 또는 헤테로아릴)는 "치환된" 것으로 기재된다. 이러한 일부 구현예에서, "치환된" 기는 본원에 나타난 바와 같이 1, 2, 3, 4, 5 개 또는 더 많은 치환기로 치환될 수 있다. 특정 구현예에서, 특정 기는 알킬, 알케닐, 알키닐, 시클로알킬, 헤테로시클릴, 아릴, 헤테로아릴, 할로(즉 할로겐), 할로알킬, 옥소, -OH, CN, -O-알킬, S-알킬, NH-알킬, N(알킬)$_2$, O-시클로알킬, S-시클로알킬, NH-시클로알킬, N(시클로알킬)$_2$, N(시클로알킬)(알킬), NH_2, SH, SO_2-알킬, P(O)(O-알킬)(알킬), P(O)(O-알킬)$_2$, $Si(OH)_3$, Si(알킬)$_3$, Si(OH)(알킬)$_2$, CO-알킬, CO_2H, NO_2, SF_5, SO_2NH-알킬, SO_2N(알킬)$_2$, SONH-알킬, SON(알킬)$_2$, CONH-알킬, CON(알킬)$_2$, N(알킬)CONH(알킬), N(알킬)CON(알킬)$_2$, NHCONH(알킬), NHCON(알킬)$_2$, $NHCONH_2$, N(알킬)SO_2NH(알킬), N(알킬) SO_2N(알킬)$_2$, $NHSO_2$NH(알킬), $NHSO_2$N(알킬)$_2$ 및 $NHSO_2NH_2$로부터 독립적으로 선택되지만 이에 제한되지는 않는 하나 이상의 치환기로 치환될 수 있다.

[0375] 여전히 추가적인 정의 및 약어가 본원의 다른 곳에 제공된다.

[0376] 값들의 범위가 제공되는 경우, 그 범위의 상한 및 하한 사이에, 문맥이 명확하게 달리 지시하지 않는 한, 각각의 개재 값이 하한 단위의 10분의 1까지(예컨대, 그 범위 내에 속하는 각각의 탄소 원자 수가 제공되는 경우에 탄소 원자들의 수를 함유하는 기의 경우에서와 같이) 그리고 명시된 범위에 있는 다른 명시된 값 또는 개재 값이 본 개시 내에 포함되는 것으로 이해된다. 이들 더 작은 범위의 상한 및 하한은 독립적으로 더 작은 범위에 포함될 수 있고 또한 명시된 범위에서 임의의 구체적으로 배제된 한계에 따라 본 개시에 포함된다. 명시된 범위가 한계 중 하나 또는 둘 모두를 포함하는 경우에, 포함된 한계 중 하나 또는 둘 모두를 제외하는 범위가 또한 본 개시에 포함된다.

[0377] 본 명세서 및 첨부된 청구범위에서 사용된 관사 "a" 및 "an"은 문맥에서 달리 명시되지 않는 한 관사의 문법적 대상 중 하나 또는 하나 초과(즉 적어도 하나)를 지칭하기 위해 사용된다. 예로서, "요소"는 하나의 요소 또는 하나 초과의 요소를 의미한다.

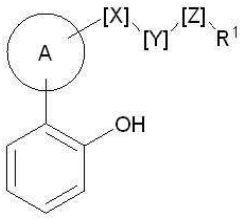
[0378] 청구항뿐만 아니라 상기 명세서에서, "포함하는(comprising)", "포함하는(including)", "보유하는(carrying)", "갖는(having)", "함유하는(containing)", "수반하는(involving)", "유지하는(holding)", "구성되는(composed of)" 등과 같은 전이구는 개방형, 즉 포함하지만 제한되지 않음을 의미하는 것으로 이해되어야 한다. 전이구 "구성되는(consisting of)" 및 "본질적으로 구성되는(consisting essentially of)"만이 미국 특허청 특허 심사 절차 매뉴얼, 섹션 2111.03에 제시된 바와 같이 각각 폐쇄형 또는 반폐쇄형 전이구일 것이다.

[0379] 명세서 및 청구범위에서 사용되는 바와 같이, 하나 이상의 요소의 목록과 관련하여 어구 "적어도 하나의"는 요소의 목록 중 어느 하나 이상의 요소로부터 선택된 적어도 하나의 요소를 의미하는 것으로 이해되어야 하지만, 요소의 목록 내에 구체적으로 나열된 각각의 모든 요소 중 적어도 하나를 반드시 포함해야 하는 것은 아니며 요소의 목록 중 요소의 임의의 조합을 배제하는 것도 아니다. 이 정의는 또한 구체적으로 식별된 요소에 대한 관련 여부와 관계없이, 어구 "적어도 하나의"가 지칭하는 요소의 목록 내에서 구체적으로 식별된 요소 이외에, 요소가 선택적으로 존재할 수 있음을 허용한다. 따라서, 비제한적 예로서, "A 및 B 중 적어도 하나"(또는 동등하게, "A 또는 B 중 적어도 하나" 또한 동등하게 "A 및/또는 B 중 적어도 하나")는, 구현예에서, 선택적으로 하나 초과의 A를 포함하고 B가 존재하지 않는 (그리고 선택적으로 B 이외의 요소를 포함함) 적어도 하나를 지칭하고; 다른 구현예에서, 선택적으로 하나 초과의 B를 포함하고 A가 존재하지 않는 (그리고 선택적으로 A 이외의 요소를 포함함) 적어도 하나를 지칭하고; 또 다른 구현예에서, 선택적으로 하나 초과의 A를 포함하여 적어도 하나 및 선택적으로 하나 초과의 B를 포함하여 적어도 하나(그리고 선택적으로 다른 요소를 포함함)를 지칭할 수 있다.

[0380] 또한, 문맥에서 달리 명백하게 지시되지 않는 한, 하나 초과의 단계 또는 행위를 포함하는 본원에 기재된 특정 방법에서, 해당 방법의 단계 또는 행위의 순서는 해당 방법의 단계 또는 행위가 언급된 있는 순서에 반드시 제한되는 것은 아니다.

[0381] II. 화합물

[0382] 한 양태에서, 본 개시는 화학식 (IV')의 화합물:



[0383] (IV'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서:

[0384] 

는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 R^n으로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^n은 $-N(R^x)(R^y)$, -OH, CN, 할로, C_{1-4}알킬 및 C_{1-4}할로알킬로 구성된 군으로부터 선택되고;

[0385] [X]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고;

[0386] [Y]는 부재하거나, C_{3-6}시클로알킬, C_{1-6}알킬렌, C_{2-6}알케닐렌 또는 C_{2-6}알키닐렌이고, 이들 각각은 독립적으로 C_{1-6}알킬 및 할로로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고;

[0387] [Z]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0388] R^1은:

[0389] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0390] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0391] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0392] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0393] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0394] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고,

[0395] 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0396] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0397] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0398] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0399] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 또는

[0400] (b) -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[0401] n은 1-6의 정수이고, 그리고

[0402] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고;

[0403] 여기서

[0404] -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-$(CH_2)_p$-N(R^p)(R^q), -C(O)-R^s, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0405] p는 1-6의 정수이고,

[0406] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

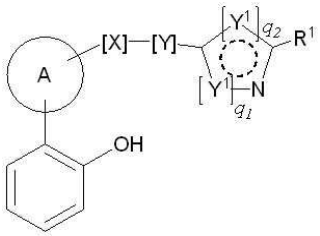
[0407] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0408] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0409] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0410] (c) -C=C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

[0411] 한 양태에서, 본원에서는 화학식 (IV'-L)의 화합물:

[0412] 

(IV'-L), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0413] 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고;

[0414] q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고;

[0415] 

는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 R^n으로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^n은 -N(R^x)(R^y), -OH, CN, 할로, C_{1-4}알킬 및 C_{1-4}할로알킬로 구성된 군으로부터 선택되고;

[0416] [X]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 이들 각각은 독립적으로 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고;

[0417] [Y]는 부재하거나, C_{3-6}시클로알킬, C_{1-6}알킬렌, C_{2-6}알케닐렌 또는 C_{2-6}알키닐렌이고, 이들 각각은 독립적으로 C_{1-6}알킬 및 할로로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환되고;

[0418] [Z]는 부재하거나, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0419] R^1은:

[0420] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0421] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0422] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0423] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0424] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 또는

[0425] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고,

[0426] 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0427] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0428] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0429] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0430] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 또는

[0431] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0432] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0433] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0434] 여기서

[0435] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0436] *p*는 1-6의 정수이고,

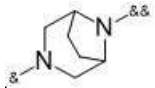
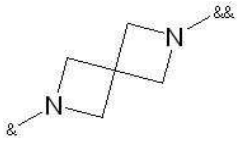
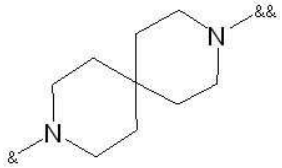
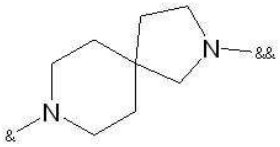
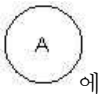
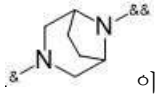
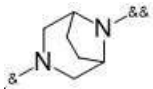
[0437] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0438] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

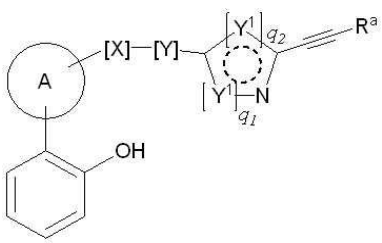
[0439] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0440] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0441] (c) -C=C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

[0442] 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, [X]는 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, [X]는  ,  ,  및  로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서 [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [Y]는 부재한다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 0이고 q_2는 2이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 2이고 q_2는 1이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 1이고 q_2는 1이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 1이고 q_2는 2이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 2이고 q_2는 1이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 0이고 q_2는 3이다. 화학식 (IV'-L)의 일부 구현예에서, q_1은 3이고 q_2는 0이다.

[0443] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-L1)의 화합물:

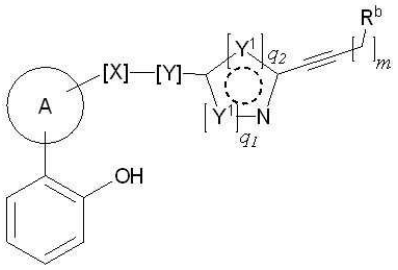


[0444] (IV'-L1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의

의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, 

, [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L1)의 일부 구현예에서, R^a는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다.

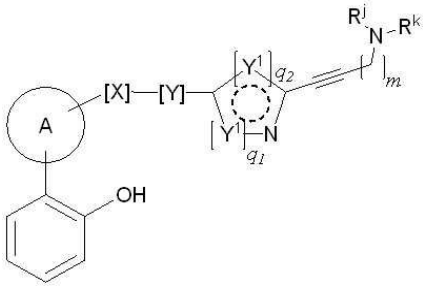
[0445] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-L2)의 화합물:



[0446] (IV'-L2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, m은 1 또는 2이고, 

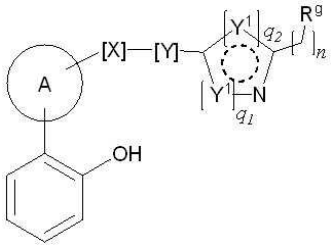
, [X], [Y] 및 R^b는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, m은 1이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, m은 2이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-L2)의 일부 구현예에서, R^b는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다.

[0447] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-L3)의 화합물:



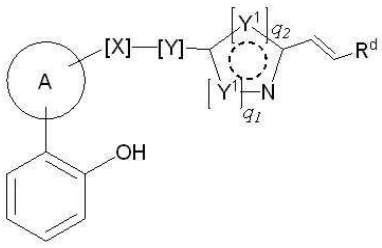
[0448] (IV'-L3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, m은 0, 1 또는 2이고, R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성하고, , [X] 및 [Y]는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-L3)의 일부 구현예에서, m은 0이다. 화학식 (IV'-L3)의 일부 구현예에서, m은 1이다. 화학식 (IV'-L3)의 일부 구현예에서, m은 2이다. 화학식 (IV'-L3)의 일부 구현예에서 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

[0449] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-L4)의 화합물:



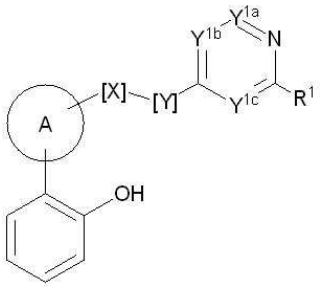
[0450] (IV'-L4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, , [X], [Y], n 및 R^g는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-L4)의 일부 구현예에서, n은 1, 2, 3, 4, 5 또는 6이다. 화학식 (IV'-L4)의 일부 구현예에서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 화학식 (IV'-L4)의 일부 구현예에서, R^g는 -OH이다.

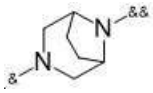
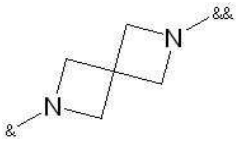
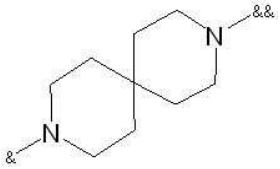
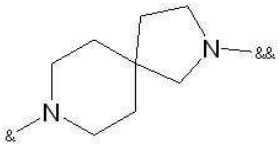
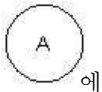
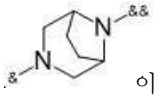
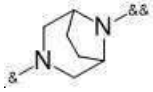
[0451] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-L5)의 화합물:



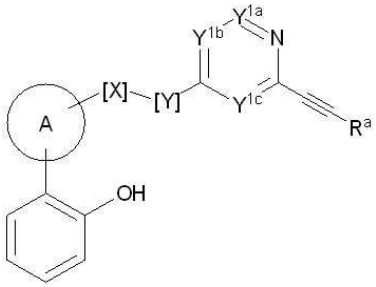
[0452] (IV'-L5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, , [X], [Y] 및 R^d는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0453] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M)의 화합물:



[0454] (IV'-M), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, , [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, [X]는 부재한다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, [X]는 , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 &는 에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서 [X]는 이고, 여기서 &는 에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, [X]는 이고, 여기서 &는 에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [Y]는 부재한다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 N이고, Y^{1b}는 CH이고, Y^{1c}는 CH이다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고, Y^{1b}는 N이고, Y^{1c}는 CH이다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고, Y^{1b}는 CH이고, Y^{1c}는 N이다. 화학식 (IV'-M)의 일부 구현예에서, Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c}는 CH이다.

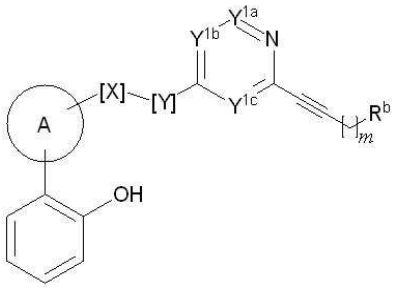
[0455] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M1)의 화합물:



[0456] (IV'-M1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, ,

[X], [Y] 및 R^a는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M1)의 일부 구현예에서, R^a는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다.

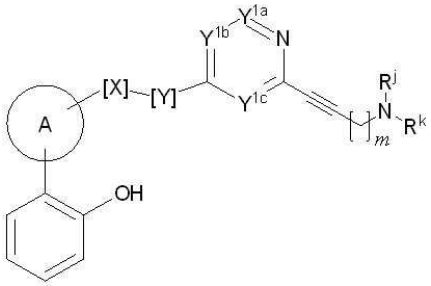
[0457] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M2)의 화합물:



[0458] (IV'-M2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, *m*은 1 또는 2이고, 

, [X], [Y] 및 R^b는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, *m*은 1이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, *m*은 2이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-M2)의 일부 구현예에서, R^b는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다.

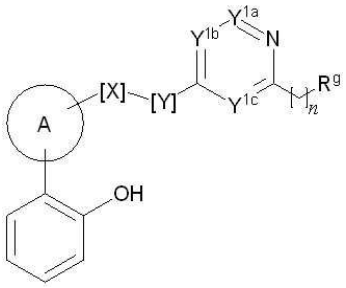
[0459] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M3)의 화합물:



[0460] (IV'-M3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, *m*은 0, 1 또는 2이고, R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성하고, 

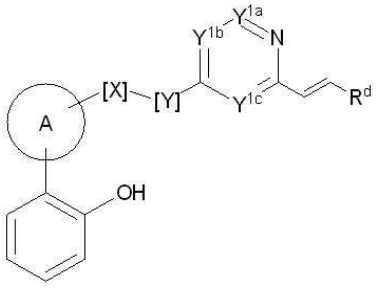
, [X] 및 [Y]는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-M3)의 일부 구현예에서, *m*은 0이다. 화학식 (IV'-M3)의 일부 구현예에서, *m*은 1이다. 화학식 (IV'-M3)의 일부 구현예에서, *m*은 2이다. 화학식 (IV'-M3)의 일부 구현예에서 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

[0461] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M4)의 화합물:



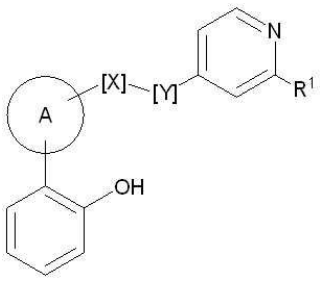
[0462] (IV'-M4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, , [X], [Y], n 및 R^g는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-M4)의 일부 구현예에서, n은 1, 2, 3, 4, 5 또는 6이다. 화학식 (IV'-M4)의 일부 구현예에서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 화학식 (IV'-M4)의 일부 구현예에서, R^g는 -OH이다.

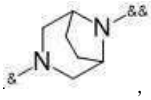
[0463] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-M5)의 화합물:

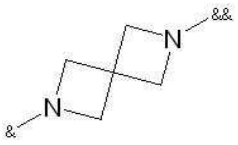
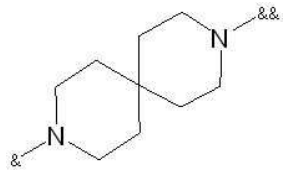
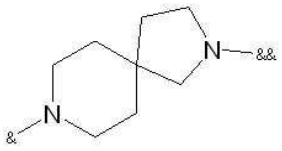


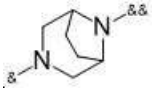
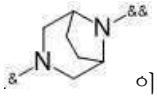
[0464] (IV'-M5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, , [X], [Y] 및 R^d는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0465] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N)의 화합물:

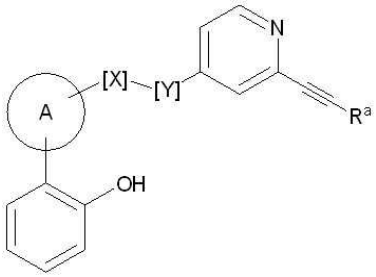


[0466] (IV'-N), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 , [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-N)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (IV'-N)의 일부 구현예에서, [X]는 부재한다. 화학식 (IV'-N)의 일부 구현예에서, [X]는 ,

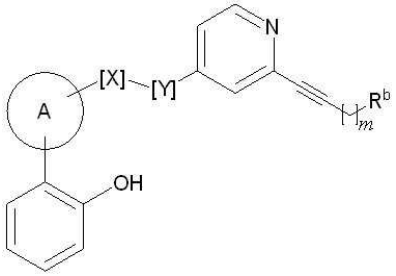
로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-N)의 일부 구현예에서 [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (IV'-N)의 일부 구현예에서, [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [Y]는 부재한다.

[0467] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N1)의 화합물:



[0468] (IV'-N1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서  , [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N1)의 일부 구현예에서, R^a는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다.

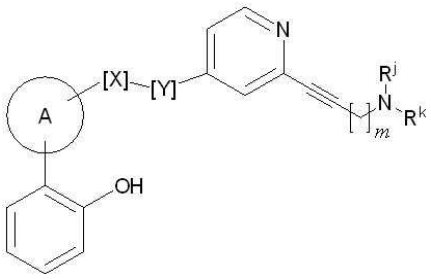
[0469] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N2)의 화합물:



[0470] (IV'-N2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임

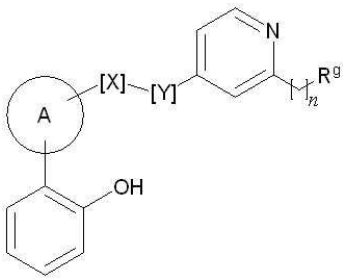
의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 *m*은 1 또는 2이고, , [X], [Y] 및 R^b는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, *m*은 1이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, *m*은 2이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 비시클릭 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 스피로 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 화학식 (IV'-N2)의 일부 구현예에서, R^b는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다.

[0471] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N3)의 화합물:



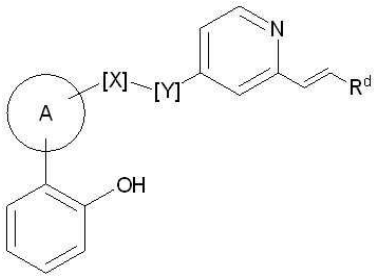
[0472] (IV'-N3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 *m*은 0, 1 또는 2이고, R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성하고, , [X] 및 [Y]는 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-N3)의 일부 구현예에서, *m*은 0이다. 화학식 (IV'-N3)의 일부 구현예에서, *m*은 1이다. 화학식 (IV'-N3)의 일부 구현예에서, *m*은 2이다. 화학식 (IV'-N3)의 일부 구현예에서 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

[0473] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N4)의 화합물:

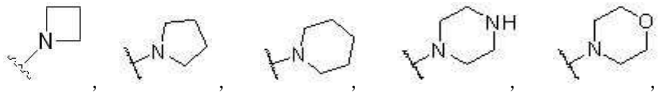
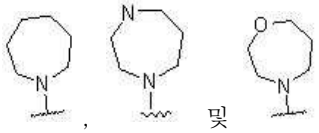
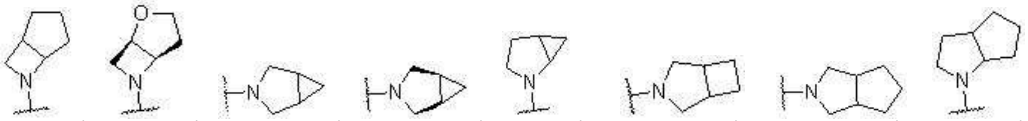
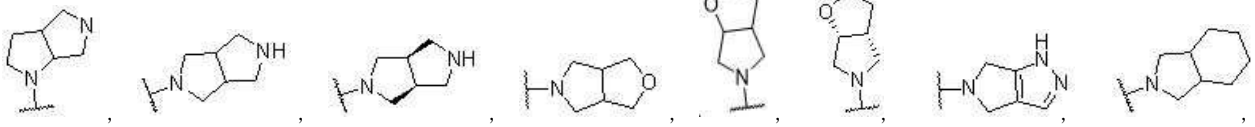
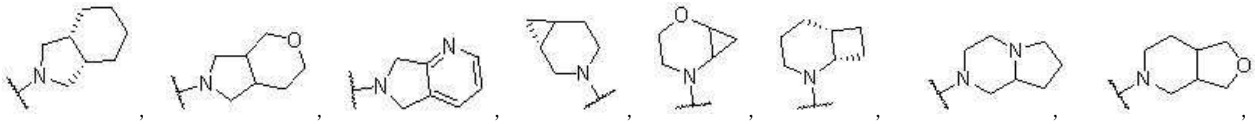
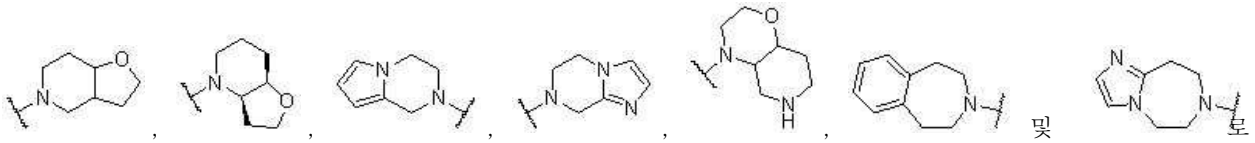
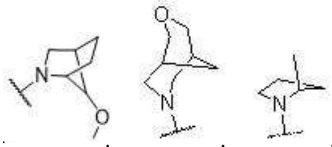
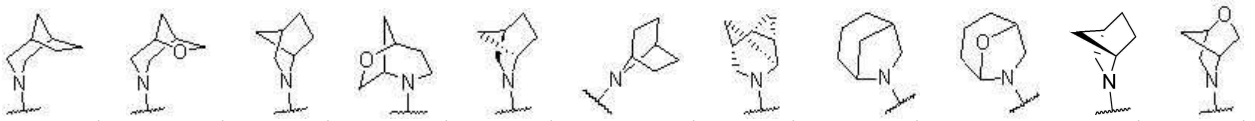


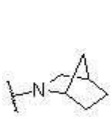
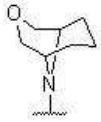
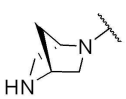
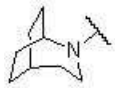
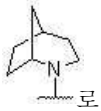
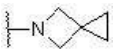
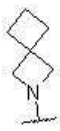
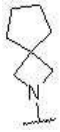
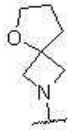
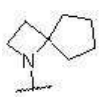
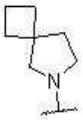
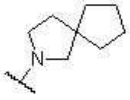
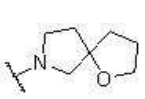
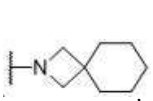
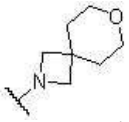
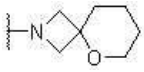
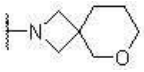
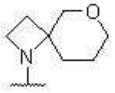
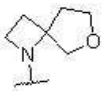
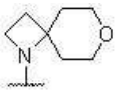
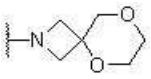
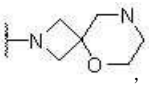
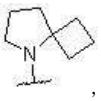
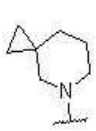
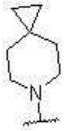
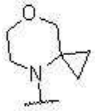
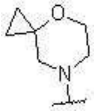
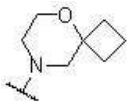
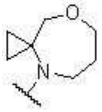
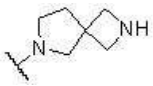
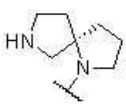
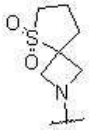
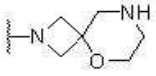
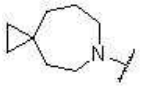
[0474] (IV'-N4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 , [X], [Y], *n* 및 R^g 각각은 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 화학식 (IV'-N4)의 일부 구현예에서, *n*은 1, 2, 3, 4, 5 또는 6이다. 화학식 (IV'-N4)의 일부 구현예에서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 화학식 (IV'-N4)의 일부 구현예에서, R^g는 -OH이다.

[0475] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (IV')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (IV'-N5)의 화합물:

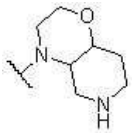
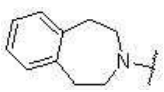
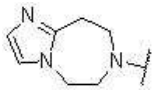
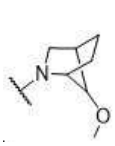
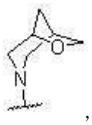
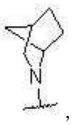
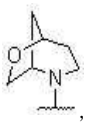
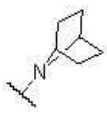
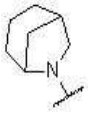
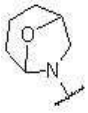
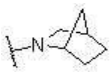
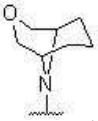
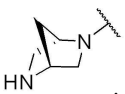
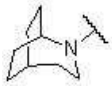
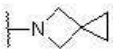
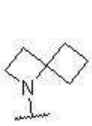
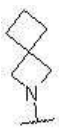
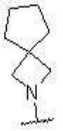
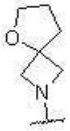
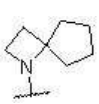
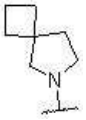
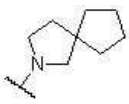
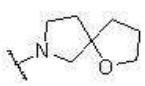
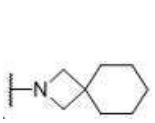
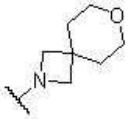
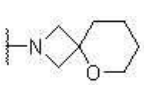
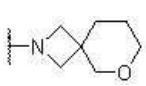
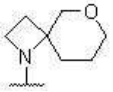


[0476] (IV'-N5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 , [X], [Y] 및 R^d 각각은 화학식 (IV')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

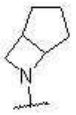
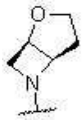
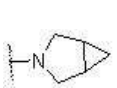
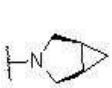
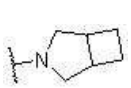
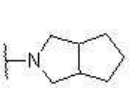
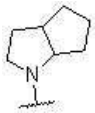
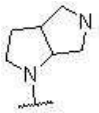
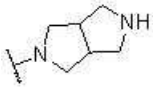
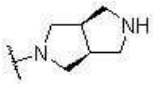
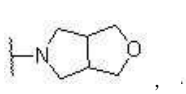
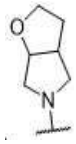
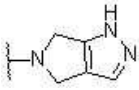
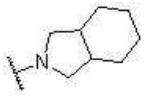
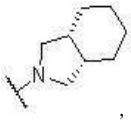
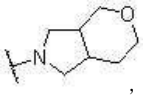
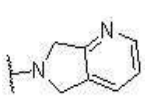
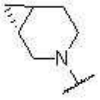
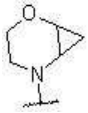
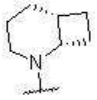
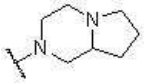
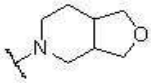
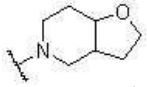
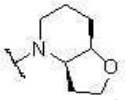
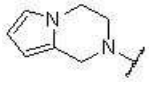
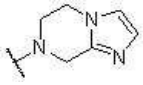
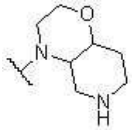
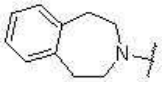
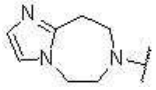
[0477] 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-N), (IV'-N1) 또는 (IV'-N2)의 화합물, 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 모노시클릭 헤테로사이클은 ,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^b는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 접합 비시클릭 헤테로사이클은 , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^b는 다리걸친 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서 다리걸친 헤테로사이클은 , 

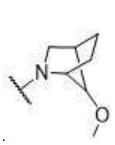
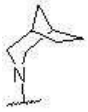
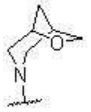
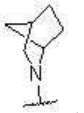
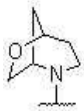
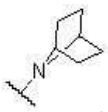
, , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^b는 스피로 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^b는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 스피로 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

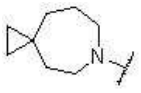
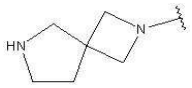
[0478] 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-N) 또는 (IV'-N1), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 모노시클릭 헤테로사이클은 , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 접합 비시클릭 헤테로사이클은 ,

,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a는 다리걸친 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서 다리걸친 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^a는 스피로 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 스피로 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0479] 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-N) 또는 (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물의 일부 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 모노시클릭 헤테로사이클을 형성한다. 일부 구현예에서, 모노시클릭 헤테로사이클은 , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지

12-원 접합 비시클릭 헤테로사이클을 형성한다. 일부 구현예에서, 접합 비시클릭 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

일부 구현예에서, -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 다리걸친 비시클릭 헤테로사이클을 형성한다. 일부 구현예에서 다리걸친 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 스피로 헤테로사이클을 형성한다. 일부 구현예에서, 스피로 헤테로사이클은 , .



및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0480] 구현예에서, R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 구현예에서, R^a는 -OH, -CN, -F, -옥소, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CN$, $-CH_2OH$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-O-CH_3$, $-CH_2-O-CH_3$, $-C(O)-O-CH_3$, $-C(O)-NH(CH_3)$, $S(O)_2-(CH_3)$, $-NH_2$, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 및 페닐로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다. 구현예에서, R^a는 -OH, -CN, -F, -옥소, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CN$, $-CH_2OH$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-O-CH_3$, $-CH_2-O-CH_3$, $-C(O)-O-CH_3$, $-C(O)-NH(CH_3)$, $S(O)_2-(CH_3)$, $-NH_2$, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 및 페닐로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다.

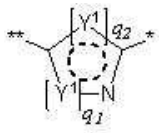
[0481] 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이다. 구현예에서, R^b는 -OH, -CN, -F, -옥소, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CN$, $-CH_2OH$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-O-CH_3$, $-CH_2-O-CH_3$, $-C(O)-O-CH_3$, $-C(O)-NH(CH_3)$, $S(O)_2-(CH_3)$, $-NH_2$, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 및 페닐로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클이고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다. 구현예에서, R^b는 -OH, -CN, -F, -옥소, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CN$, $-CH_2OH$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$, $-O-CH_3$, $-CH_2-O-CH_3$, $-C(O)-O-CH_3$, $-C(O)-NH(CH_3)$, $S(O)_2-(CH_3)$, $-NH_2$, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 및 페닐로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클이고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다.

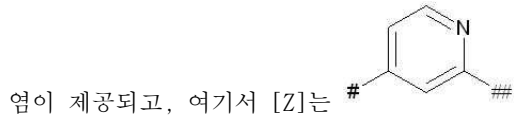
[0482] 일부 구현예에서, R^a는 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15- 원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15- 원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, R^a 또는 R^b의 3- 내지 15-원 헤테로사이클은 $-N(R^j)(R^k)$이고, 여기서 $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

[0483] 구현예에서, R^b는 $-N(R^j)(R^k)$이다. 구현예에서, R^a는 $-N(R^j)(R^k)$이다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성한다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 비치환 헤테로사이클을 형성한다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, 1, 2, 3, 4, 5 또는 6 개의 R^c로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, 1, 2 또는 3 개의 R^c로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성한다.

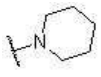
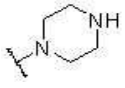
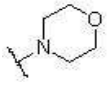
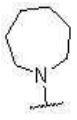
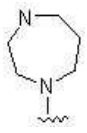
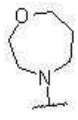
[0484] 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, R^c로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, $-N(R^j)(R^k)$의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, -OH, -CN, -F, -옥소, $-CH_3$, $-CH_2CH_3$, $-CH_2CN$, $-CH_2OH$, $-CH_2F$, $-CHF_2$, $-CF_3$,

-O-CH_3, -CH_2-O-CH_3, -C(O)-O-CH_3, -C(O)-NH(CH_3), S(O)$_2$-(CH_3), -NH_2, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 또는 페닐로 선택적으로 치환된 3- 내지 15-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다. 구현예에서, -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는 이들이 부착된 N 원자와 함께, -OH, -CN, -F, -옥소, -CH_3, -CH_2CH_3, -CH_2CN, -CH_2OH, -CH_2F, -CHF_2, -CF_3, -O-CH_3, -CH_2-O-CH_3, -C(O)-O-CH_3, -C(O)-NH(CH_3), S(O)$_2$-(CH_3), -NH_2, 시클로프로필, 모르폴리노, 푸란 또는 페닐로 선택적으로 치환된 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 페닐은 선택적으로 CN으로 더 치환된다.

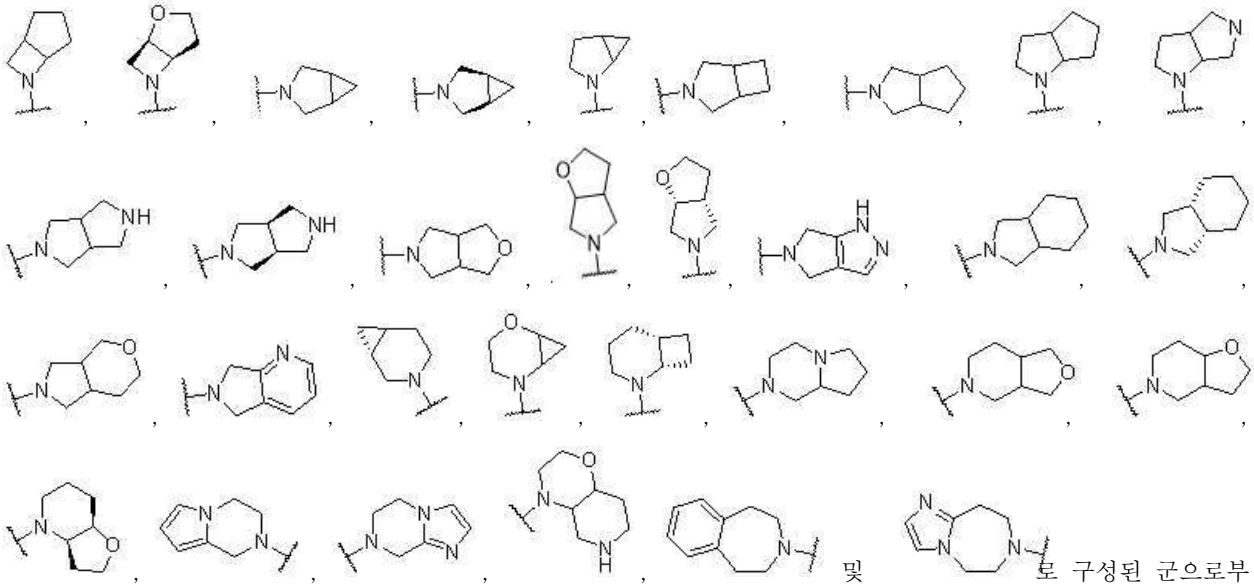
[0485] 일부 구현예에서, 화학식 (IV')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [Z]는 , 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, 여기서 *는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, **는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [Y]가 부재하는 경우, **는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, **는 에 대한 부착점을 나타낸다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV') 또는 (IV'-L)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 각 Y^1은 CH이고, q_1과 q_2의 합은 3이다.

[0486] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') 또는 (IV'-L)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [Z]는 이고 여기서 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, #는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [Y]가 부재하는 경우, #는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, #는 에 대한 부착점을 나타낸다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV') 또는 (IV'-L)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [Y]는 부재한다.

[0487] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') 또는 (IV'-L)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a이다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV') (IV'-L1), (IV'-M1) 또는 (IV'-N1)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 -N(R^j)(R^k)로 치환되고, 여기서 -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된다.

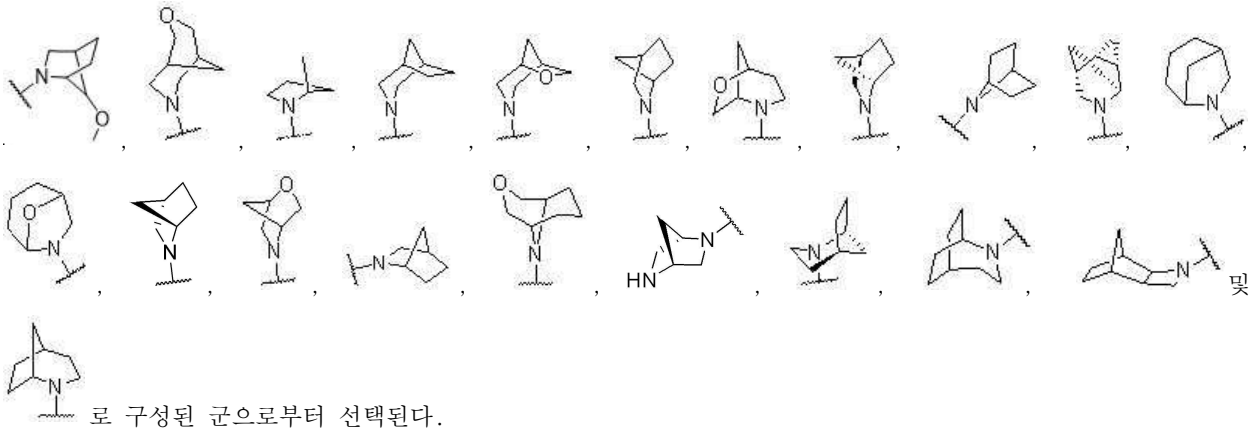
[0488] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') (IV'-L2), (IV'-M2) 또는 (IV'-N2)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^b는 모노시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 , , , , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0489] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') (IV'-L2), (IV'-M2) 또는 (IV'-N2)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^b는 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 접합 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



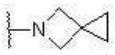
및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

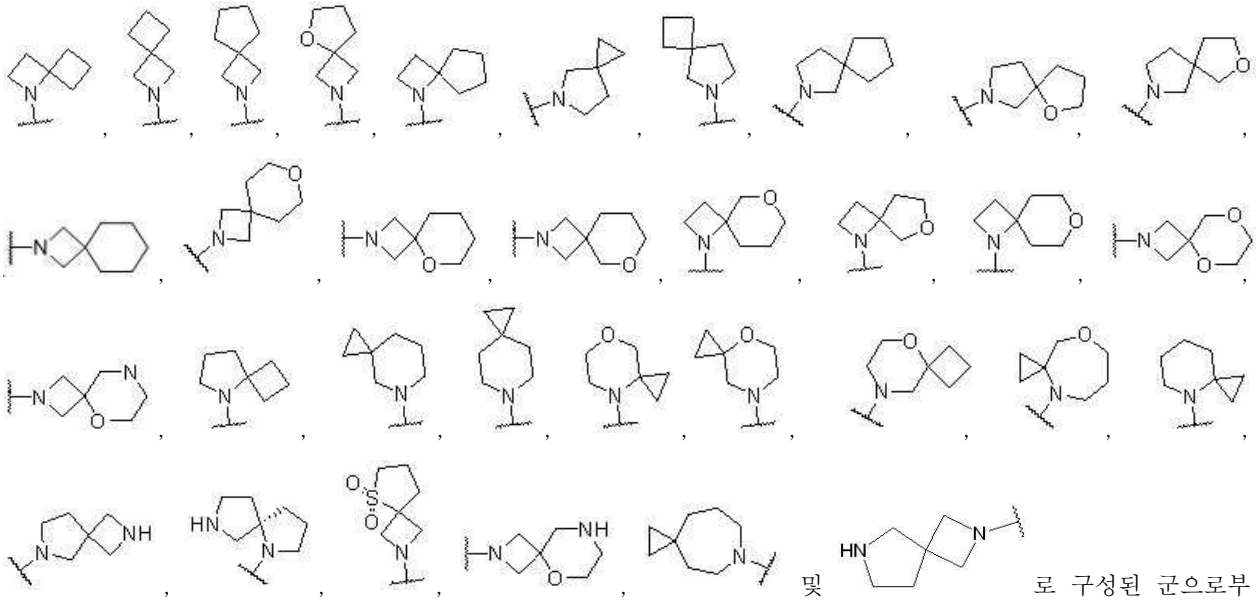
[0490] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') (IV'-L2), (IV'-M2) 또는 (IV'-N2)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^b는 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 다리걸친 비시클릭 4- 내지 12-원 헤테로사이클은



및

로 구성된 군으로부터 선택된다.

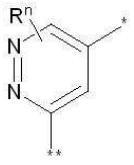
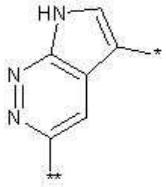
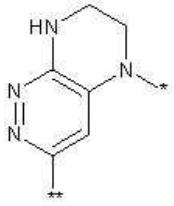
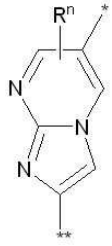
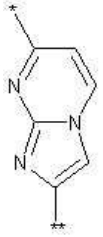
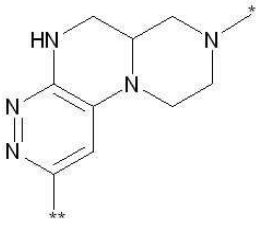
[0491] 일부 구현예에서, 화학식 (IV') (IV'-L2), (IV'-M2) 또는 (IV'-N2)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^b는 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 스피로 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 ,

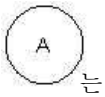
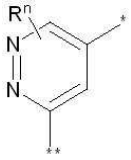
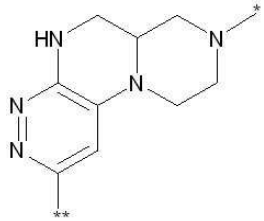


및 로 구성된 군으로부

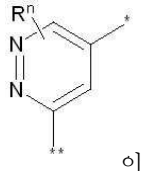
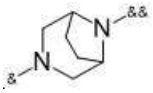
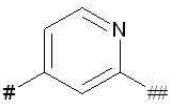
터 선택된다.

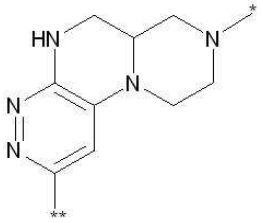
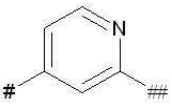
[0492] 일부 구현예에서, R^b의 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 하나, 둘, 셋 또는 넷의 R^c로 치환된다. 일부 구현예에서, R^b의 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 플루오린, -OH, 옥소, 메틸, 메탄올, 시클로프로필, 메톡시, 에톡시 및 $-CF_3$로 구성된 군으로부터 선택된 하나, 둘, 셋 또는 넷의 치환기로 치환된다.

[0493] 일부 구현예에서, 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는 , , , ,  및 

로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 R^n은 $-NH_2$이고, 여기서 *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는  이고, R^n은 $-NH_2$이고 여기서 *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 는  이고, [X]는 부재하고, 여기서 *는[Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **은 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다.

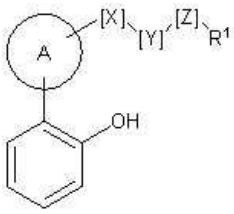
[0494] 일부 구현예에서, 화학식 (IV'), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물 또는 이의 입체이성질체

또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는  이고, R^n은 NH_2이고 여기서 *는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [Y]는 부재하고, [Z]는  이고 여기서 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나의 R^b로 치환되고, 여기서 R^b는 -N(R^j)(R^k)이고, 여기서 -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된다.

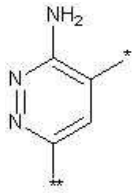
[0495] 일부 구현예에서, 화학식 (IV'), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는  이고, 여기서 *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고 **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, [X]는 부재하고, [Y]는 부재하고, [Z]는  이고 여기서 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나의 R^b로 치환되고, 여기서 R^b는 -N(R^j)(R^k)이고, 여기서 -N(R^j)(R^k)의 R^j 및 R^k는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 적어도 하나의 R^c로 선택적으로 치환된다.

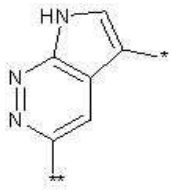
[0496] 일부 구현예에서 화학식 (IV'), 또는 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a이고 R^a는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 C_{3-10}시클로알킬, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴, 또는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로아릴로 구성된 군으로부터 선택되고, R^c는 R^z이고, 여기서 R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -N(R^x)(R^y) 또는 -C(O)-N(R^x)(R^y)이다. 일부 구현예에서, 화학식 (IV')의 화합물은 화학식 (I')의 화합물이다.

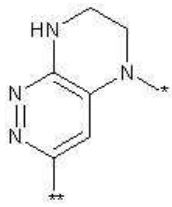
[0497] 한 양태에서, 본 개시는 화학식 (I')의 화합물:

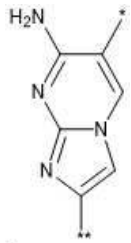
[0498]  (I'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서:

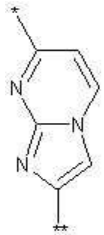
[0499]  는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

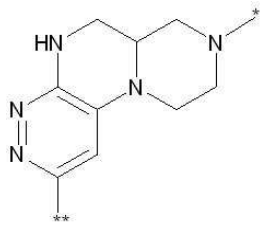
[0500] (a) ;

[0501] (b) ;

[0502] (c) ;

[0503] (d) ;

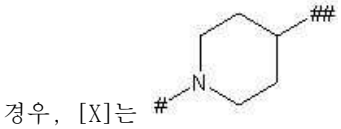
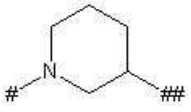
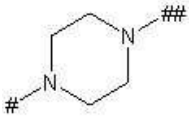
[0504] (e) ; 및

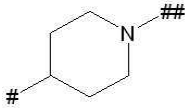
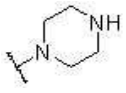


[0505] (f) ,여기서, (a)-(f)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0506] 여기서:

[0507] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0508] 단,  가 (a)인 경우, [X]는  ,  , 또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, 그리고

[0509] 단,  가 (f)이고, [X]는  이고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, R^g는 OH 또는  이 아니고,

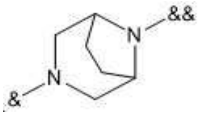
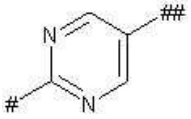
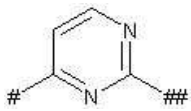
[0510] [Y]는 부재하고, 그리고

[0511] [Z]는 부재하고; 또는

[0512] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

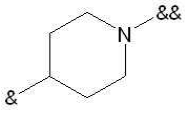
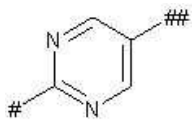
[0513] [Y]는 부재하고, 그리고

[0514] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0515] 단,  가 (a)이고, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가  또는  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우:

[0516] (a-i) R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0517] (a-ii) R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g가 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0518] 단,  가 (b)이고, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우:

[0519] (a-i) R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, 그리고

[0520] (a-ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g는 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고; 또는

[0521] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0522] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0523] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; 또는

[0524] (iv) [X]는 부재하고,

[0525] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0526] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0527] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0528] (v) [X]는 부재하고,

[0529] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[0530] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0531] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0532] (vi) [X]는 부재하고,

[0533] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[0534] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0535] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0536] (vii) [X]는 부재하고,

[0537] [Y]는 부재하고, 그리고

[0538] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고; 그리고

[0539] R^1은:

[0540] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0541] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으

로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0542] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0543] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0544] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0545] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0546] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0547] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0548] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0549] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0550] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0551] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0552] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0553] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0554] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0555] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0556] *p*는 1-6의 정수이고,

[0557] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

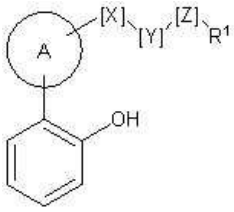
[0558] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0559] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0560] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는

[0561] (c) -C≡C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

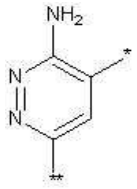
[0562] 한 양태에서, 본 개시는 화학식 (I)의 화합물:



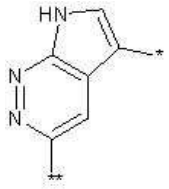
[0563] (I), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서:

[0564] 

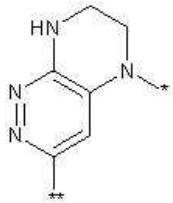
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

[0565] (a) 

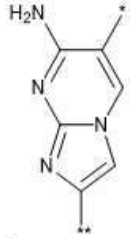
;

[0566] (b) 

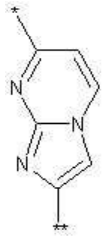
;

[0567] (c) 

;

[0568] (d) 

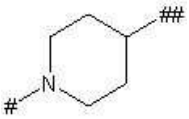
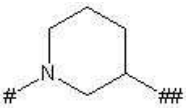
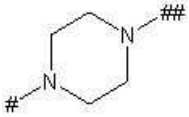
; 및

[0569] (e) ,

[0570] 여기서, (a)-(e)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0571] 여기서:

[0572] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0573] 단,  가 (a)인 경우, [X]는 ,  또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

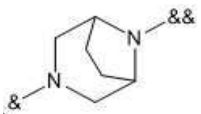
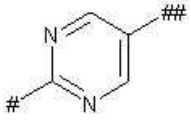
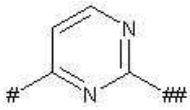
[0574] [Y]는 부재하고, 그리고

[0575] [Z]는 부재하고; 또는

[0576] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[0577] [Y]는 부재하고, 그리고

[0578] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0579] 단,  가 (a)이고 [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는  이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; 또는

[0580] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0581] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0582] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; 또는

[0583] (iv) [X]는 부재하고,

[0584] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0585] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0586] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0587] (v) [X]는 부재하고,

[0588] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[0589] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0590] 단 

는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[0591] (vi) [X]는 부재하고,

[0592] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[0593] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0594] 단 

는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 그리고

[0595] R^1은:

[0596] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0597] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0598] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0599] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0600] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0601] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0602] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0603] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0604] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0605] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0606] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0607] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0608] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0609] 여기서

[0610] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리

고

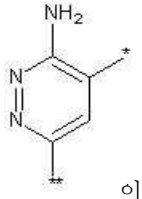
[0611] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0612] p는 1-6의 정수이고,

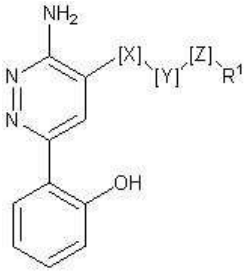
[0613] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[0614] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

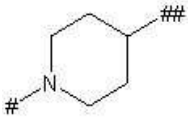
[0615] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 

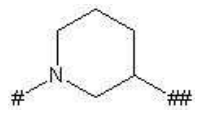
는 

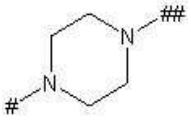
이어서, 화합물은 화학식 (I-A)의 화합물:

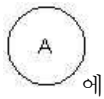


[0616] (I-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0617] 화학식 (I-A)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단 [X]는 

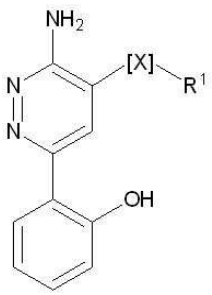
, 

또는 

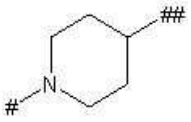
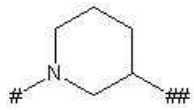
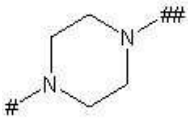
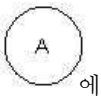
이 아니고, 여기서 #는 

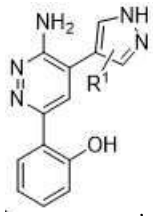
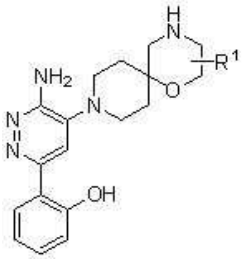
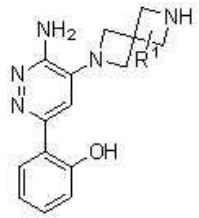
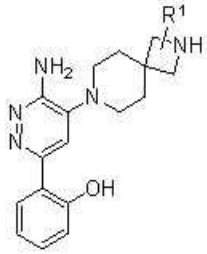
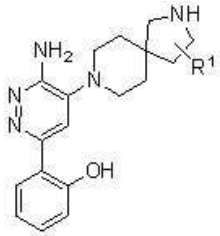
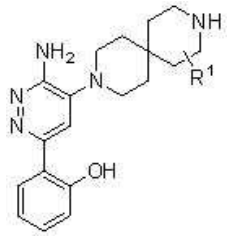
에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; [Y]는 부재하고; [Z]는 부재한다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

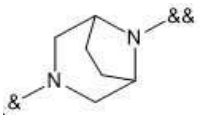
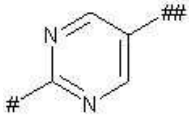
[0618] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A1)의 화합물:

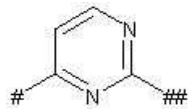


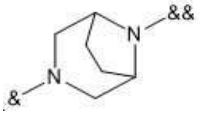
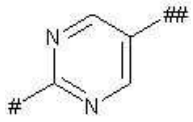
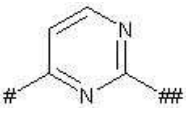
[0619] (I-A1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단 [X]는




이 아니고, 여기서 #는 
에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타낸다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 3-12 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 비시클릭 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 스피로이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 모노시클릭 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 모노시클릭 헤테로시클릴이 아니다. 일부 구현예에서, [X]는 다리걸친 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 둘의 환형 헤테로원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 둘의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A1)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

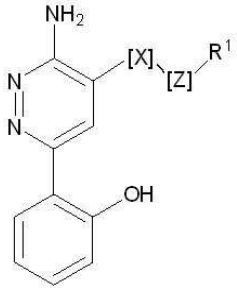
[0620] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 
, 
, 
, 
, 
및 
, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A1)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A1)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

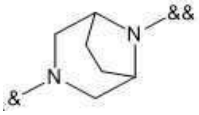
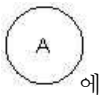
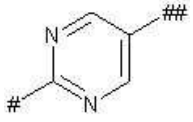
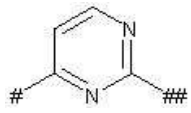
[0621] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Y]는 부재하고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단, [X]가 
이고, 여기서 &는 
에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가 
또

는  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$으로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g가 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0622] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Y]는 부재하고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단,  가 (a)이고 [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는  가 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타낸다; 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

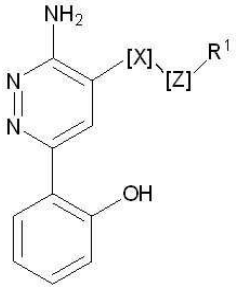
[0623] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A2)의 화합물:

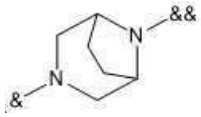


[0624] (I-A2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단, [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는  또는  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬이고, R^x 및 R^y가 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아닐 때, 그리고 R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g가 $N(R^x)(R^y)$일 때, R^x 및 R^y는 H 또

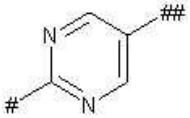
는 C_{1-6} 알킬이 아니다. 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 3-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 3-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 6-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 6-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 일부 구현예에서, [X]는 모노시클릭 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 다리걸친 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 3-10 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 모노시클릭 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [Z]는 단지 하나의 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함한다.

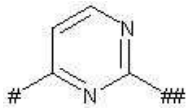
[0625] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A2)의 화합물:



[0626] (I-A2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단, [X]가 

이고, 여기서 &는 

에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는 

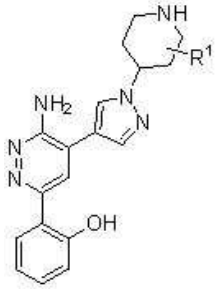
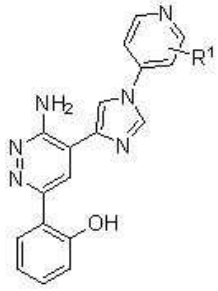
또는 

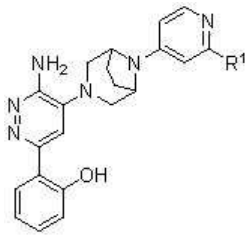
이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타낸다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 3-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 3-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 6-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]는 6-8 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH로 선택

적으로 치환된다. 일부 구현예에서, [X]의 6-8 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 모노시클릭 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 다리걸친 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 3-10 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 모노시클릭 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다.

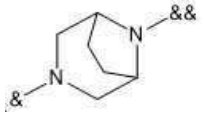
[0627] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은

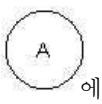

,

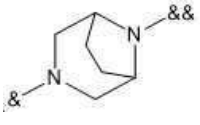
,

및

, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택된다. 한 구현예에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염은


, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0628] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X] 및 [Z]의 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴은 각각 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는


이고, 여기서 &는


에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는

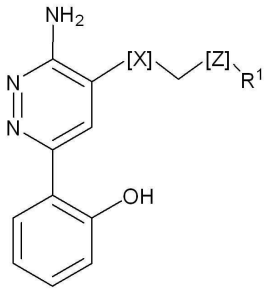

이고, 여기서 &는


에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, R^1

은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

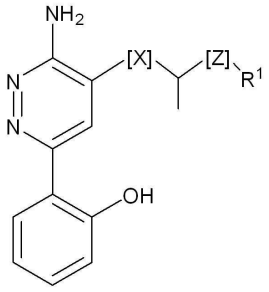
[0629] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다.

[0630] 전술한 것의 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A3)의 화합물:



[0631] (I-A3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A3)의 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

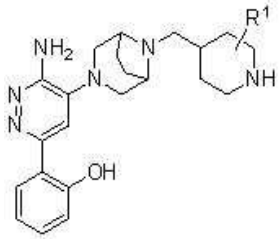
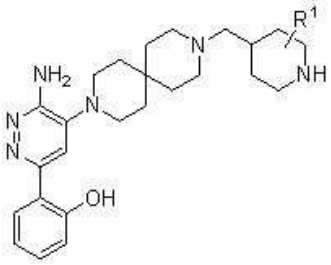
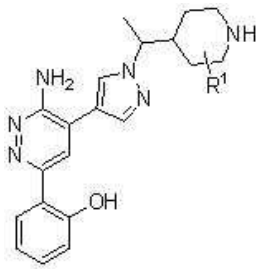
[0632] 전술한 것의 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A4)의 화합물:



[0633] (I-A4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A4)의 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에

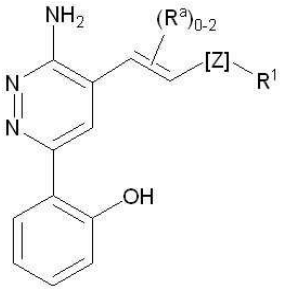
대해 정의된 바와 같다.

[0634] 전술한 것의 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-A3) 또는 (I-A4)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 3-12 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 6-12 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 8-12 원 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 3-10 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-A3) 또는 (I-A4)화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이고 [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A4)의 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

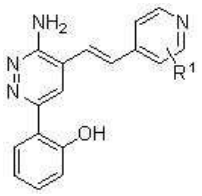
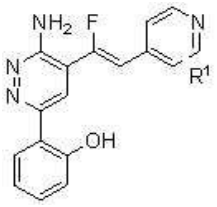
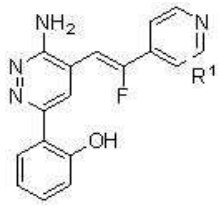
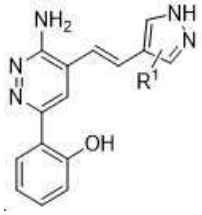
[0635] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 ,  및 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I) 또는 (I-A)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0636] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다.

[0637] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A5)의 화합물:



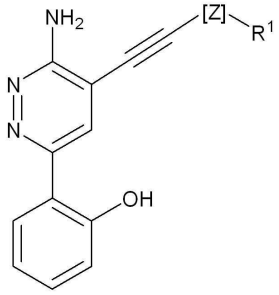
[0638] (I-A5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 또는 둘의 R^a로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^a는 할로이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Y]는 치환되지 않은 에틸렌이다. 일부 구현예에서, [Y]는 둘의 할로로 치환된 에틸렌이다. 일부 구현예에서, [Y]는 하나의 할로로 치환된 에틸렌이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, 할로는 플루오로이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [Z], R^a 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A5)의 [Z], R^a 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0639] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 , ,  및 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I-A5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 R^1은 화학식 (I') 또는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A3)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A3)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0640] 한 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I') 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 에티닐렌이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 한 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I') 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 에티닐렌이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다.

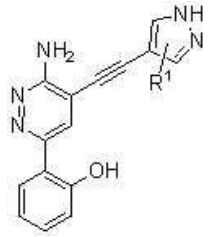
[0641] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또

는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 하기 화학식의 화합물:

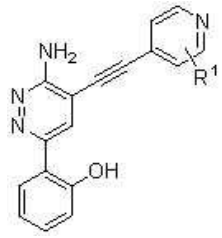


[0642] (I-A6), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A6)의 [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0643] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A6)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은



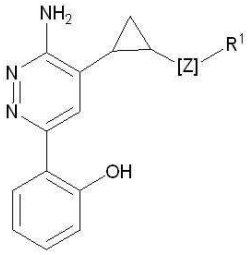
및



, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A6)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A6)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

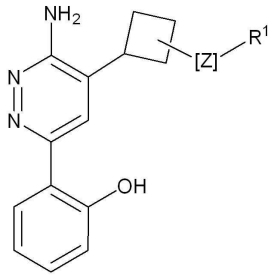
[0644] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 부재하고, [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다.

[0645] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A7)의 화합물:



[0646] (I-A7), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A7)의 [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

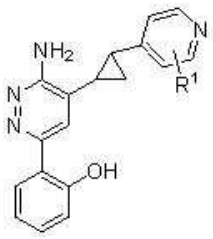
[0647] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-A8)의 화합물:



[0648] (I-A8), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-A8)의 [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

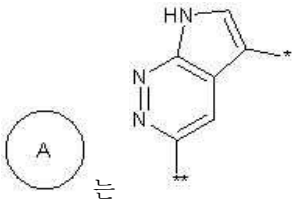
[0649] 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다.

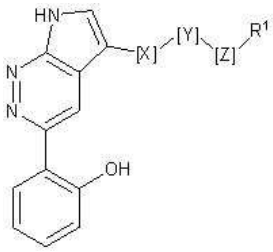
[0650] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A7)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은



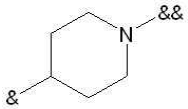
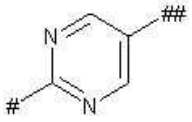
, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 일부 변형에서, R^1은 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A7)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A7)의 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

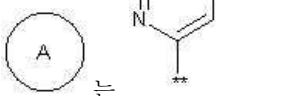
[0651] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중

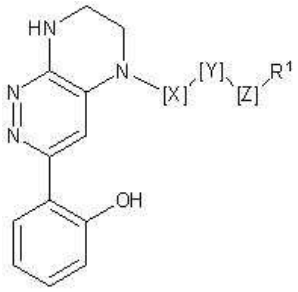
임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는 이어서, 화합물은 화학식 (I-B)의 화합물:



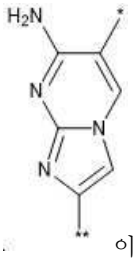
[0652] (I-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-B)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

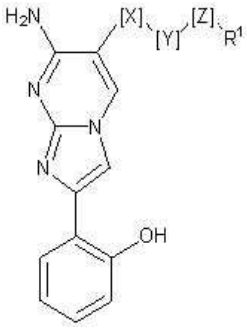
[0653] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-B)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Y]는 부재하고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]가  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1이 $-C\equiv C-R^a$이고 R^a가 $N(R^x)(R^y)$로 치환된 C_{1-6} 알킬인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니고, R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g가 $N(R^x)(R^y)$인 경우, R^x 및 R^y는 H 또는 C_{1-6} 알킬이 아니다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0654] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는 이어서, 화합물은 화학식 (I-C)의 화합물:

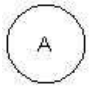
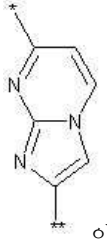


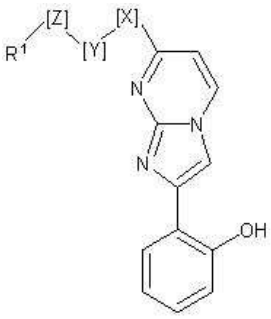
[0655] (I-C), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-C)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0656] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는  이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-D)의 화합물:



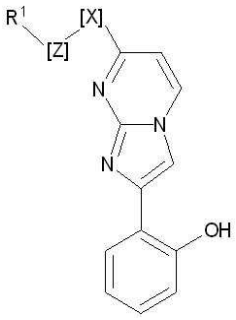
[0657] (I-D), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-D)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0658] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는  이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-E)의 화합물:

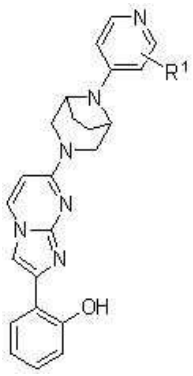


[0659] (I-E), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-E)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0660] 화학식 (I-E)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; [Y]는 부재하고; [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-E)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-E1)의 화합물:

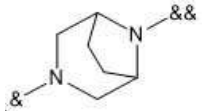


[0661] (I-E1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 3-10 원 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [X]는 6-8 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 8-원 헤테로시클릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, [Z]는 5-10 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Z]는 6-원 헤테로아릴이다. 전술한 것의 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 화합물은

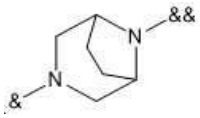


, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-E1)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구

현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0662] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [X] 및 [Z]의 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴은 각각 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 일부 구현예에서, [X]는 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하는 헤테로시클릴이고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 

이고, 여기서 &는 

에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [X]는 

이고, 여기서 &는 

에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는 단지 하나의 환형 N 원자를 포함하는 5-6 원 헤테로아릴이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 일부 변형에서, [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-E) 또는 (I-E1)의 [X], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0663] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1) 또는 (I-I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0664] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0665] (b) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 C_{3-10}시클로알킬이고, 또는

[0666] (c) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴이고, 또는

[0667] (d) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0668] 여기서 R^z는, 독립적으로 각 경우에, C_{1-6}알킬 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0669] $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-

20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 p는 1-6의 정수이고, R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고, R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환된다.

[0670] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[0671] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0672] (b) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 C_{3-10}시클로알킬이고, 또는

[0673] (c) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴이고, 또는

[0674] (d) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0675] 여기서 R^z는, 독립적으로 각 경우에, C_{1-6}알킬 또는 -N(R^x)(R^y)이고; 그리고

[0676] -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서,

[0677] n은 1-6의 정수이고, 그리고

[0678] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고, 여기서 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 -C(O)-R^s, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이다.

[0679] 구현예에서, R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[0680] n은 1-6의 정수이고, 그리고

[0681] R^g는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2 또는 C_{1-6}알킬이다.

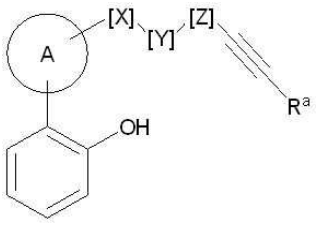
[0682] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의

약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-C\equiv C-R^a$이다.

[0683] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이다.

[0684] 구현예에서, R^1은 $-C=C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알콕시이다.

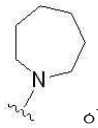
[0685] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-C\equiv C-R^a$여서, 화합물은 화학식 (I-F)의 화합물:



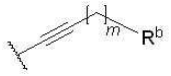
[0686] (I-F), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-F)의 [X], [Y], [Z] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0687] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 전술한 것의 구현예에서, R^a는 C_{1-4}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-4}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 C_{1-3}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-3}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 에틸이고, 여기서 R^a의 에틸은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 에틸이고, 여기서 R^a의 에틸은 하나의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나의 R^b로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0688] 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-(4-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-$[N(R^x)(R^y)]$이고, 여기서 R^x는 H 또는 C_{1-2}알킬이고, R^y는 $-C_{1-2}$알킬-OH이다. 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-C_{1-2}알콕시-OH이다.

[0689] 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-(7 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는  이다.

[0690] 구현예에서, R^1은

[0691]  이고, 여기서 m은 0-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0692] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0693] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

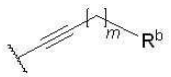
[0694] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0695] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0696] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서

[0697] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0698] 구현예에서, R^1은

[0699]  이고, 여기서 m은 0-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0700] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0701] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0702] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0703] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0704] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서

[0705] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0706] 구현예에서, m은 0이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, $-O-$(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0707] 구현예에서, m은 0이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, $-O-$(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0708] 구현예에서, m은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, $-O-$(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테

로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

[0709] 구현예에서, *m*은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

[0710] 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

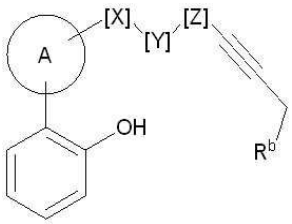
[0711] 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는

-C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 또는 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 할로, -OH, 옥소, 하나 이상의 -OH, C_{3-7}시클로알킬, C_{1-4}알콕시, C_{1-4}할로알킬 및 -C(O)-N(R^h)(R^i)로 선택적으로 치환된 C_{1-4}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 적어도 하나의 치환기로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^h 및 R^i는 각각 독립적으로 H 및 C_1-C_4알킬로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 R^h 또는 R^i의 C_1-C_4알킬은 독립적으로 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

[0712] 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

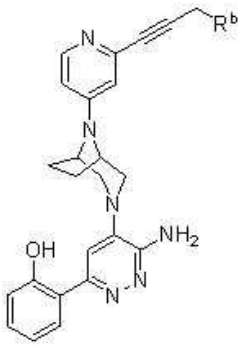
[0713] 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -S(O)$_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

[0714] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나의 R^b로 치환되어서, 화학식 (I-F)의 화합물은 화학식 (I-F1)의 화합물:



[0715] (I-F1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^b는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-F1)의 [X], [Y], [Z] 및 R^b는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0716] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A2)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나의 R^b로 치환되어서, 화합물은 화학식 (I-A9)의 화합물:



[0717] (I-A9), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에도 적용된다. 일부 변형에서, R^b는 화학식 (I), (I-A), (I-A2) 또는 (I-A9)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-A), (I-A2) 또는 (I-A9)의 R^b는, 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0718] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약

제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0719] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 4-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다.

[0720] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 4-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에도 적용된다. 일부 변형에서, R^b 및 R^c는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 R^b 및 R^c는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0721] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은

하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다.

[0722] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, -$S(O)_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0723] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I'), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다.

[0724] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다.

[0725] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -$S(O)_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴),

C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

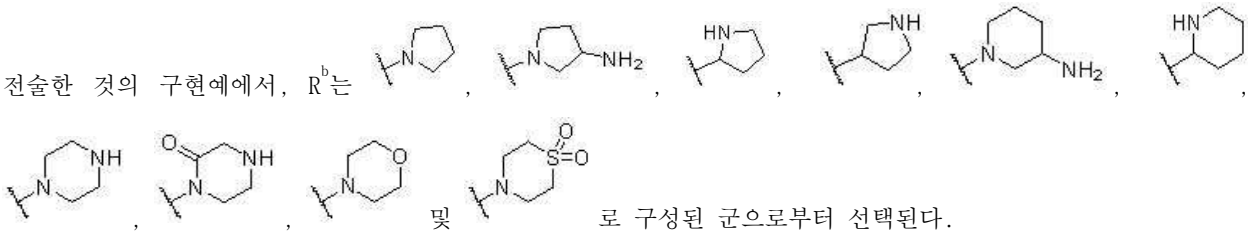
[0726] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I'), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -NH_2이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 -NH_2이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -NH_2이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 -NH_2이다.

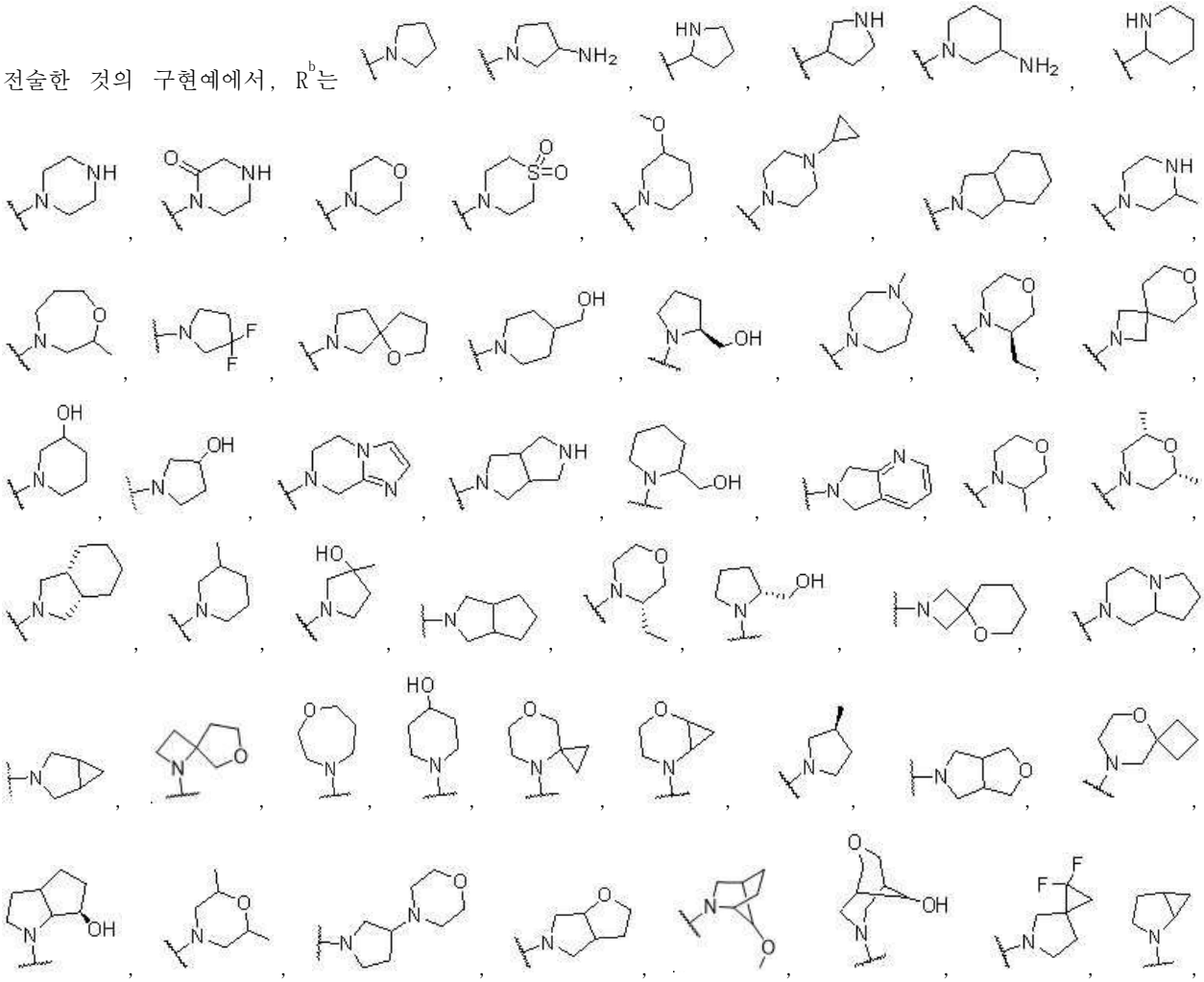
[0727] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐이고, 여기서 R^b의 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다.

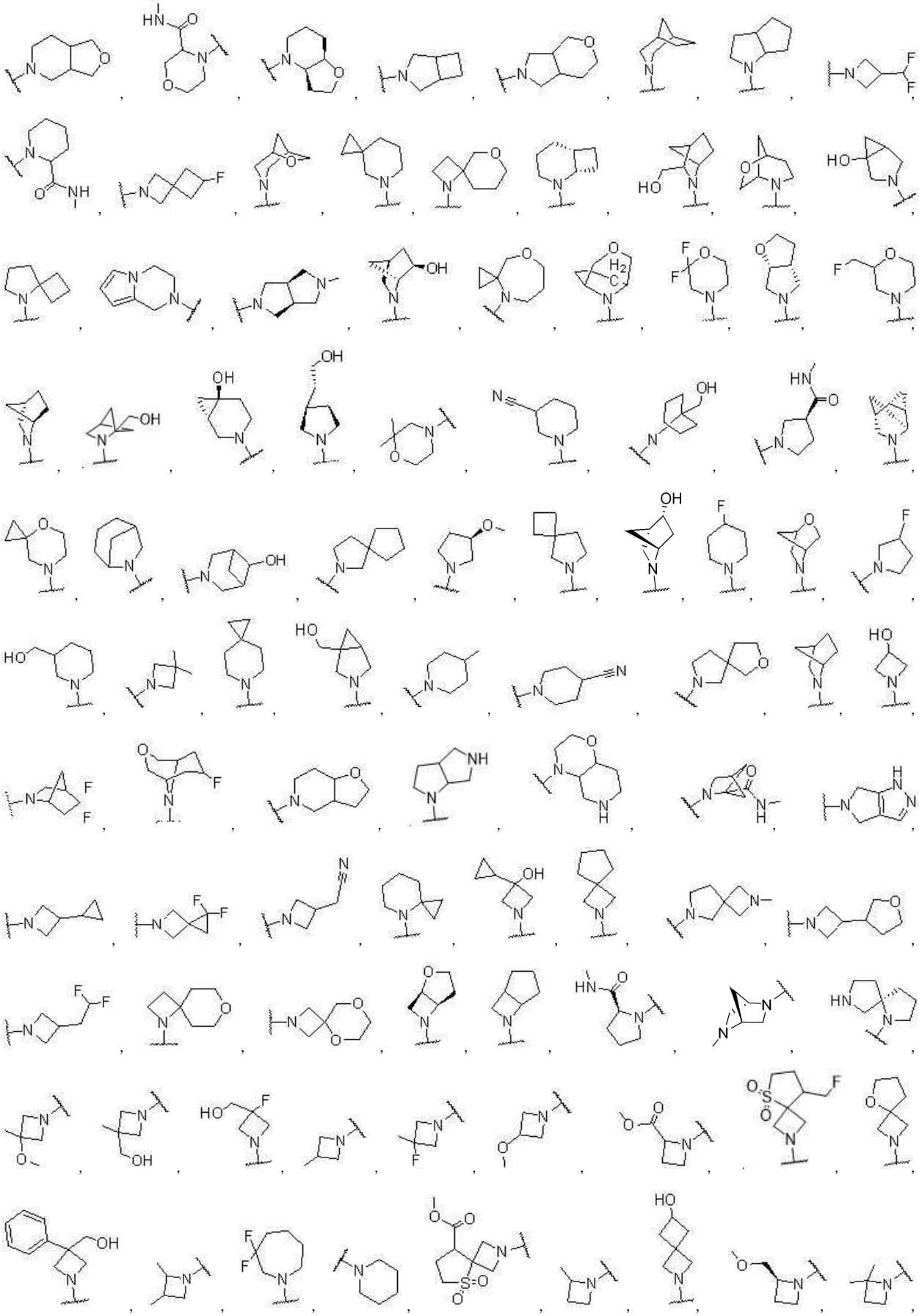
[0728] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐이고, 여기서 R^b의 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, -S(O)$_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화

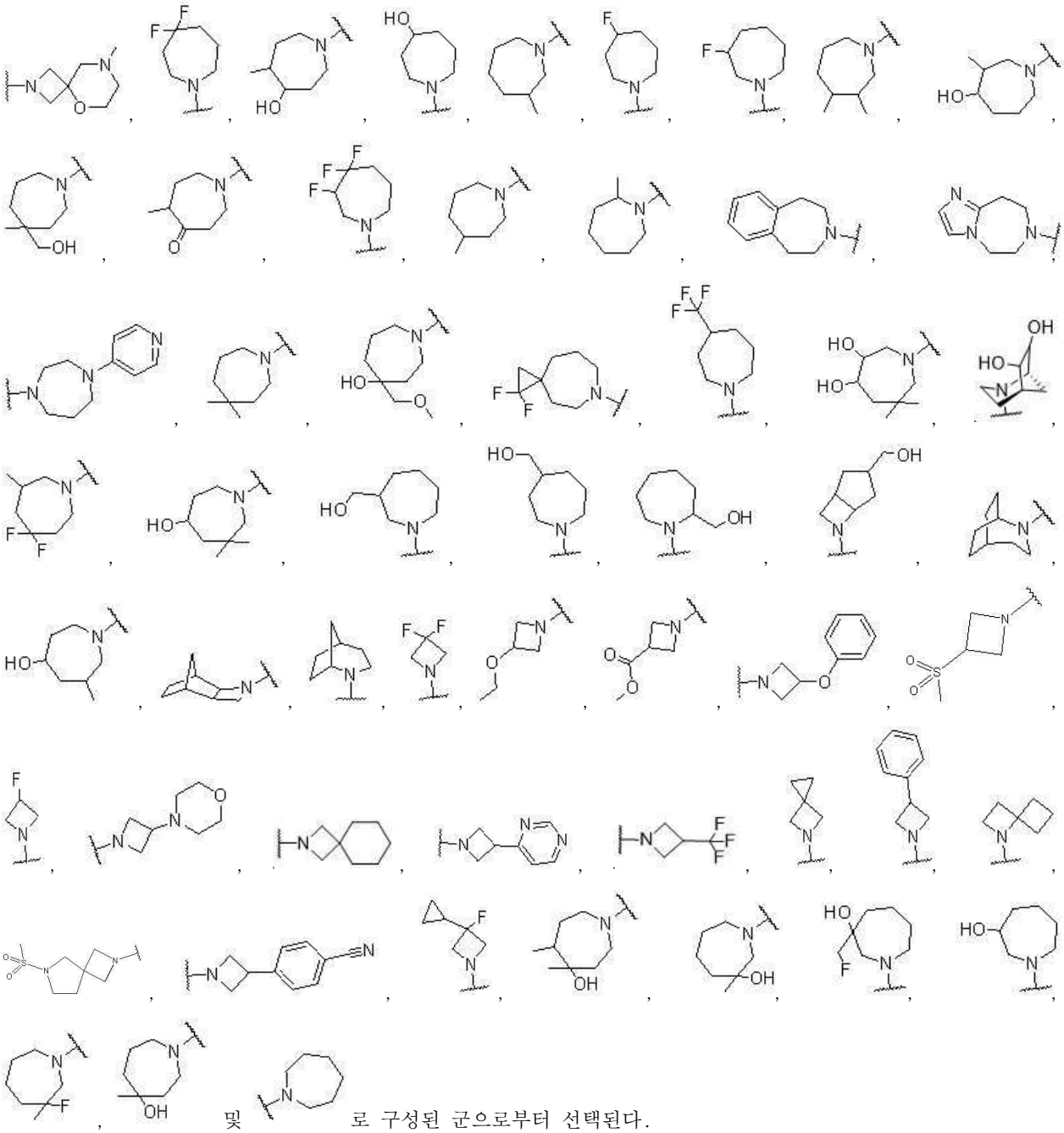
합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0729] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐이고, 여기서 R^b의 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0730] 전술한 것의 구현예에서, R^b는  및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

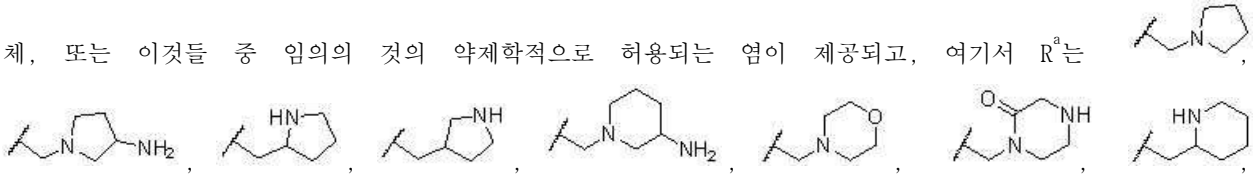
[0731] 전술한 것의 구현예에서, R^b는 





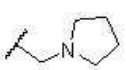
로 구성된 군으로부터 선택된다.

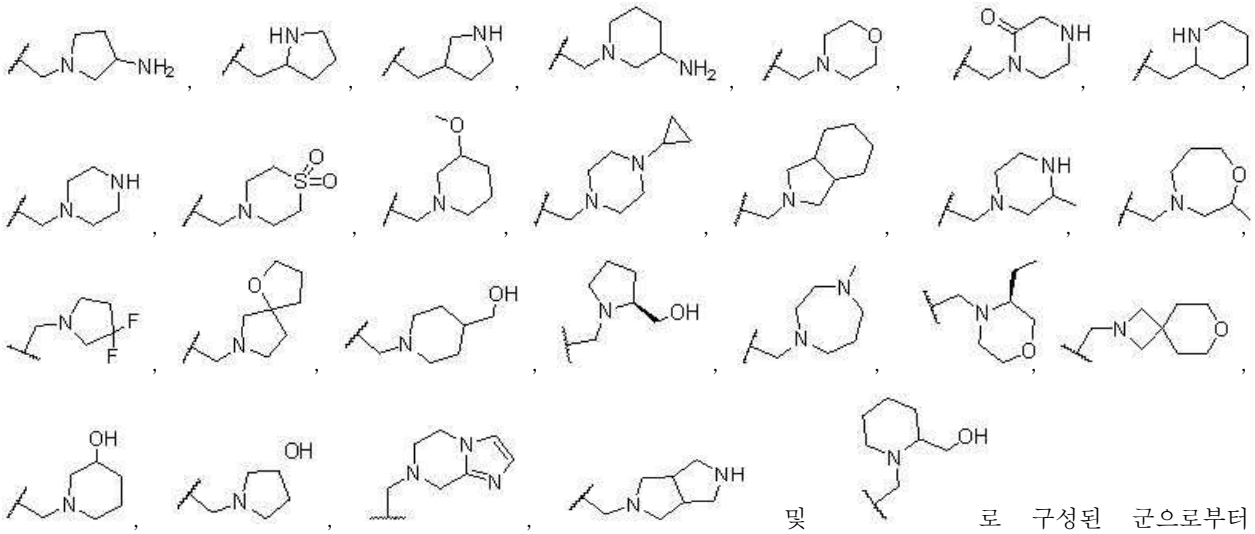
[0732] 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는



로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

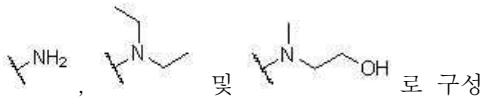
[0733] 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는



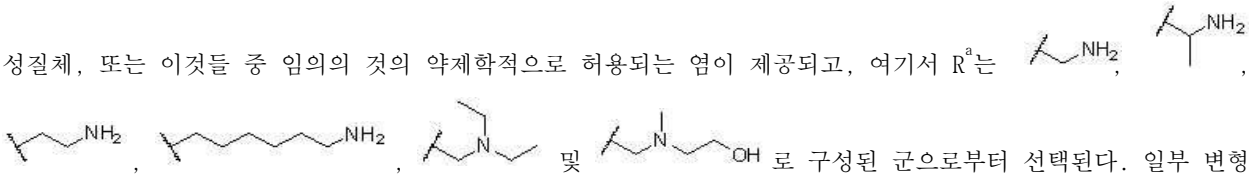


로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0734] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는

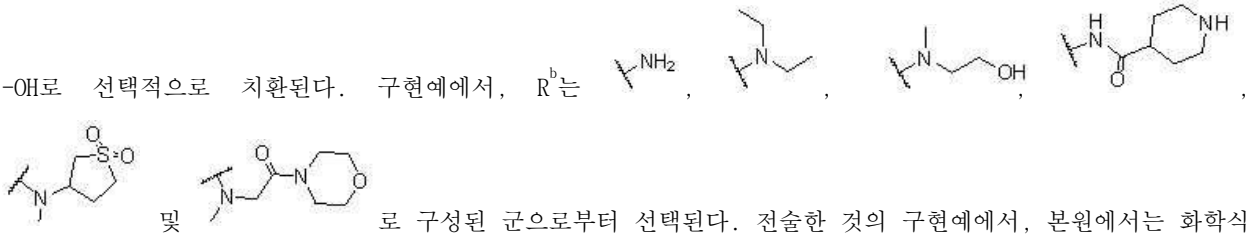


로 구성된 군으로부터 선택된다. 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는

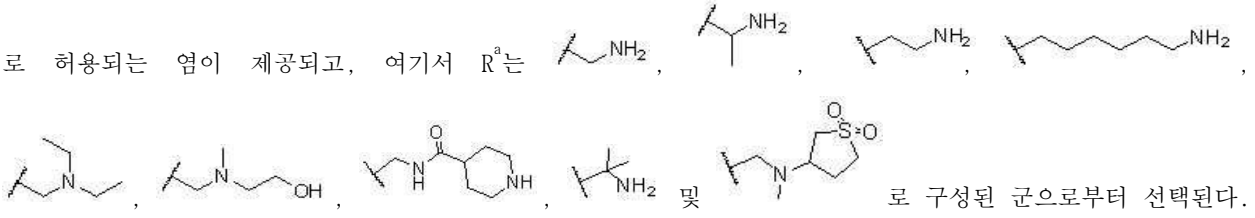


로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0735] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A) 또는 (I-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는



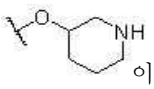
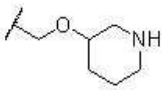
로 구성된 군으로부터 선택된다. 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는

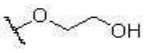
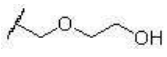


로 구성된 군으로부터 선택된다.

일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

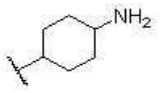
[0736] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 -OH이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  또는  이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0737] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 -O-(3-15 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(4-10 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(4-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(5-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, -O-(6 원 헤테로시클릴)의 6-원 헤테로시클릴은 포화되고 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 구현예에서, R^b는 -O-(피페리디닐)이다. 구현예에서, 구현예에서, R^b는  이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0738] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 C_{1-6}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 C_{1-4}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-4}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 C_{1-3}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-3}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, 구현예에서, R^b는 C_{1-2}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-2}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 에톡시이고, 여기서 R^b의 에톡시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는  이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

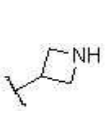
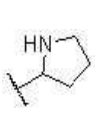
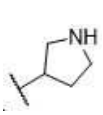
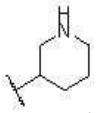
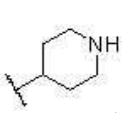
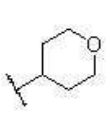
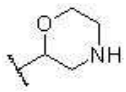
[0739] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^c는 $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬)이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-F), (I-F1) 또는 (I-A9)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^c는 $-C_{6-10}$아릴이고, 여기서 R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

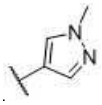
[0740] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 C_{3-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

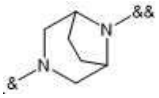
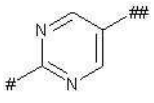
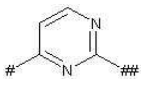
[0741] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 포화 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 포화 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 시클로헥실이고, 여기서 R^a의 시클로헥실은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 시클로헥실이고, 여기서 R^a의 시클로헥실은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는  이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

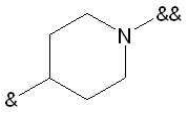
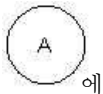
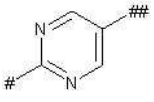
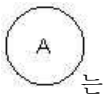
[0742] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 3-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 3-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0743] 구현예에서, R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 포화 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 포화 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 적어도 하나의 환형 N 원자 또는 적어도 하나의 환형 O 원자를 포함한다. 구현예에서, R^a는 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐이고, 여기서 R^a의 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현

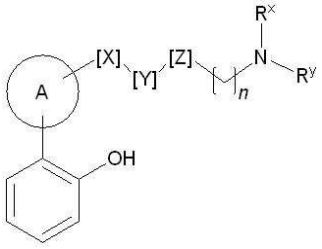
예에서, R^a의 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 , , , , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0744] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-F)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 5-10 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-10 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 메틸로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 피라졸릴이고, 여기서 R^a의 피라졸릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 피라졸릴이고, 여기서 R^a의 피라졸릴은 하나 이상의 메틸로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0745] 일부 구현예에서, R^a는 $-(CH_2)_n-R^g$이고 R^g는 -OH이다. 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1) 또는 (I-I)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^g는 -OH이다. 일부 구현예에서, 는 (a)이고 R^g는 -OH이다. 일부 구현예에서, 는 (a)이고, [X]는 이고, 여기서 &는 에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는  또는 이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, R^g는 -OH이다. 일부 구현예에서, 는 (b)이고 R^g는

-OH이다. 일부 구현예에서,  는 (b)이고, [X]는  이고, 여기서 &는 에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, [Z]는  이고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고, R^g는 -OH이다. 일부 구현예에서, 는 (c)-(f)로부터 선택되고 R^g는 -OH이다.

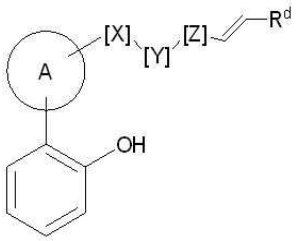
[0746] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이다. 전술한 것의 구현예에서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$여서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-G)의 화합물:



[0747] (I-G), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 [X], [Y], [Z], R^x 및 R^y는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-G)의 [X], [Y], [Z], R^x 및 R^y는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

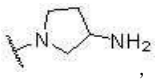
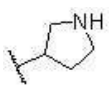
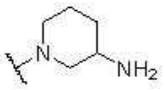
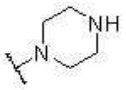
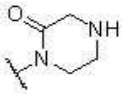
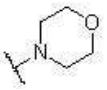
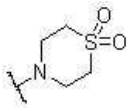
[0748] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^x 및 R^y는 모두 H이다. 구현예에서, R^x 및 R^y 중 하나는 H이고 R^x 및 R^y 중 다른 하나는 $-C(O)-CH_2-NH_2$이다. 전술한 것의 구현예에서, n은 1-5, 1-4, 1-3, 또는 1-2의 정수이다. 구현예에서, n은 2-6, 3-6, 4-6 또는 5-6의 정수이다. 구현예에서, n은 2-4의 정수이다. 구현예에서, n은 6이다. 구현예에서, n은 5이다. 구현예에서, n은 4이다. 구현예에서, n은 3이다. 구현예에서, n은 2이다. 구현예에서, n은 1이다. 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_3-NH_2$이다. 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_3-NH-C(O)-CH_2-NH_2$이다. 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_6-NH_2$이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0749] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E) 또는 (I-E1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-C\equiv C-R^d$이다. 구현예에서, R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-H)의 화합물:



[0750] (I-H), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X], [Y], [Z] 및 R^d는 화학식 (I')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

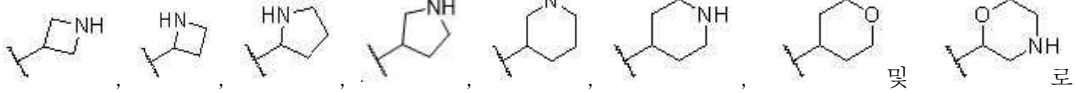
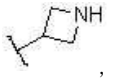
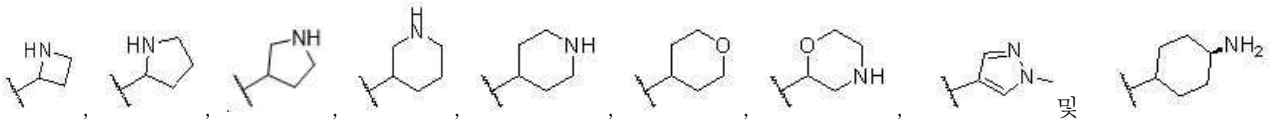
[0751] 구현예에서 본원에서는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I) 또는 (I-H)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^1은 -C=C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0752] 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 C_{1-6}알킬이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나 이상의 R^b로 치환된 메틸렌이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나 이상의 R^b로 치환된 에틸렌이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나의 R^b로 치환된 메틸렌이고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택되는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다.

[0753] 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 -N(R^x)(R^y)이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 하나의 R^b로 치환된 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^b는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, 수소 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다.

[0754] 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴은 독립적으로 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다.

[0755] 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

R^a는  및 로 구성된 군으로부터 선택되는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 구현예에서, R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서 R^a는 ,  및 로 구성된 군으로부터 선택되는 3-15 원 헤테로시클릴이다.

[0756] 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는 각각 수소이다.

[0757] 구현예에서,

[0758] (i) R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0759] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0760] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소, C_{1-6}알킬 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0761] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0762] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0763] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0764] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

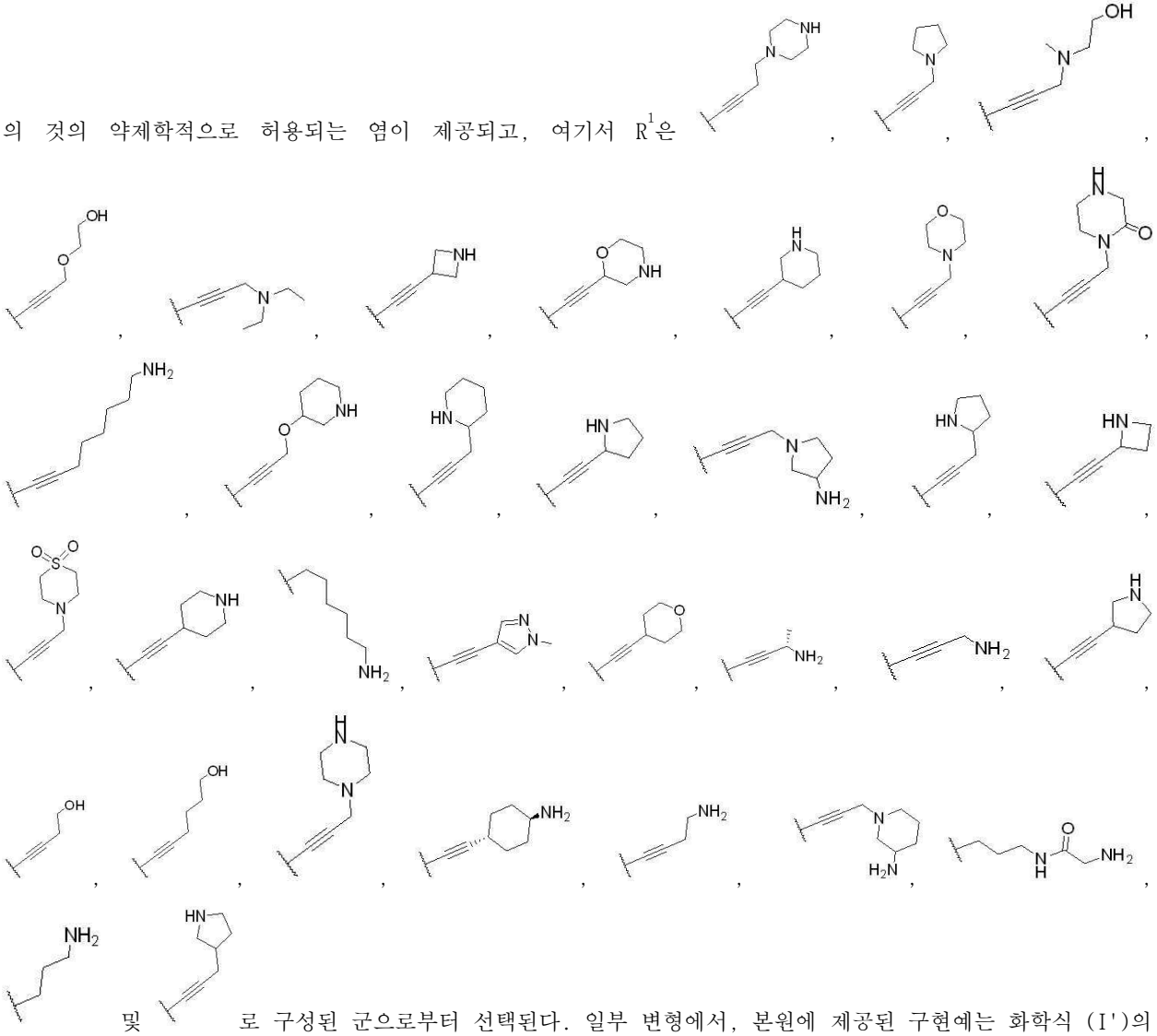
[0765] (ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고,

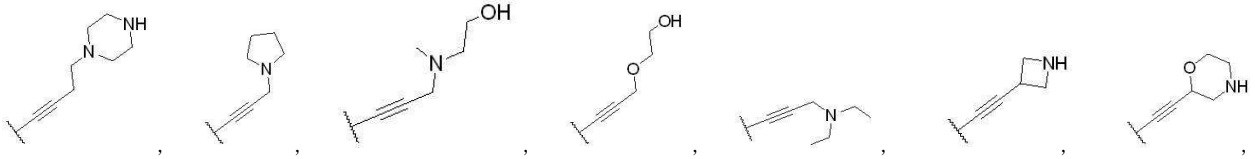
[0766] 여기서

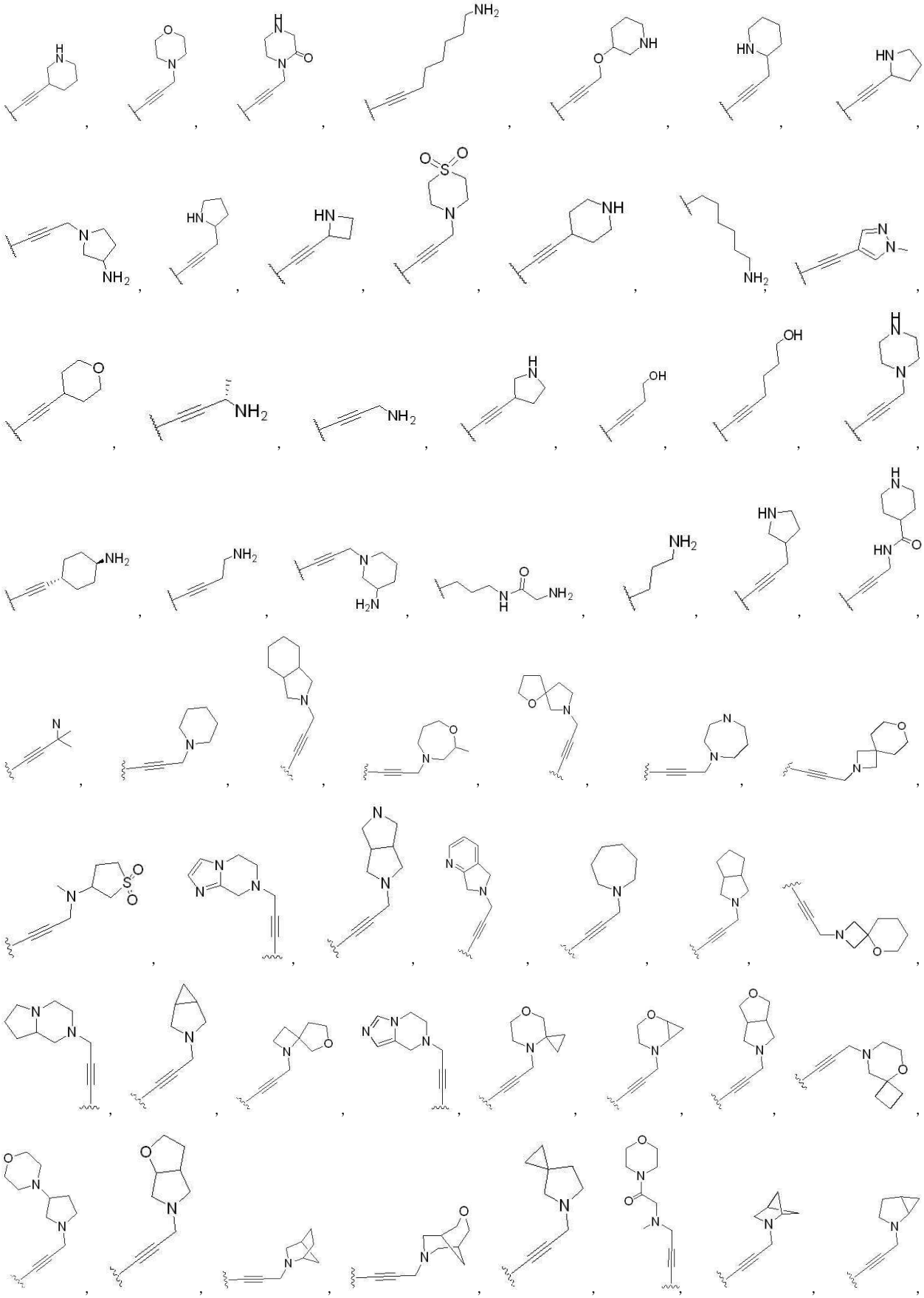
[0767] 각 R^z는, 독립적으로 각 경우에, C_{1-6}알킬 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

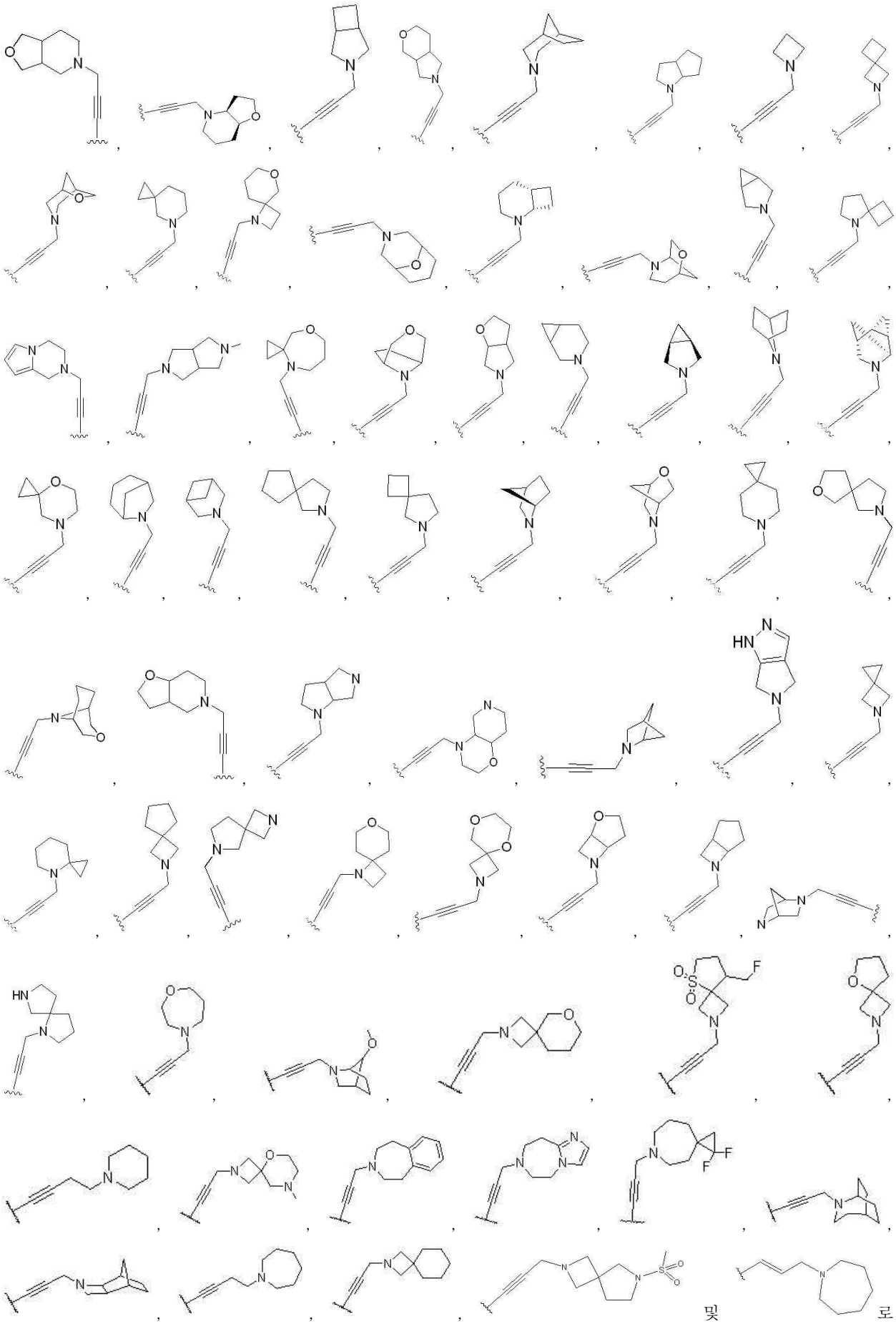
[0768] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 p는 1-6의 정수이고, R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고, R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환된다.

[0769] (iii) -C≡C-R^d이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕시이다.

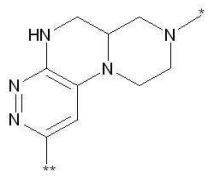
[0770] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은  및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

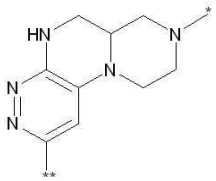
[0771] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예가 제공되고, 여기서 R^1은 

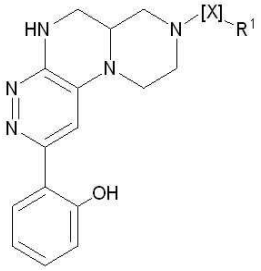




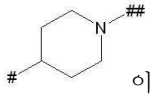
구성된 군으로부터 선택된다.

[0772] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는 (f)  이다.

[0773] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서  는 (f)  이다. 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, [Y]는 부재하고, [Z]는 부재하여, 화학식 (I')의 화합물은 화학식 (I-I)의 화합물:



[0774] (I-I), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 [X] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0775] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I-I)의 화합물이 제공되고, 단, [X]가  이고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는 경우, R^1이 $-(CH_2)_n-R^g$일 때, R^g는 OH가 아니다.

[0776] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I'), 또는 (I-I)의 화합물이 제공되고, 여기서 R^1은:

[0777] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0778] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0779] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-S(O)_2-(C_{1-6}$알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-O-(C_{6-10}$아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0780] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0781] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0782] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0783] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0784] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0785] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0786] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0787] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0788] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[0789] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0790] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[0791] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0792] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, $-C(O)-R^s$, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0793] *p*는 1-6의 정수이고,

[0794] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0795] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0796] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0797] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환되고, 또는 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4- 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4- 내지 12-원 헤테로사이클은 할로, -OH, 옥소, 하나 이상의 -OH, C_3-$_7$시클로알킬, C_1-$_4$알콕시, C_1-$_4$할로알킬 및 $-C(O)-N(R^h)(R^i)$로 선택적으로 치환된 C_1-$_4$알킬로 구성된 군으로부터 선택된 적어도 하나의 치환기로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^h 및 R^i는 각각 독립적으로 H 및 C_1-C_4알킬로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 R^h 또는 R^i의 C_1-C_4알킬은 독립적으로 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고

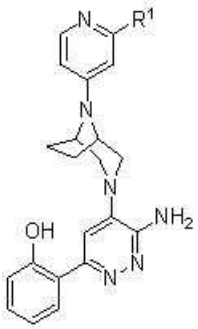
[0798] (c) $-C{=}C-R^d$이고, 여기서 R^d는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^d의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^e로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^e는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^e의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^f로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^f는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시 또는 -C(O)-C_{1-6}알콕

시이다.

[0799] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I') 또는 (I-I)의 화합물이 제공되고, 여기서, R^1은: -C≡C-R^a이고, 여기서 R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -S(O)$_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서, R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다.

[0800] 구현예에서, 본 개시는 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염은 표 1의 화합물로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, 본 개시는 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I')의 화합물, (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염은 표 1의 화합물로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0801] 구현예에서, 화학식 (II')의 화합물



[0802] (II'), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0803] (i) R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[0804] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[0805] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -S(O)$_2$-(C_{1-6}알킬), C_{3-10}시클로알킬, C_{6-10}아릴, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원

헤테로아릴, -O-(C_{6-10}아릴), -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[0806] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0807] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0808] R^c의 C_{6-10}아릴은 하나 이상의 -CN으로 선택적으로 치환되고,

[0809] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0810] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0811] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0812] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0813] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0814] (ii) R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[0815] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고, 그리고

[0816] *n*은 1-6의 정수이고;

[0817] 여기서

[0818] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -N(R^x)(R^y) 또는 -C(O)-N(R^x)(R^y)이고; 그리고

[0819] -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-$(CH_2)_p$-N(R^p)(R^q), -C(O)-R^s, 5-20 원 헤테로사이클, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0820] *p*는 1-6의 정수이고,

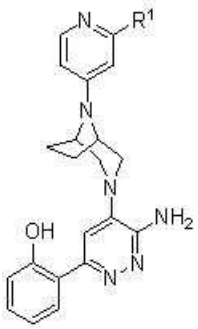
[0821] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고,

[0822] R^s는 C_{1-4}알킬, C_{3-8}시클로알킬 및 -C(O)-C_{1-6}알킬로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 치환기로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로사이클이고,

[0823] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0824] R^x 또는 R^y의 5-20 원 헤테로사이클은 하나 이상의 옥소로 선택적으로 치환된다.

[0825] 구현예에서, 화학식 (II)의 화합물

[0826]  (II), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서:

[0827] R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[0828] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[0829] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[0830] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0831] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0832] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0833] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0834] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0835] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0836] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0837] (ii) R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[0838] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[0839] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고,

[0840] 여기서

[0841] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -N(R^x)(R^y) 또는 -C(O)-N(R^x)(R^y)이고; 그리고

[0842] -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-$(CH_2)_p$-N(R^p)(R^q), 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[0843] p는 1-6의 정수이고,

[0844] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[0845] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[0846] 구현예에서, R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[0847] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0848] (b) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 C_{3-10}시클로알킬이고, 또는

[0849] (c) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 3-15 원 헤테로시클릴이고, 또는

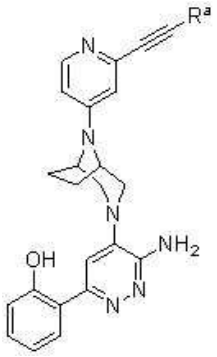
[0850] (d) R^a는 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된 5-20 원 헤테로아릴이고,

[0851] 여기서 R^z는, 독립적으로 각 경우에, C_{1-6}알킬 또는 -N(R^x)(R^y)이고; 그리고

[0852] -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0853] 구현예에서, R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고, R^g는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2 또는 C_{1-6}알킬이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0854] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 -C≡C-R^a여서, 화학식 (II)의 화합물은 화학식 (II-A)의 화합물:



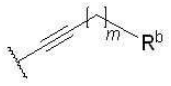
[0855] (II-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현

예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, R^a는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II) 또는 (II-A)의 R^a는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0856] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 화학식 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 C_{1-4}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-4}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 C_{1-3}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-3}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 에틸이고, 여기서 R^a의 에틸은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 에틸이고, 여기서 R^a의 에틸은 하나의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나의 R^b로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0857] 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-(4-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-[$N(R^x)(R^y)$]이고, 여기서 R^x는 H 또는 C_{1-2}알킬이고, R^y는 $-C_{1-2}$알킬-OH이다. 구현예에서, $-R^a-R^b$는 $-C_{1-2}$알킬-C_{1-2}알콕시-OH이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, $-R^a-R^b$는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0858] 구현예에서, R^1은

[0859]  이고, 여기서 *m*은 0-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0860] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0861] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[0862] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고,

[0863] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[0864] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 여기서

[0865] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20

원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0866] 구현예에서, *m*은 0이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, *m* 및 R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

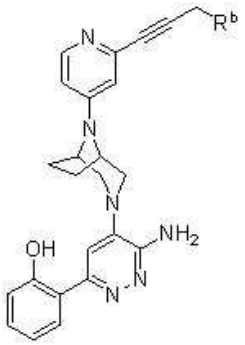
[0867] 구현예에서, *m*은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-CH_2-NH_2$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1-6의 정수이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, *m* 및 R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0868] 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테

로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 1이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, *m* 및 R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0869] 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 여기서 -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-CH_2-NH_2, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, *m*은 2이고 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, *m* 및 R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0870] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 메틸이고, 여기서 R^a의 메틸은 하나의 R^b로 치환되어서, 화학식 (II-A)의 화합물은 화학식 (II-A1)의 화합물:



[0871] (II-A1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성

질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, R^b는 화학식 (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II-A) 또는 (II-A1)의 R^b는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0872] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0873] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 4-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0874] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와

같다.

[0875] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

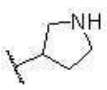
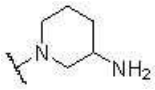
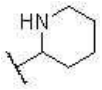
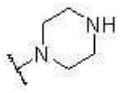
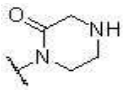
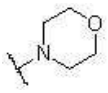
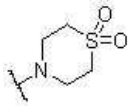
[0876] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고, 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

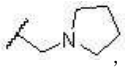
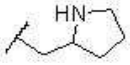
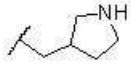
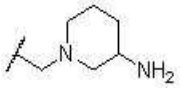
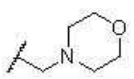
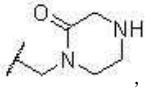
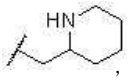
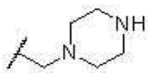
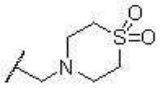
[0877] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 포화 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 포화 5-6 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0878] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐이고, 여기서 R^b의 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, $-C(O)-$(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기

서 R^b 및 R^c는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 R^b 및 R^c는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0879] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐이고, 여기서 R^b의 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐 또는 티오모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$이다. 구현예에서, 각 R^c는 옥소이다. 구현예에서, 각 R^c는 $-NH_2$이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용되고, 여기서 R^b 및 R^c는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 R^b 및 R^c는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에 대해 정의된 바와 같다.

[0880] 전술한 것의 구현예에서, R^b는 , , , , , , , ,  및  로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0881] 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 , , , , , , , ,  및  로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0882] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 9-10 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 9-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또

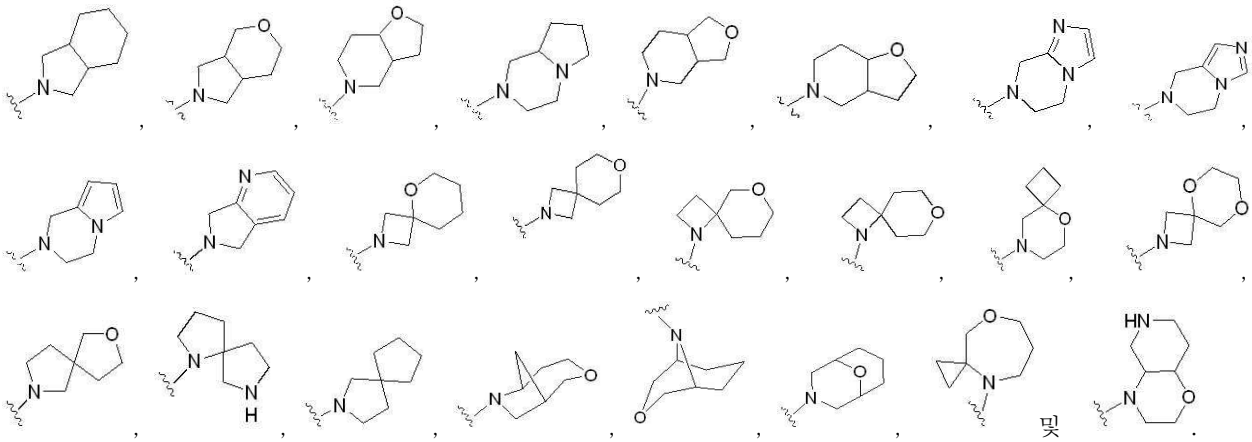
는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0883] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 9-10 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 9-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, $-C_{1-2}$알킬이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0884] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 9-10 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 9-10 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0885] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 9-10 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 9-10 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, $-C_{1-2}$알킬이다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0886] 전술한 것의 구체예에서, R^b는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로사이클이다:

[0887] 

및 .

[0888] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 7-8 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 7-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-

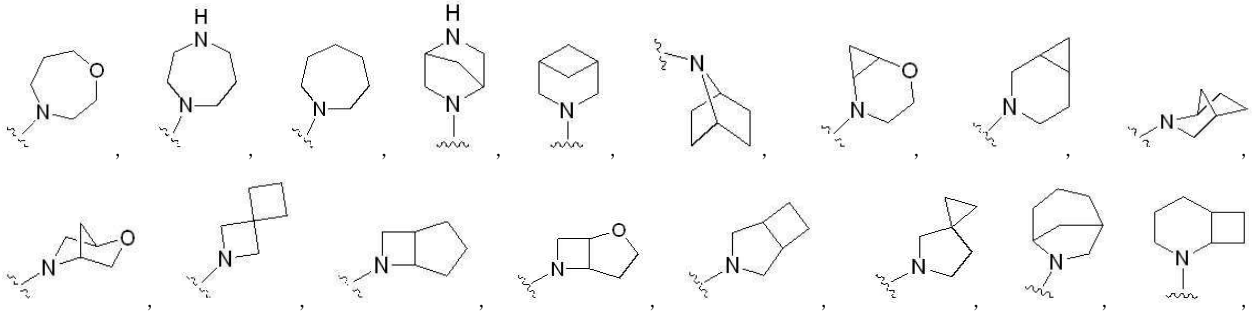
15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

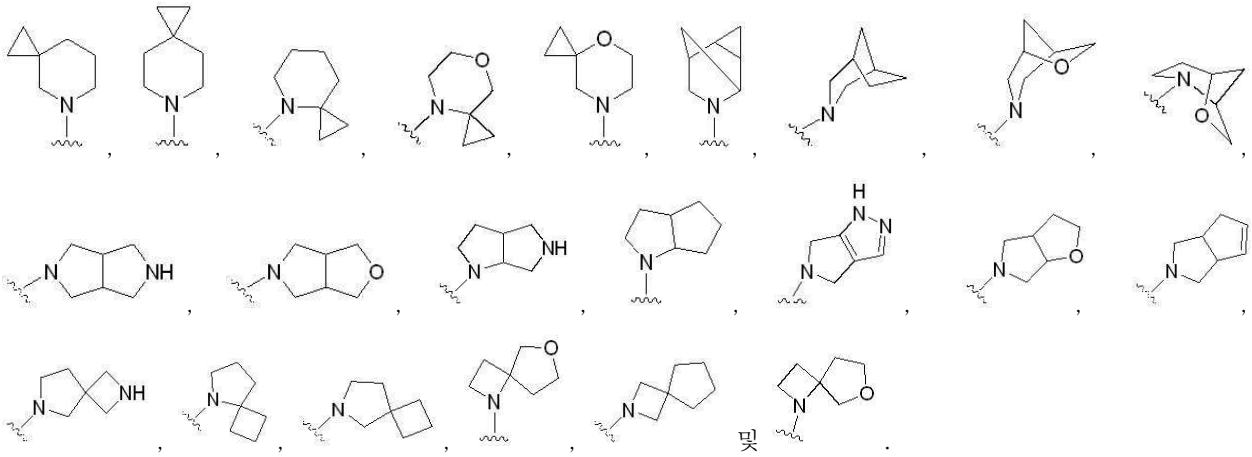
[0889] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 7-8 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 7-8 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -할로, -C1-2알킬, C1-2 알콕시, -C_{1-5}시클로알킬이고, 여기서 C_{1-2}알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0890] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 7-8 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 7-8 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0891] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 7-8 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 7-8 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -할로, -C_{1-2}알킬, C_{1-2}알콕시, -C_{1-5}시클로알킬이고, 여기서 C_{1-2}알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0892] 구현예에서, R^b는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로사이클이다:

[0893] 



[0894] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 4 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

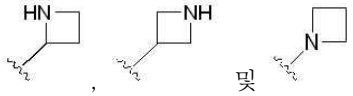
[0895] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 4 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, C_{1-2}알킬, C_{3-5}시클로알킬, 3-5 원 헤테로사이클이고, 여기서 C_{1-2}알킬은 -할로, -CN로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

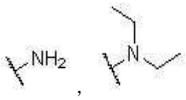
[0896] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 4 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서 R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로 또는 C_{1-6}알콕시로 선택적으로 치환되고, R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

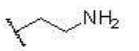
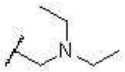
[0897] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 4 원 헤테로사이클이고, 여기서 R^b의 4 원 헤테로시클릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고,

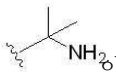
여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, C_{1-2}알킬, C_{3-5}시클로알킬, 3-5 원 헤테로사이클이고, 여기서 C_{1-2}알킬은 -할로, -CN으로 선택적으로 치환된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

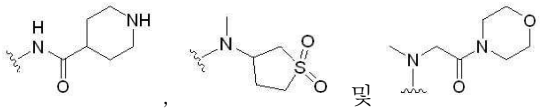
[0898] 전술한 것의 구체예에서, R^b는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로사이클이다:

[0899] 

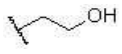
[0900] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 로 구성된 군으로부터 선택된다.

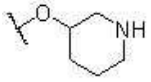
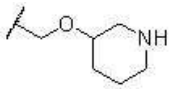
[0901] 전술한 것의 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 화합물이 제공되고, 여기서 R^a는 , , , , 로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b 및 R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

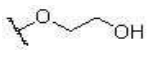
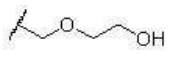
[0902] 구현예에서, R^1 는 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서 R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 C_{1-6}알킬, $-NH_2$이다. 구현예에서, R^a는 이다.

[0903] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 -H, C_{1-6}알킬 또는 3-6 원 헤테로사이클이고, 여기서 각 C_{1-6}알킬은 -옥소, 3-6 원 헤테로사이클로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다.

[0904] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 -OH이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의

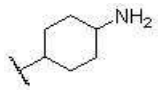
의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  또는  이다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b 및 R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0905] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 -O-(3-15 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(4-10 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(4-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(5-6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, R^b는 -O-(6 원 헤테로시클릴)이다. 구현예에서, -O-(6 원 헤테로시클릴)의 6-원 헤테로시클릴은 포화되고 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함한다. 구현예에서, R^b는 -O-(피페리디닐)이다. 구현예에서, 구현예에서, R^b는  이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  이다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b 및 R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0906] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II), (II-A) 또는 (II-A1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^b는 C_{1-6}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 C_{1-4}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-4}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 C_{1-3}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-3}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 C_{1-2}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-2}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는 에톡시이고, 여기서 R^b의 에톡시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^b는  이다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는  이다. 구현예에서, R^b는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^b 및 R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0907] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 C_{3-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-6}시클로알킬은 하나

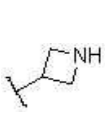
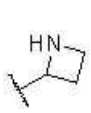
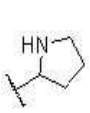
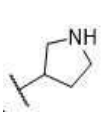
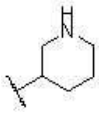
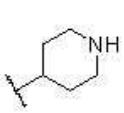
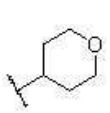
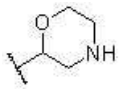
이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

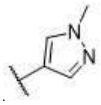
[0908] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 포화 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 포화 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 시클로헥실이고, 여기서 R^a의 시클로헥실은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 시클로헥실이고, 여기서 R^a의 시클로헥실은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 

이다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

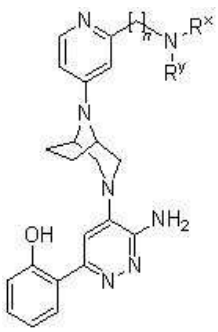
[0909] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 3-10 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-10 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 3-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0910] 구현예에서, R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 포화 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 포화 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는다. 구현예에서, R^a는 적어도 하나의 환형 N 원자 또는 적어도 하나의 환형 O 원자를 포함한다. 구현예에서, R^a는 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐이고, 여기서 R^a의 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐은 독립적으로 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a의 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 테트라히드로-2H-피라닐 또는 모르폴리닐은 치환되지

않는다. 구현예에서, R^a는  ,  ,  ,  ,  ,  ,  및  로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0911] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-A)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^z는 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이다. 구현예에서, R^a는 5-10 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-10 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 적어도 하나의 환형 N 원자를 포함하고 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 5-원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-원 헤테로아릴은 하나 이상의 메틸로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 피라졸릴이고, 여기서 R^a의 피라졸릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는 피라졸릴이고, 여기서 R^a의 피라졸릴은 하나 이상의 메틸로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^a는  이다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^a는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0912] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이다. 전술한 것의 구현예에서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$여서, 화학식 (II)의 화합물은 화학식 (II-B)의 화합물:



[0913] (II-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적

으로 허용되는 염이다.

[0914] 구현예에서, R^1은 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0915] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II) 또는 (II-B)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^x 및 R^y는 모두 H이다. 구현예에서, R^x 및 R^y 중 하나는 H이고 R^x 및 R^y 중 다른 하나는 $-C(O)-CH_2-NH_2$이다. 전술한 것의 구현예에서, n은 1-5, 1-4, 1-3, 또는 1-2의 정수이다. 구현예에서, n은 2-6, 3-6, 4-6 또는 5-6의 정수이다. 구현예에서, n은 2-4의 정수이다. 구현예에서, n은 6이다. 구현예에서, n은 5이다. 구현예에서, n은 4이다. 구현예에서, n은 3이다. 구현예에서, n은 2이다. 구현예에서, n은 1이다. 구현예에서, n, R^x 및 R^y는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 구현예에서, n은 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, n, R^x 및 R^y는 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0916] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-3의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 p는 1-6의 정수이고, R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

[0917] 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 3이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 R^x는 H이고, R^y는 $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$이고, 여기서 p는 1이고, R^p 및 R^q는 각각 H이다.

[0918] 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_3-NH_2$이다. 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_6-NH_2$이다. 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_3-NH-C(O)-CH_2-NH_2$이다.

[0919] 구현예에서, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는 각각 수소이다.

[0920] 구현예에서,

[0921] (i) R^1은 $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[0922] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0923] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 옥소, C_{1-6}알킬

또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[0924] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[0925] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[0926] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

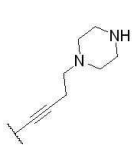
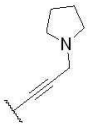
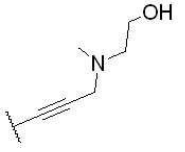
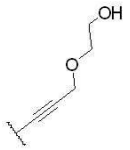
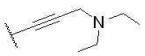
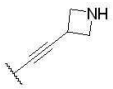
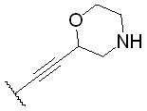
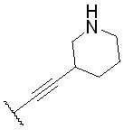
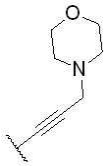
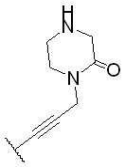
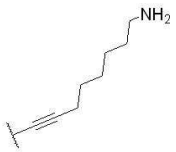
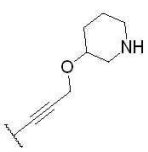
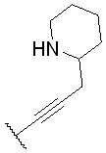
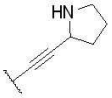
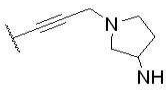
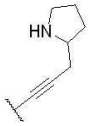
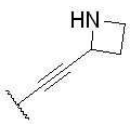
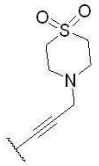
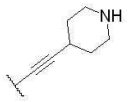
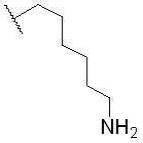
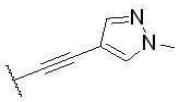
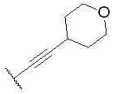
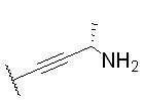
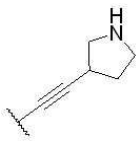
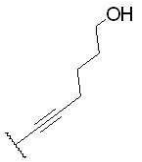
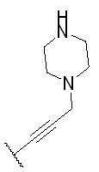
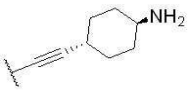
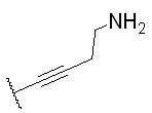
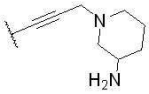
[0927] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

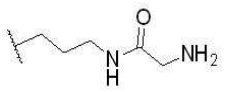
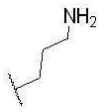
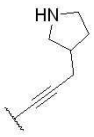
[0928] (ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 *n*은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이고,

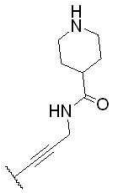
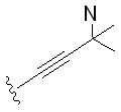
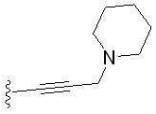
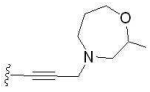
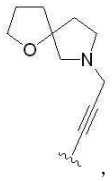
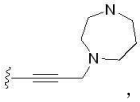
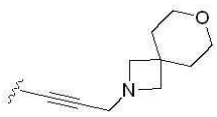
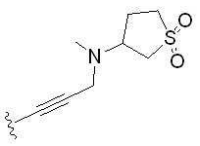
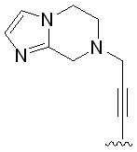
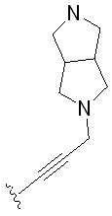
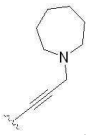
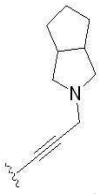
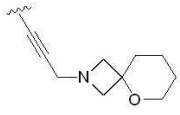
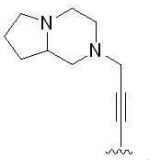
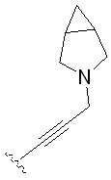
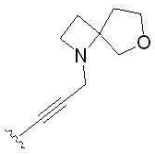
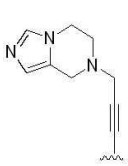
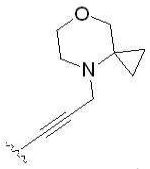
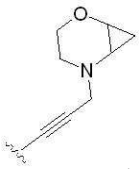
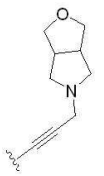
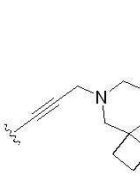
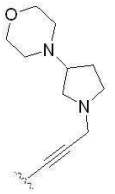
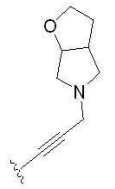
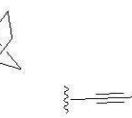
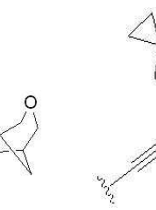
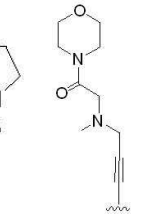
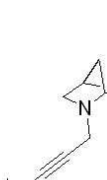
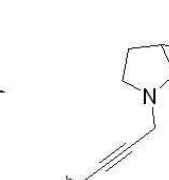
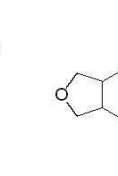
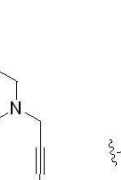
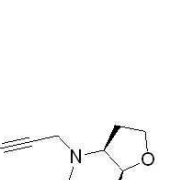
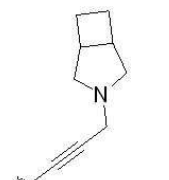
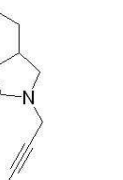
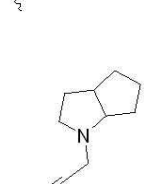
[0929] 여기서

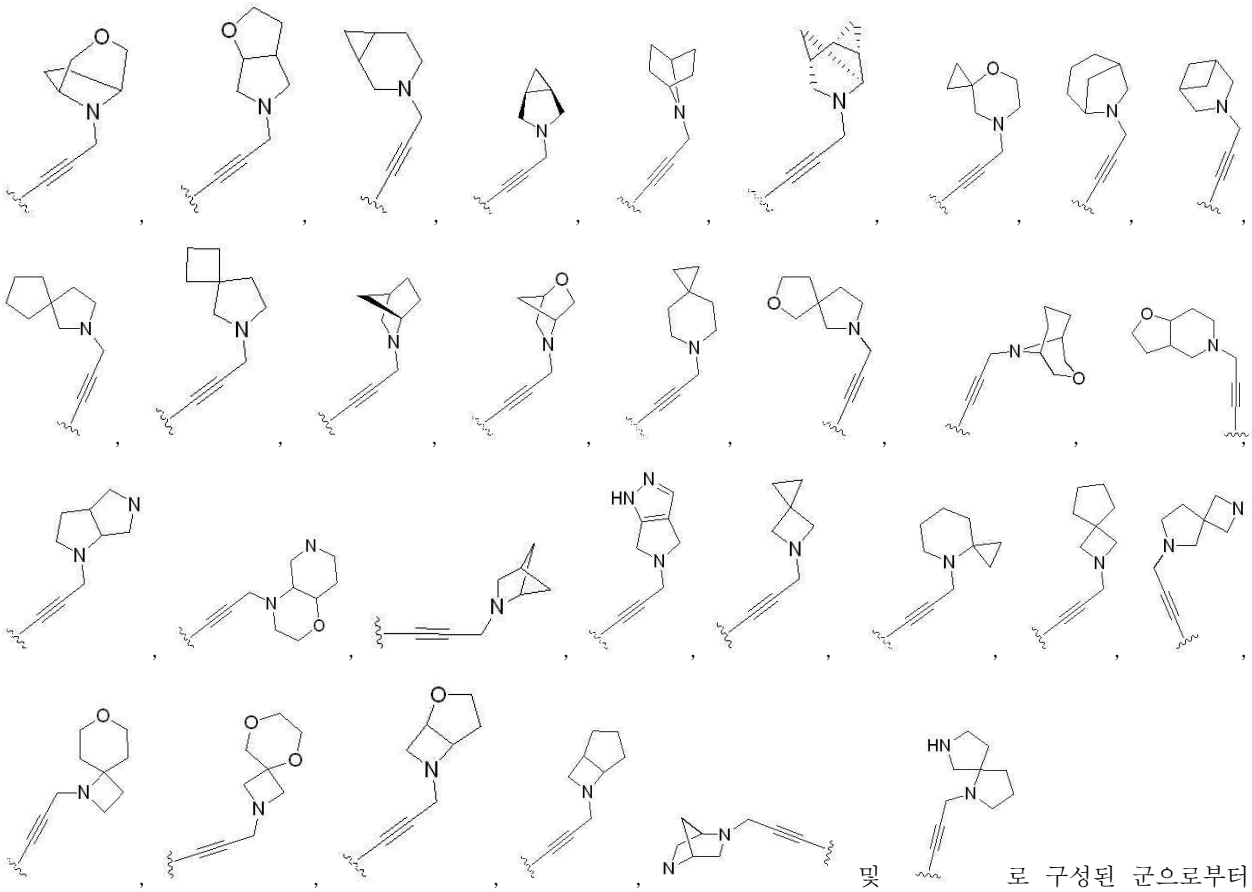
[0930] 각 R^z는, 독립적으로 각 경우에, C_{1-6}알킬 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[0931] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 *p*는 1-6의 정수이고, R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환된다.

[0932] 구현예에서, 본원에서는 화학식 (II)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 R^1은  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,  ,




로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II)의 화합물에 대해 위에 정의된 바와 같다. 일부 변형에서, 본원에 제공된 구현예는 화학식 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예에도 적용된다. 구현예에서, R^1은 화학식 (II')의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다.

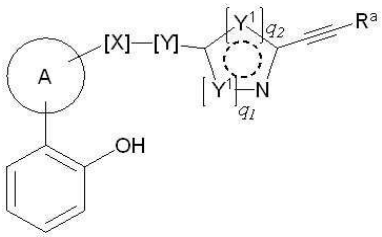
[0933] 구현예에서, R^1은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , .



로 구성된 군으로부터 선택된다.

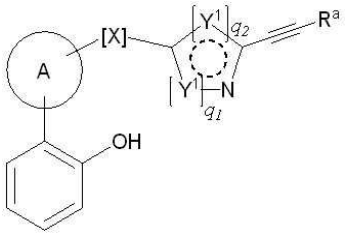
[0934] 구현예에서, 화학식 (I') 또는 (I), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 구현예에서, [Z]는 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 구현예에서, [Z]는 피리디닐이다.

[0935] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J)의 화합물:



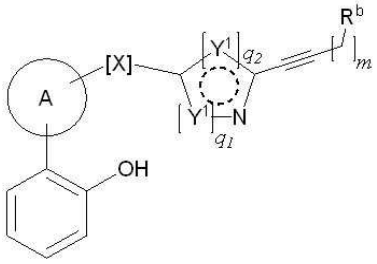
[0936] (I-J), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, , [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J)의 , [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다.

[0937] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J1)의 화합물:



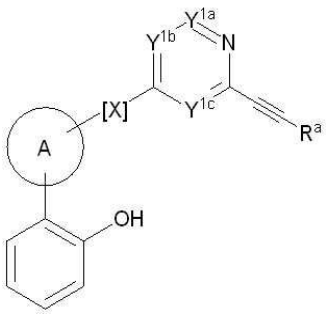
[0938] (I-J1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, , [X] 및 R^a는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J1)의 , [X] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J1)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다.

[0939] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J2)의 화합물:

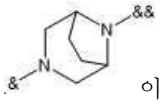


[0940] (I-J2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, m은 1 또는 2이고, , [X] 및 R^b는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J2)의 , [X] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J2)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다.

[0941] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J3)의 화합물:



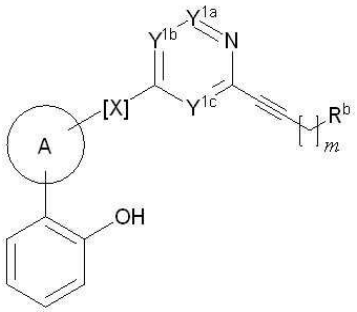
[0942] (I-J3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, , [X] 및

R^a는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J3)의 , [X] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J3)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-J3)의 일부 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 화학식 (I-J3)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고 Y^{1b}는 N이다. 화학식 (I-J3)의 일부 구현예에서, Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 중 적어도 하나는 CH이다. 화학식 (I-J3)의 일부 구현예에서 [X]는 

이고, 여기서 &는 

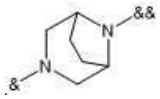
에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고 Y^{1b}는 N이다.

[0943] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J4)의 화합물:



[0944] (I-J4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, m은 1 또는 2이고, 

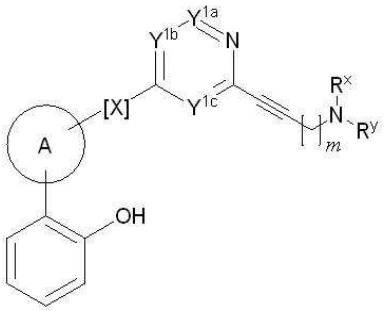
, [X] 및 R^b는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J4)의 

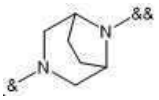
, [X] 및 R^b는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J4)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-J4)의 일부 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 화학식 (I-J4)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고 Y^{1b}는 N이다. 화학식 (I-J4)의 일부 구현예에서, Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 중 적어도 하나는 CH이다. 화학식 (I-J4)의 일부 구현예에서 [X]는 

이고, 여기서 &는 

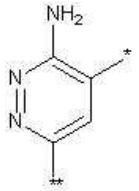
에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다.

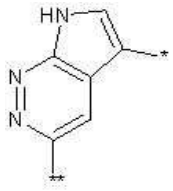
[0945] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J5)의 화합물:

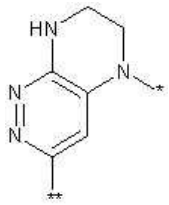


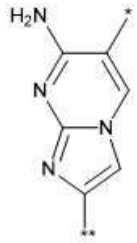
[0946] (I-J5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, *m*은 1 또는 2이고, , [X], R^x 및 R^y는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J4)의 , [X], R^x 및 R^y는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고 Y^{1b}는 N이다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 중 적어도 하나는 CH이다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서 [X]는  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, *m*은 1이다. 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서, *m*은 2이다.

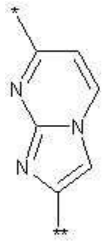
[0947] 화학식 (I-J5)의 일부 구현예에서,  는 다음으로 이루어진 군으로부터 선택된다:

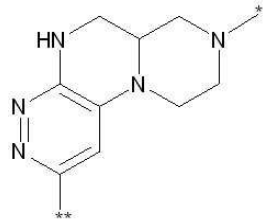
[0948] (a)  ;

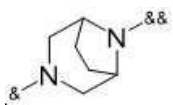
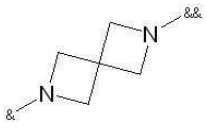
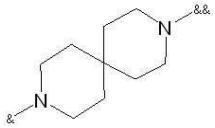
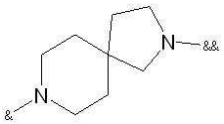
[0949] (b)  ;

[0950] (c)  ;

[0951] (d)  ;

[0952] (e)  ; 및

[0953] (f)  , 여기서, (a)-(f)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 페놀에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

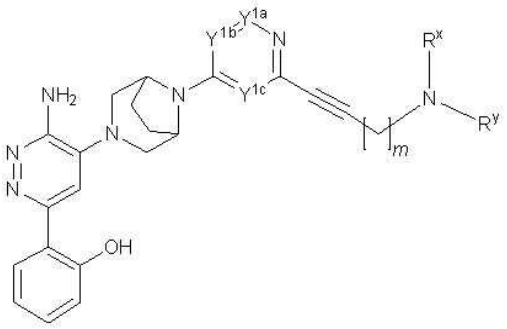
[0954] [X]는 부재하거나  ,  ,  및  로부터 선택되고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[0955] Y^{1a}, X^{1b} 및 X^{1c}는 각각 독립적으로 CH 또는 N이고, 여기서 X_1, X_2 및 X_3 중 적어도 하나는 CH이고;

[0956] *m*은 1 또는 2이고; 그리고

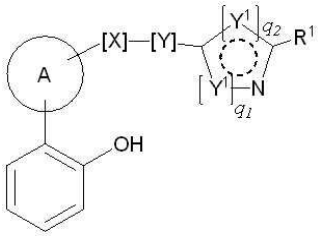
[0957] R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 수소 또는 하나 이상의 히드록시로 선택적으로 치환된 C_1-C_{10}알킬이고, 또는 R^x 및 R^y는, 이들이 부착된 N 원자와 함께, 4 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4 내지 10-원 헤테로사이클은 할로겐, 히드록시, 옥소, 하나 이상의 -OH, C_3-C_7시클로알킬, C_1-C_4알콕시 및 C_1-C_4할로알킬 및 -C(O)-N(R^h)(R^i)로 선택적으로 치환된 C_1-C_4알킬로부터 선택된 적어도 하나의 치환기로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^h 및 R^i는 각각 독립적으로 수소 및 C_1-C_4알킬로부터 선택되고, 여기서 상기 C_1-C_4알킬은 하나 이상의 히드록시로 선택적으로 더 치환된다.

[0958] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J6)의 화합물:



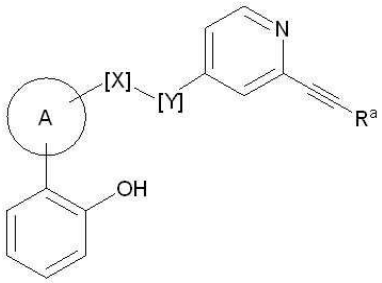
[0959] (I-J6), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 각각은 독립적으로 N 또는 CH이고, m은 1 또는 2이고, R^x 및 R^y는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J6)의 R^x 및 R^y는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-J6)의 화합물의 일부 구현예에서, Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c}는 각각 독립적으로 CH 또는 N이고, 여기서 Y^{1a}, Y^{1b} 및 Y^{1c} 중 적어도 하나는 CH이고, m은 1 또는 2이고, R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 수소 또는 하나 이상의 히드록시로 선택적으로 치환된 C_1-C_{10}알킬이고, 또는 R^x 및 R^y는, 각각이 부착된 N 원자와 함께, 4 내지 12-원 헤테로사이클을 형성하고, 여기서 4 내지 10-원 헤테로사이클은 할로겐, 히드록시, 옥소, C_1-C_4알킬, C_3-C_7시클로알킬, C_1-C_4알콕시 및 C_1-C_4할로알킬 및 -C(O)-N(R^i)(R^h)로부터 선택된 적어도 하나의 치환기 로 선택적으로 치환되고, 여기서 R^i 및 R^h는 각각 독립적으로 수소 및 C_1-C_4알킬로부터 선택되고, 여기서 상기 C_1-C_4알킬은 하나 이상의 히드록시로 더 선택적으로 치환된다. 구현예에서, Y^{1a} 및 Y^{1b}는 각각 CH이다. 구현예에서, Y^{1a}는 CH이고 Y^{1b}는 N이다. 구현예에서, m은 1이다. 구현예에서, m은 2이다.

[0960] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-J7)의 화합물:

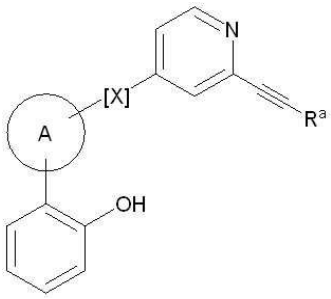
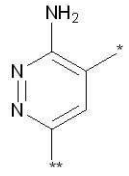
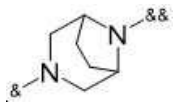
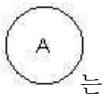


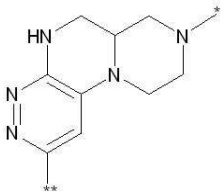
[0961] (I-J7), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 각 Y^1은 독립적으로 N 또는 CH이고, q_1 및 q_2는 각각 정수이고 q_1과 q_2의 합은 2 또는 3이고, , [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-J7)의 , [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다.

[0962] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K)의 화합물:

[0963] 
(I-K), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 , [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K)의 , [X], [Y] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (I-J)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-J)의 일부 구현예에서, [X]는 각각 독립적으로 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-J)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 각각 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 1 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 2 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다.

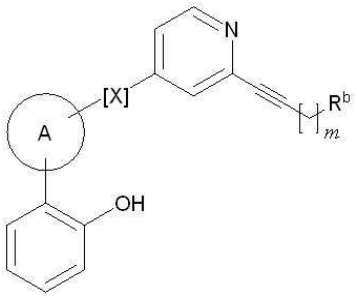
[0964] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K1)의 화합물:

[0965] 
(I-K1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 , [X] 및 R^a는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K1)의 , [X] 및 R^a는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K1)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K1)의 일부 구현예에서, 는 이고 [X]는 이거나, 는



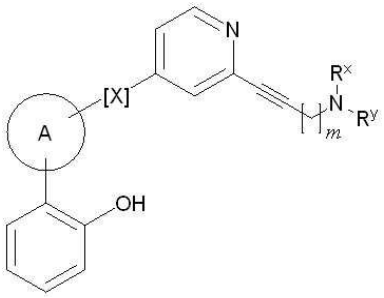
이고 [X]는 부재하고, 여기서 *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내거나, [X] 및 [Y]가 부재하는 경우, *는 [Z]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고; R^a는 $-CH_2-R^b$이고, 여기서 R^b는 -OH, 할로, C_{1-2} 알킬 또는 시클로프로필로 선택적으로 치환된 4- 내지 9-원 헤테로사이클이고, 여기서 각 C_{1-2} 알킬은 -OH 또는 할로로 선택적으로 치환되고, 또는 R^a는 6-원 헤테로사이클이다.

[0966] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K2)의 화합물:



[0967] (I-K2), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서  , [X] 및 R^b는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K2)의  , [X] 및 R^b는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K2)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다.

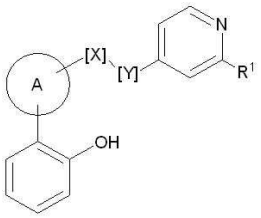
[0968] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K3)의 화합물:



[0969] (I-K3), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서  , [X], R^x, 및 R^y는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K3)의  , [X], R^x 및 R^y는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K3)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤

테로아릴이다.

[0970] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K4)의 화합물:

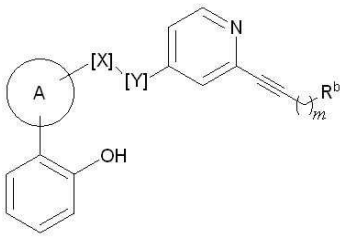


[0971] (I-K4), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 

, [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K4)의 

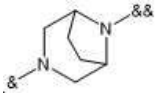
, [X], [Y] 및 R^1은 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K4)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (I-K4)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K4)의 일부 구현예에서, [X]는 각각 독립적으로 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K4)일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 각각 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 1 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 2 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다.

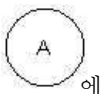
[0972] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K5)의 화합물:



[0973] (I-K5), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 m은 1 또는 2이고, 

, [X], [Y] 및 R^b는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K5)의 

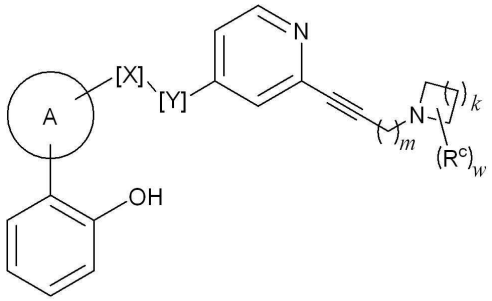
, [X], [Y] 및 R^c는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [X]는 각각 독립적으로 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K5)일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 각각 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 1 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 2 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 

이고, 여기서 &는 

에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의

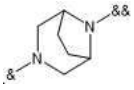
R^c로 선택적으로 치환된 적어도 하나의 N을 포함하는 모노시클릭 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 적어도 하나의 N을 포함하는 폴리시클릭 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 적어도 하나의 N을 포함하는 접합 폴리시클릭 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K5)의 일부 구현예에서, R^b는 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환된 적어도 하나의 N을 포함하는 스피로시클릭 폴리시클릭 헤테로시클릴이다.

[0974] 일부 구현예에서, 본원에서는 화학식 (I')의 화합물이 제공되고, 여기서 화합물은 화학식 (I-K6)의 화합물:



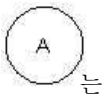
[0975] (I-K6), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서 m은 1 또는 2이고, k는 1-4의 정수이고, w는 0-12의 정수이고 

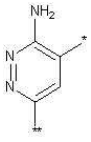
, [X], [Y] 및 R^c는 화학식 (I)의 화합물에 대해 위에 또는 본원의 다른 곳에서 정의된 바와 같다. 또 다른 변형에서, 화학식 (I-K6)의 

, [X], [Y] 및 R^c는 화학식 (I')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재한다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [X]는 각각 독립적으로 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 각각 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 1 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 적어도 2 개의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 화학식 (I-K6)의 일부 구현예에서, [Y]는 부재하고 [X]는 

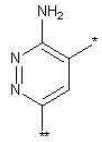
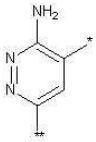
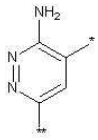
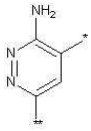
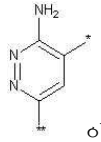
이고, 여기서 &는 

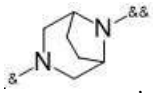
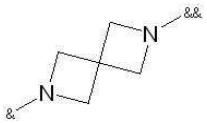
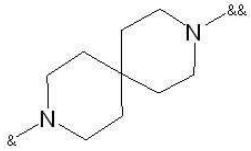
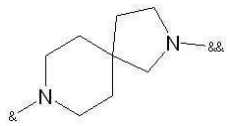
에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다. 일부 구현예에서 w는 0이다. 일부 구현예에서 w는 1이다. 일부 구현예에서 w는 2이다. 일부 구현예에서, w는 3이다. 일부 구현예에서, w는 1 내지 12, 1 내지 10, 1 내지 8, 1 내지 6, 또는 1 내지 4의 정수이다. 일부 구현예에서, k는 4이다. 일부 구현예에서, k는 3이다. 일부 구현예에서, k는 2이다. 일부 구현예에서, k는 1이다. 일부 구현예에서, k는 4이고 w는 0 내지 3의 정수이다. 일부 구현예에서, k는 4이고, m은 1이고, w는 0 내지 3의 정수이다.

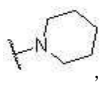
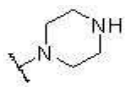
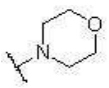
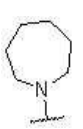
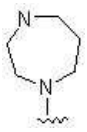
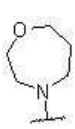
[0976] 구현예에서, 화학식 (I') 또는 (I), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공되고, 여기서 

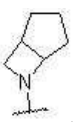
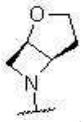
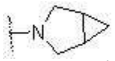
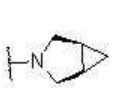
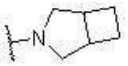
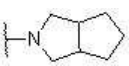
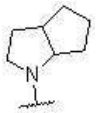
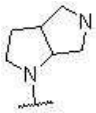
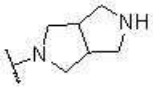
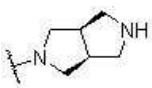
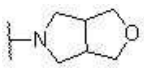
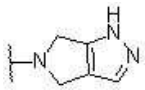
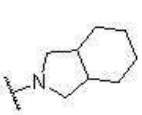
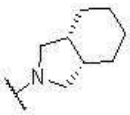
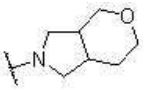
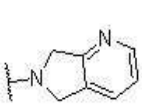
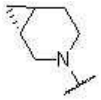
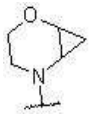
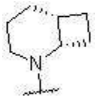
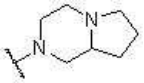
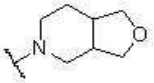
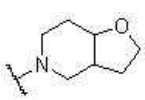
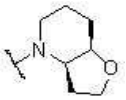
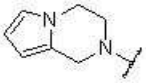
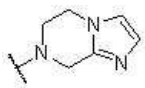
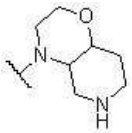
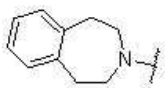
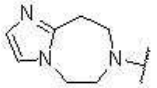
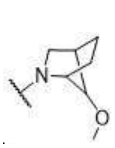
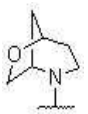
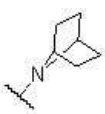
는 

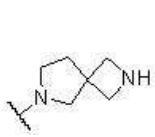
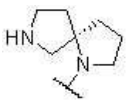
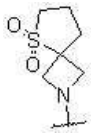
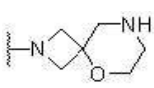
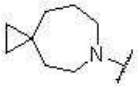
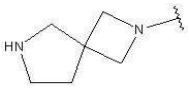
이고, [Z]는 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 구현예에서, 


는 이고, [Z]는 피리디닐이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 5-20 원 헤테로아릴이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 적어도 둘의 질소 헤테로원자를 포함하는 3-15 원 헤테로시클릴이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 적어도 하나의 질소 헤테로원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다. 구현예에서, 
는 
이고, [Z]는 피리디닐이고, [X]는 적어도 둘의 질소 헤테로원자를 포함하는 5-20 원 헤테로아릴이다.

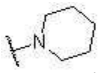
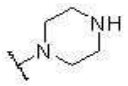
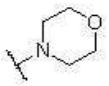
[0977] 화학식 (I'), (I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5)의 화합물의 일부 구현예에서, [X]는 부재하거나 
, 
, 
및 
로부터 선택되고, 여기서 &는 
에 대한 부착점을 나타내고 &&는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타낸다.

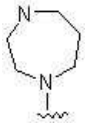
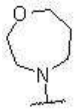
[0978] 화학식 (I'), (I), (I-J), (I-K) 및 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물의 일부 구현예에서, R^b는 모노시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 모노시클릭 헤테로사이클은 
, 
, 
, 
, 
, 
, 
, 및 
로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^b는

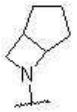
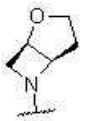
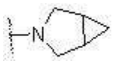
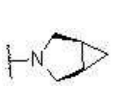
접합 비시클릭 헤테로사이클이다. 구현예에서, 접합 비시클릭 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^b는 다리걸친 헤테로사이클이다. 구현예에 다리걸친 헤테로사이클은 , , , , , , , , , , , , , , , , , , , , 및 로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^b는 스피로 헤테로사이클이다. 구현예에서, 스피로 헤테로사이클은 ,

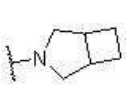
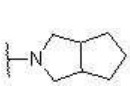
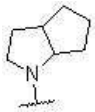
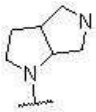
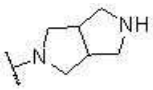
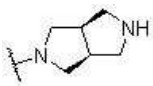
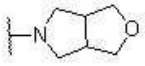





및

로 구성된 군으로부터 선택된다.

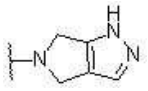
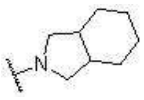
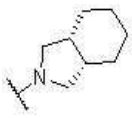
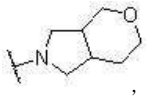
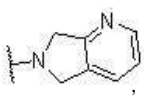
[0979] 화학식 (I'), (I), (I-J), (I-K) 및 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물의 일부 구현예에서, R^a는 모노시클릭 헤테로사이클이다. 일부 구현예에서, 모노시클릭 헤테로사이클은

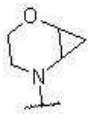





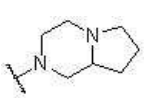
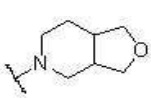
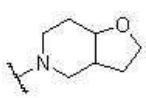


및

로 구성된 군으로부터 선택된다. 일부 구현예에서, R^a는 접합 비시클릭 헤테로사이클이다. 구현예에서, 접합 비시클릭 헤테로사이클은







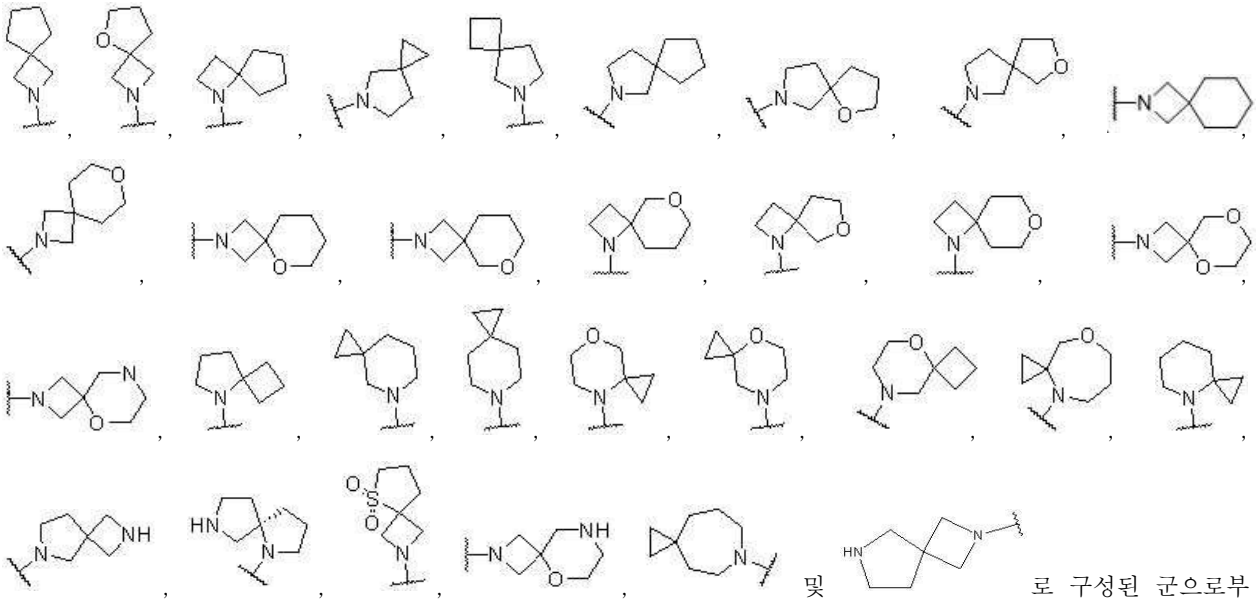




및

로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^a는 다리걸친 헤테로사이클이다. 구현예에서 다리걸친 헤테로사이클은

및

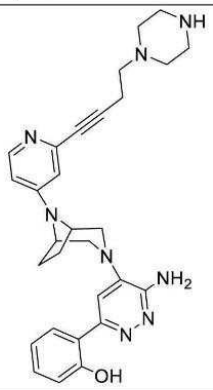
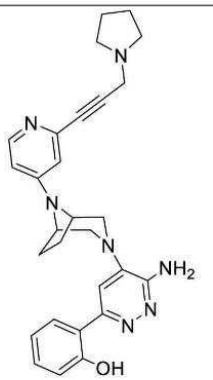
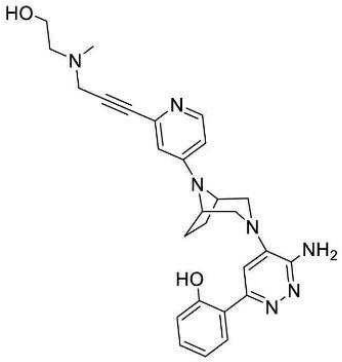
로 구성된 군으로부터 선택된다. 구현예에서, R^a는 스피로 헤테로사이클이다. 구현예에서, 스피로 헤테로사이클은



터 선택된다.

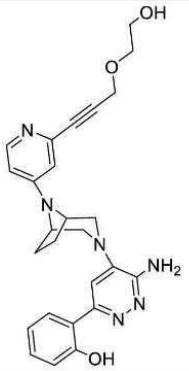
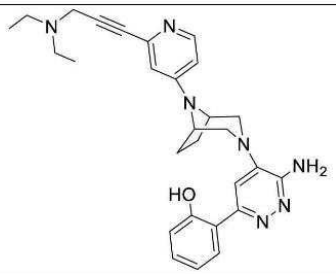
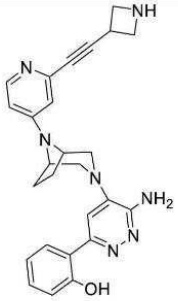
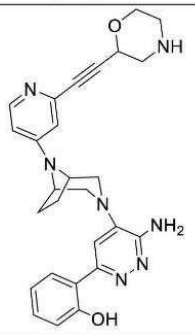
[0980] 구현예에서, 본 개시는 화학식 (I), (I'), (II) 또는 (II')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 관한 것이고, 여기서 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염은 표 1의 화합물로 구성된 군으로부터 선택된다.

[0981] 표 1.

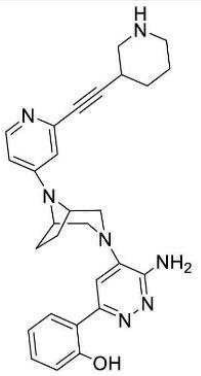
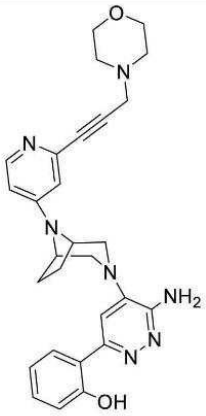
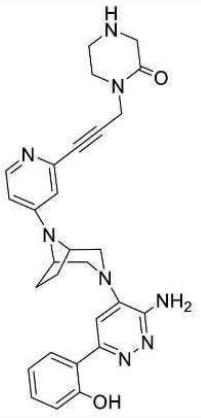
번호	구조	명칭
1		2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-(피페라진-1-일)부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
2		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
3		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((2-히드록시에틸)(메틸)아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

[0982]

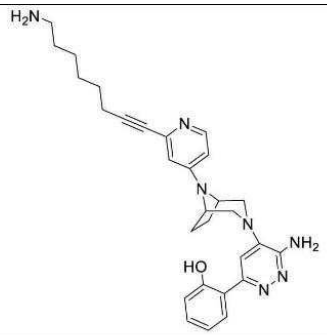
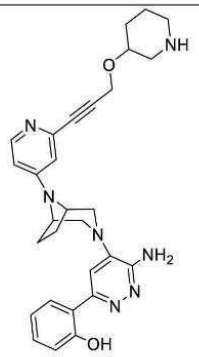
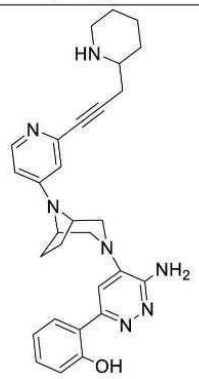
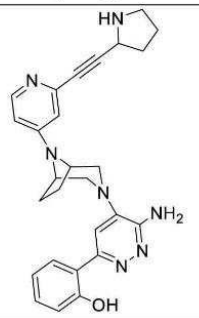
[0983]

4		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(2-히드록시에톡시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
5		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(디에틸아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
6		2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
7		2-(6-아미노-5-(8-(2-(모르폴린-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

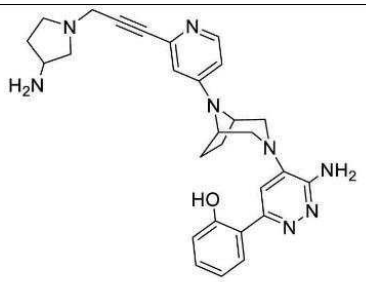
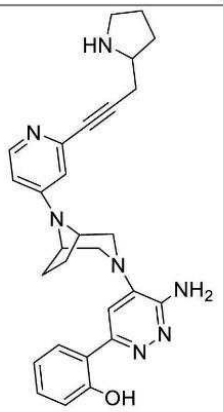
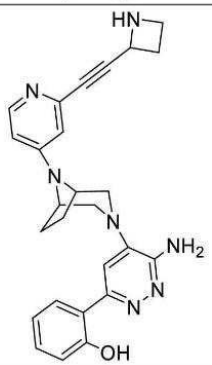
[0984]

8		2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
9		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
10		1-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)피페라진-2-온

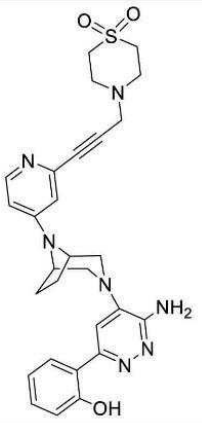
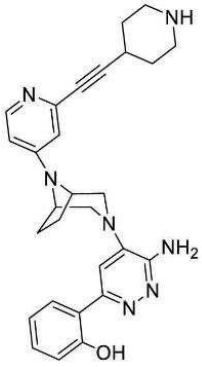
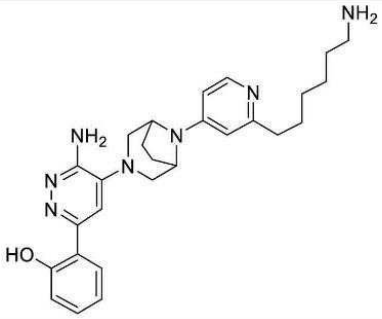
[0985]

11		2-(6-아미노-5-(8-(2-(8-아미노옥트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
12		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-3-일옥시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
13		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
14		2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

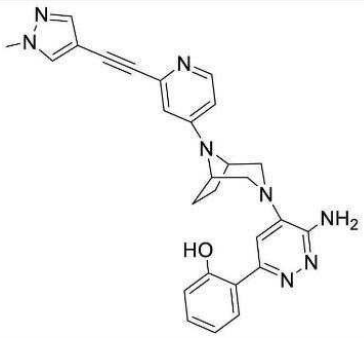
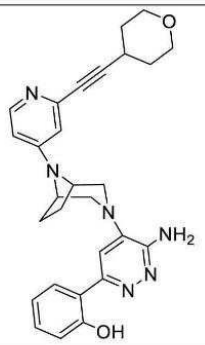
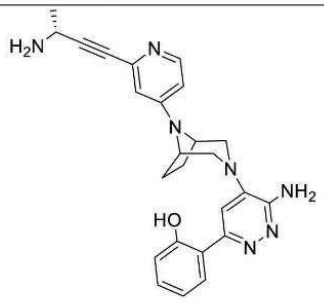
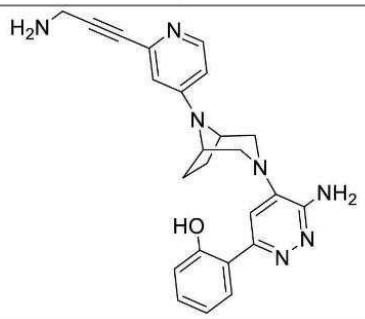
[0986]

15		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
16		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
17		2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

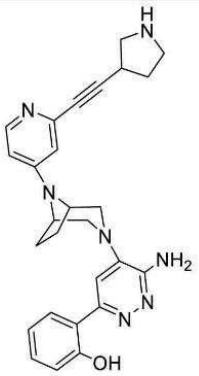
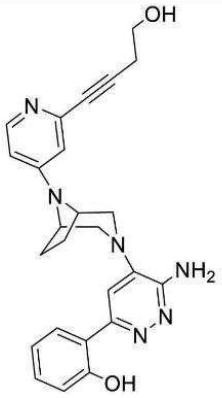
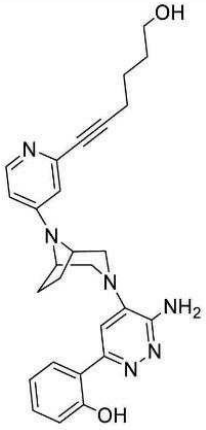
[0987]

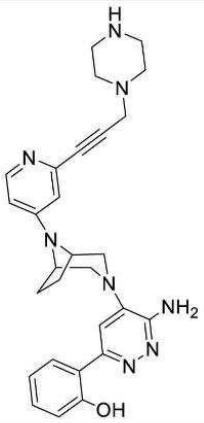
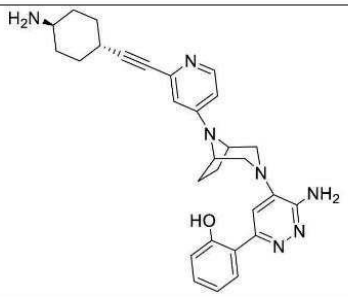
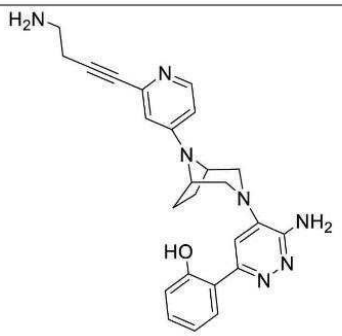
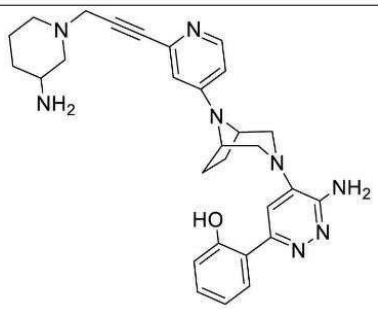
18		4-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)티오모르폴린 1,1-디옥사이드
19		2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-4-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
20		2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-아미노헥실)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

[0988]

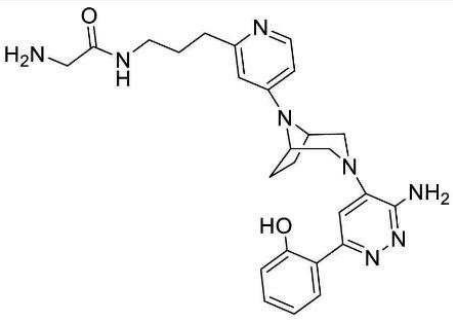
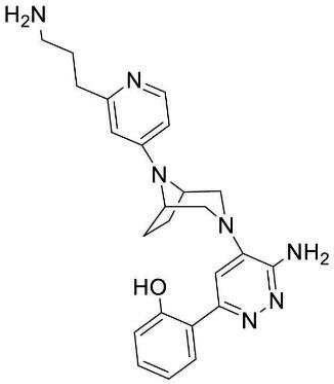
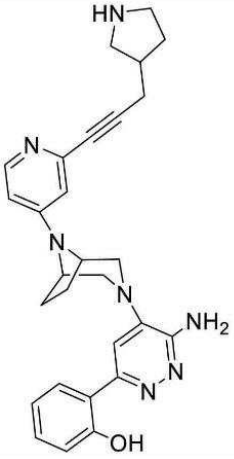
21		2-(6-아미노-5-(8-(2-((1-메틸-1H-피라졸-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
22		2-(6-아미노-5-(8-(2-((테트라히드로-2H-피란-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
23		2-(6-아미노-5-(8-(2-((R)-3-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
24		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

[0989]

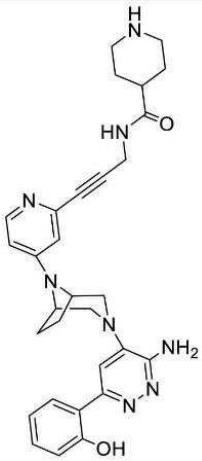
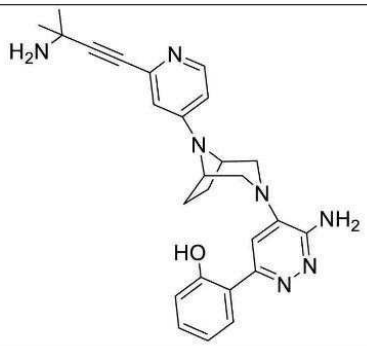
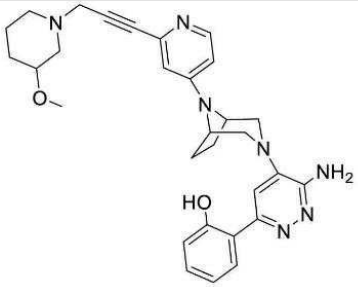
25		2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
26		2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-히드록시부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
27		2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-히드록시헥스-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

28		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페라진-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
29		2-(6-아미노-5-(8-(2-(((1r,4r)-4-아미노시클로헥실)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
30		2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
31		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

[0990]

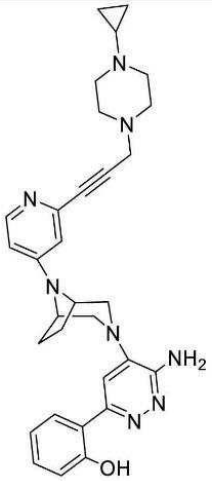
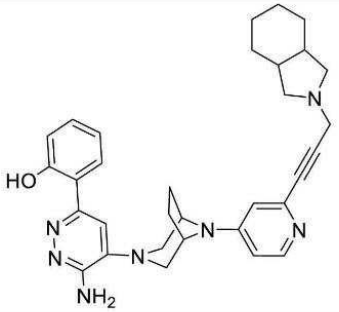
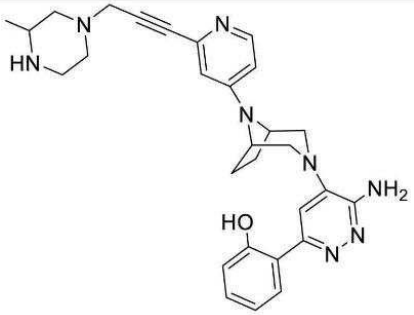
32		2-아미노-N-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로필)아세트아미드
33		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로필)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀
34		2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-3-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀

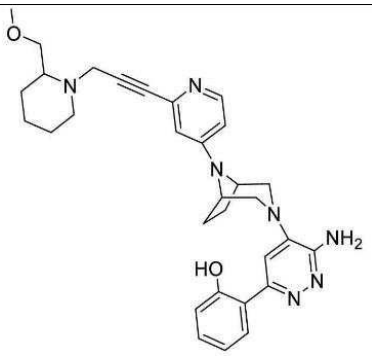
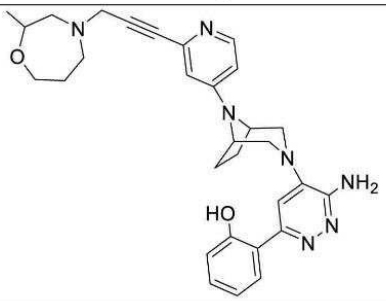
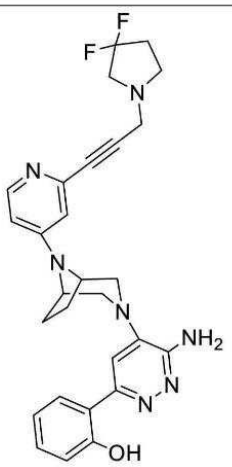
[0991]

35		N-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르복스아미드
36		2-[6-아미노-5-[8-[2-(3-아미노-3-메틸-부트-1-이닐)-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
37		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[0992]

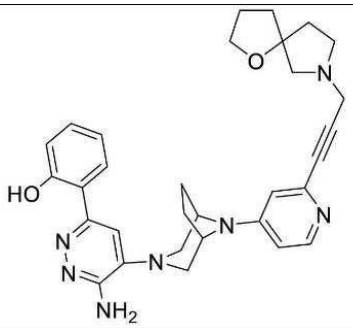
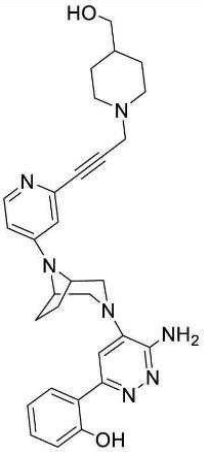
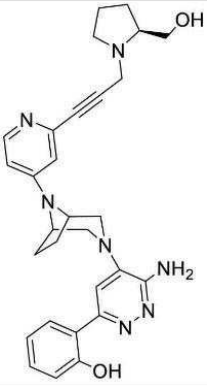
[0993]

38		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-시클로프로필피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
39		2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
40		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

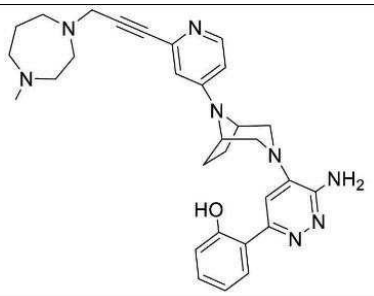
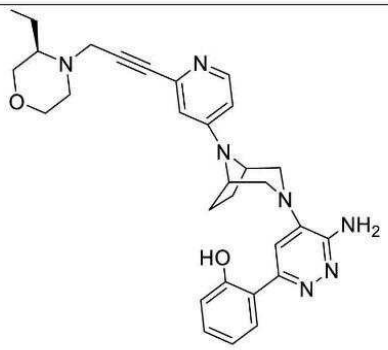
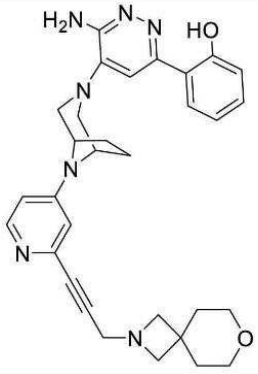
41		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(메톡시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
42		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
43		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

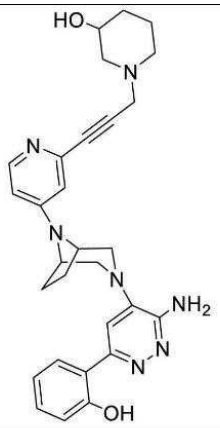
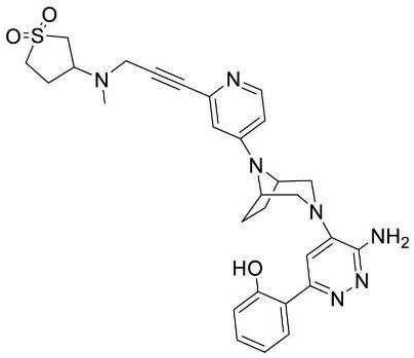
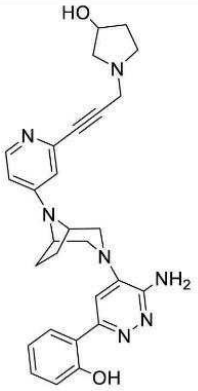
[0994]

[0995]

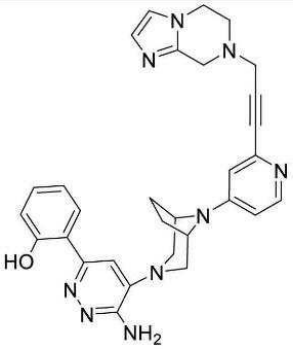
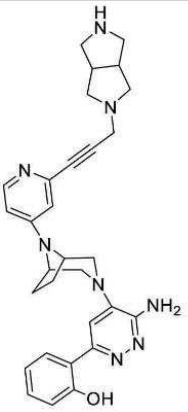
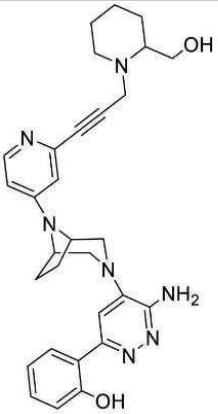
44		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
45		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
46		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[0996]

47		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1,4-디아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
48		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3R)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
49		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

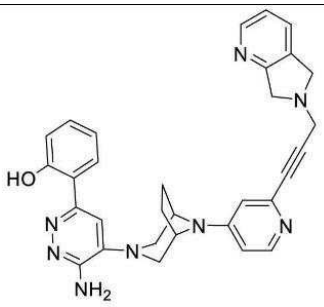
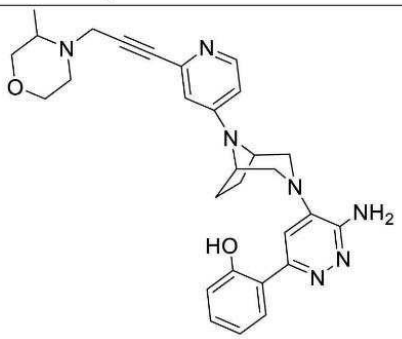
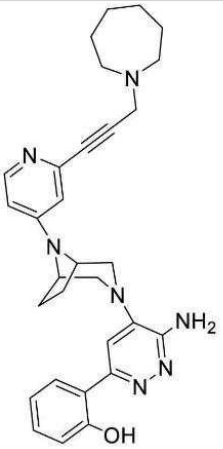
50		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-올
51		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1,1-디옥소티올란-3-일)-메틸-아미노]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
52		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피롤리딘-3-올

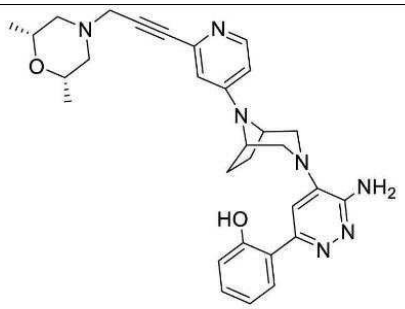
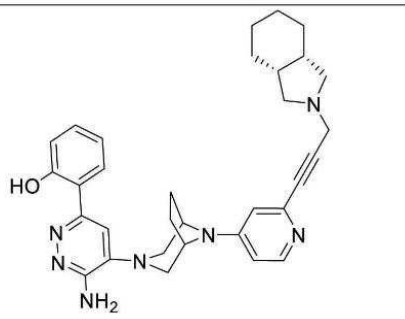
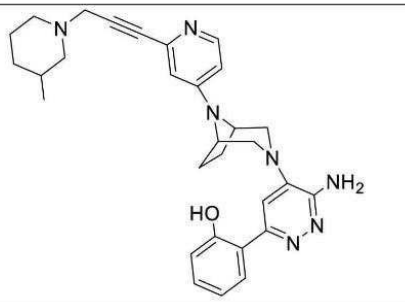
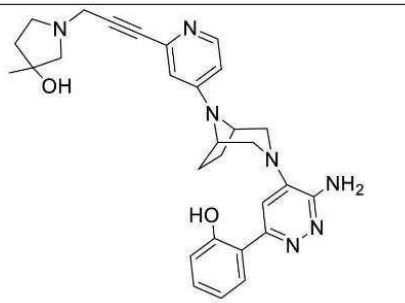
[0997]

53		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,2-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
54		2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로-1H-피롤로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
55		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[0998]

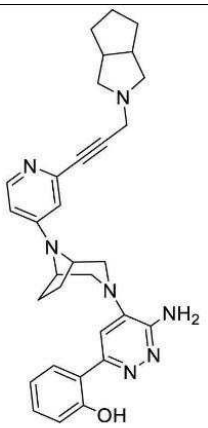
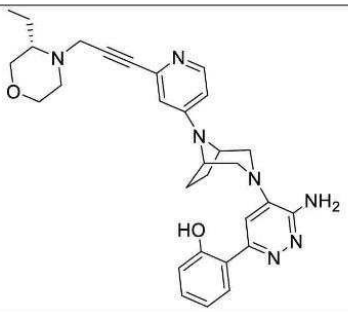
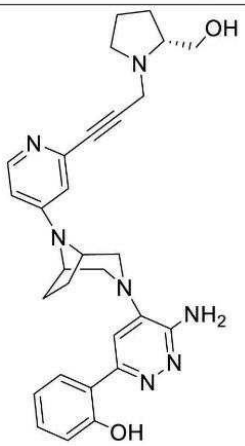
[0999]

56		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,7-디히드로피롤로[3,4-b]피리딘-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
57		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
58		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

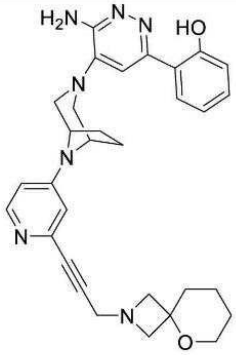
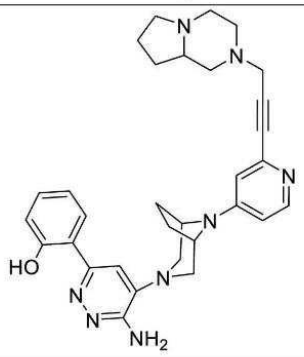
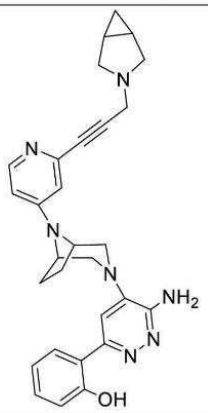
59		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S,6R)-2,6-디메틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
60		2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aR)-1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
61		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
62		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-피롤리딘-3-올

[1000]

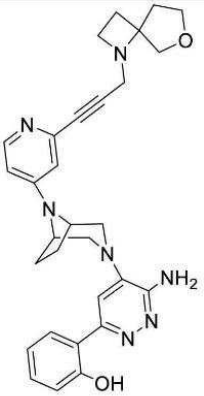
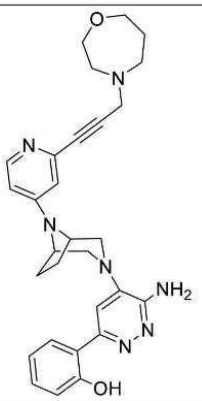
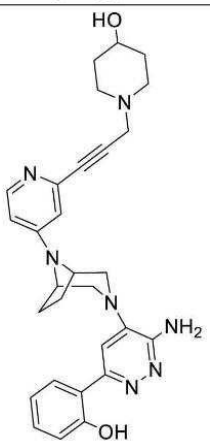
[1001]

63		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-1H-시클로펜타[c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
64		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
65		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2R)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

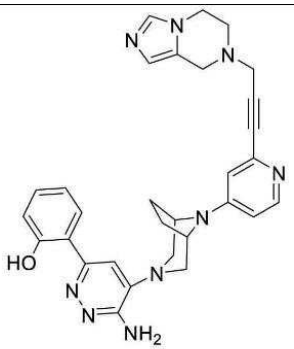
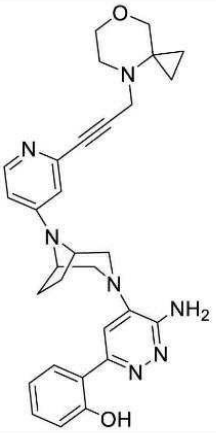
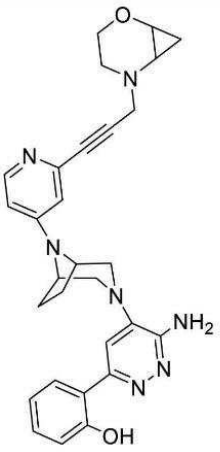
[1002]

66		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
67		2-[5-[8-[2-[3-(3,4,6,7,8,8a-헥사히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
68		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

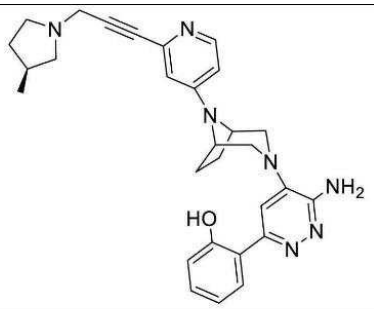
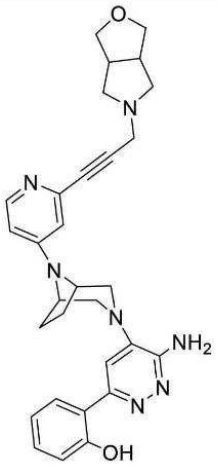
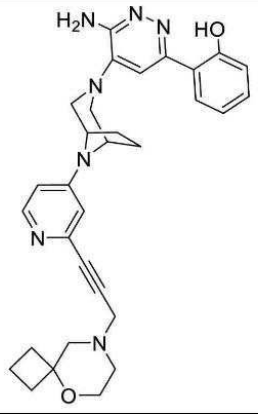
[1003]

69		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
70		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
71		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-올

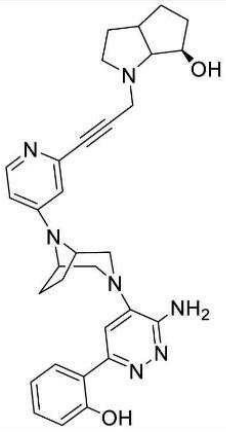
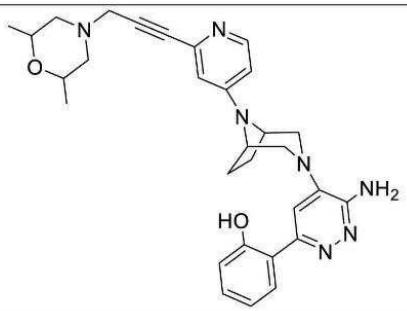
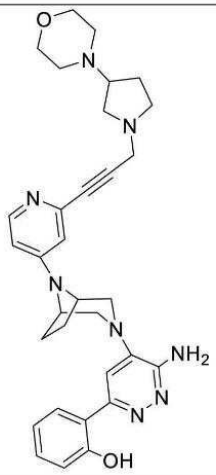
[1004]

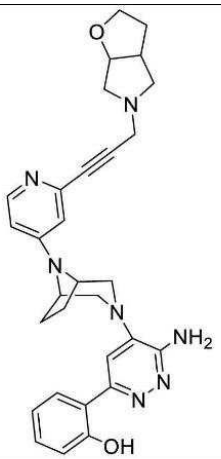
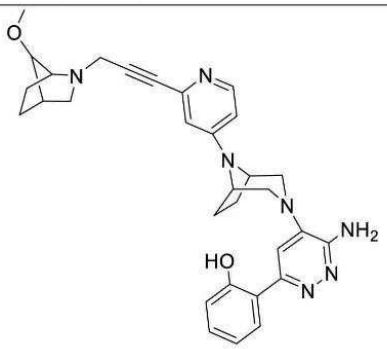
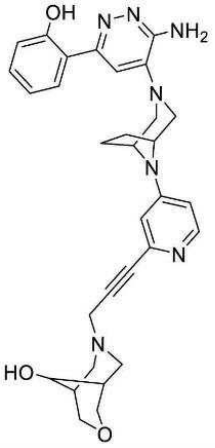
72		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,5-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
73		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
74		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[4.1.0]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1005]

75		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메틸피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
76		2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
77		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-8-아자스피로[3.5]노난-8-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

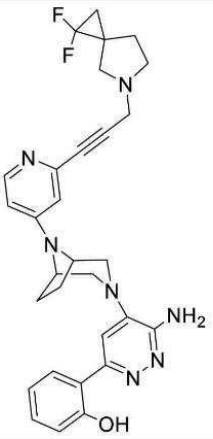
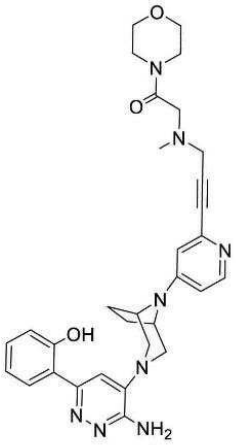
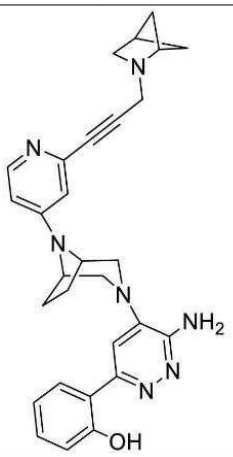
[1006]

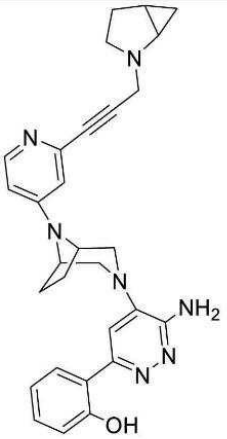
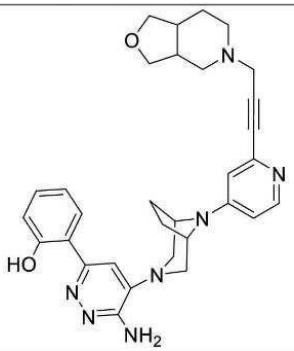
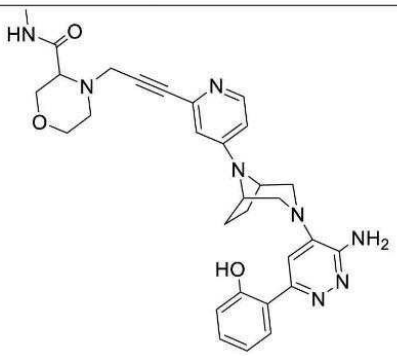
78		(6R)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-6-올
79		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,6-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
80		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

81		2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
82		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메톡시-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
83		7-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-옥사-7-아자비시클로[3.3.1]노난-9-올

[1007]

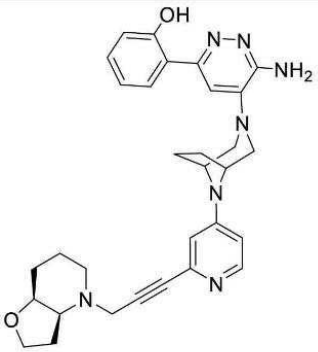
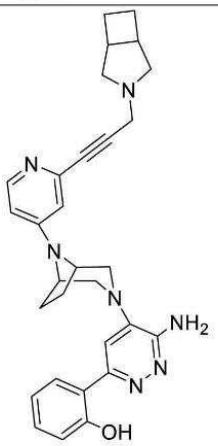
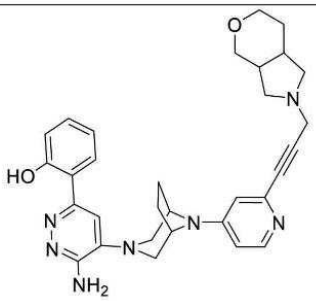
[1008]

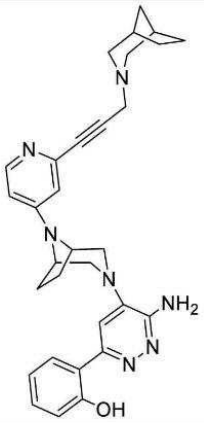
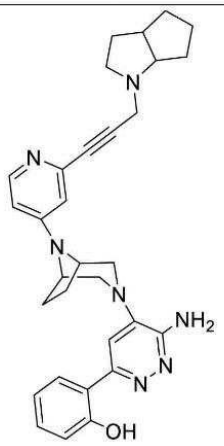
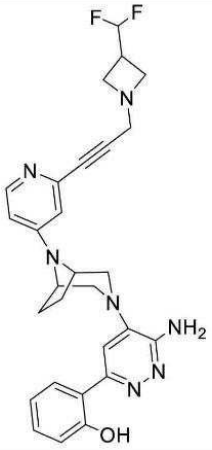
84		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.4]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
85		2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐-메틸-아미노]-1-모르폴리노-에탄온
86		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

87		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.1.0]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
88		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-푸로[3,4-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
89		4-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-모르폴린-3-카르복스아미드

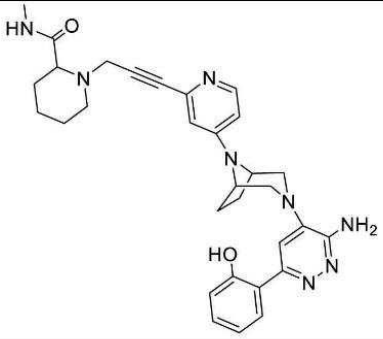
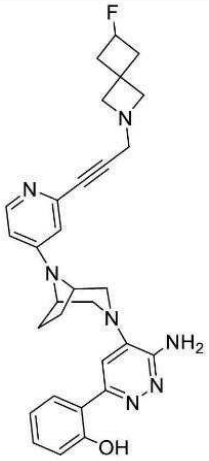
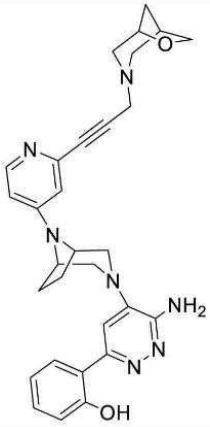
[1009]

[1010]

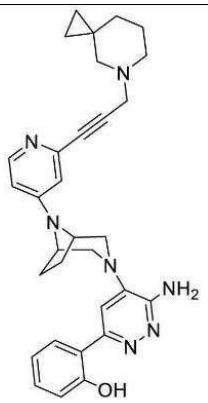
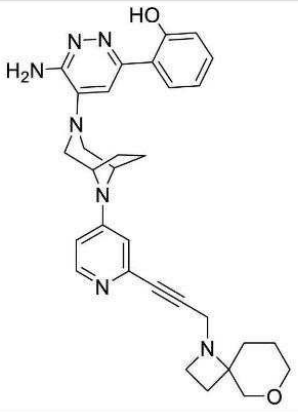
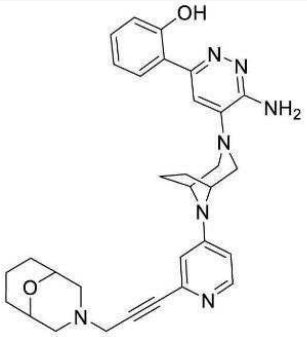
90		2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aS)-3,3a,5,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-b]피리딘-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
91		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.0]헵탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
92		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-피라노[3,4-c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀

93		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
94		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
95		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(디플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1011]

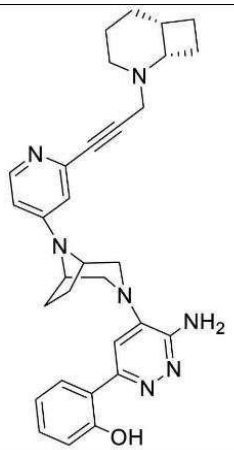
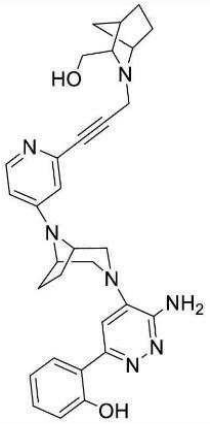
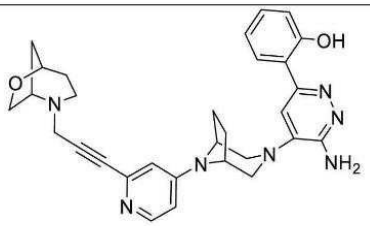
96		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피페리딘-2-카르복스아미드
97		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-플루오로-2-아자스피로[3.3]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
98		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1012]

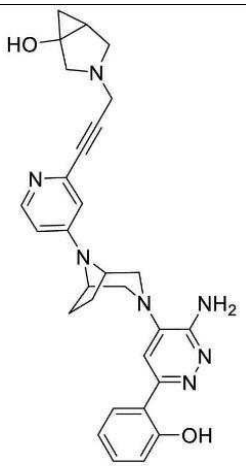
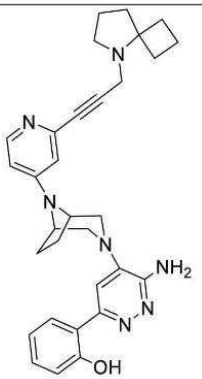
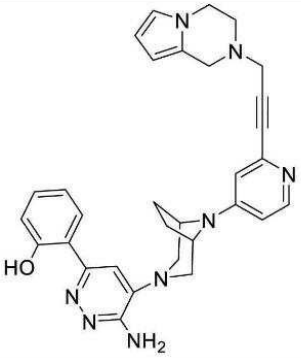
99		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.5]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
100		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
101		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(9-옥사-3-아자비시클로[3.3.1]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1013]

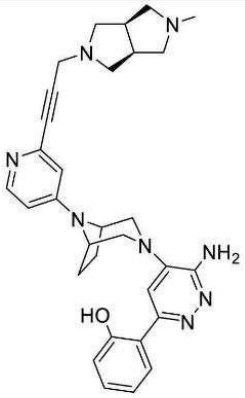
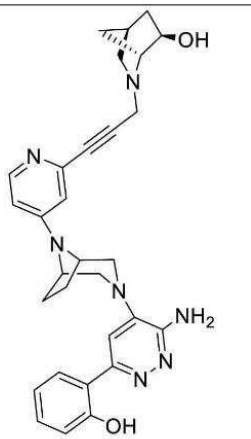
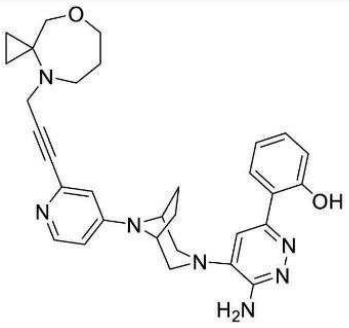
[1014]

102		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,6R)-2-아자비시클로[4.2.0]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
103		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
104		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

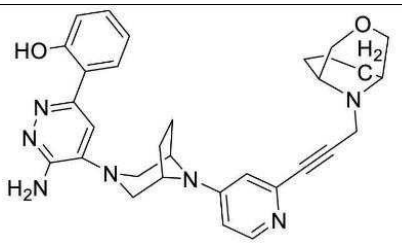
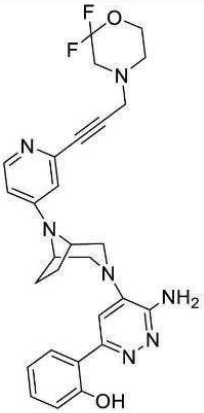
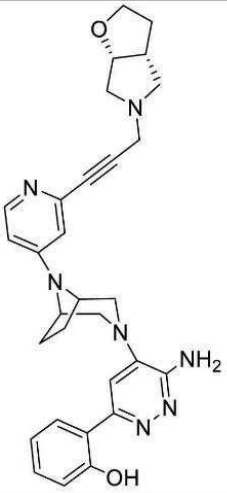
[1015]

105		3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올
106		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[3.4]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
107		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

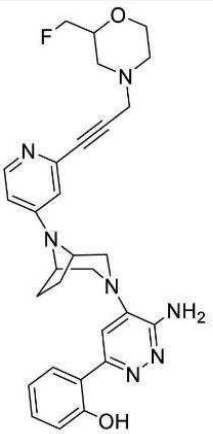
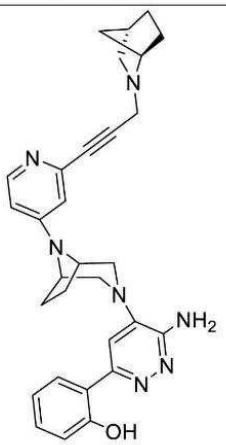
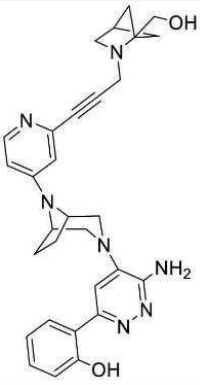
[1016]

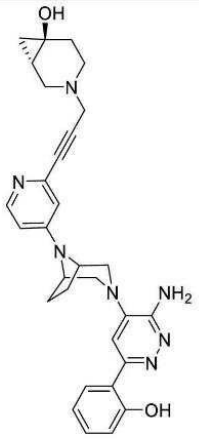
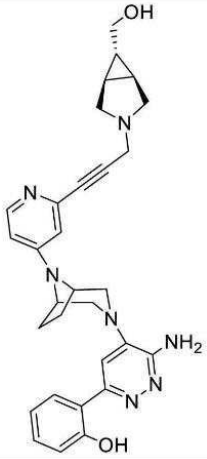
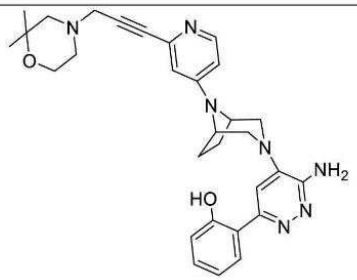
108		2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,6aR)-2-메틸-1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로피롤로[3,4-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
109		(1R,4S,6R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-6-올
110		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-4-아자스피로[2.6]노난-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1017]

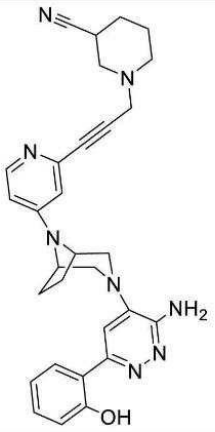
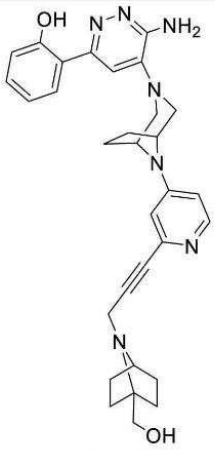
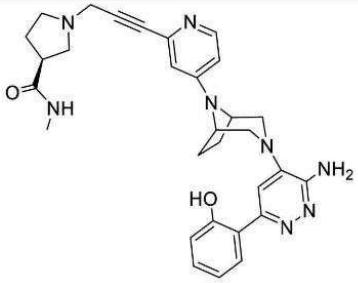
111		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
112		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
113		2-[5-[8-[2-[3-[(3aR,6aR)-2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀

[1018]

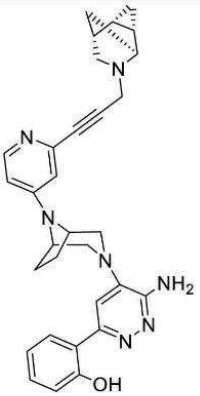
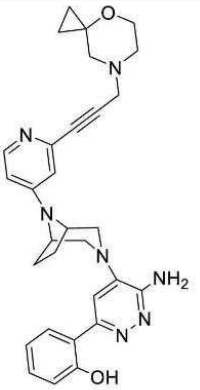
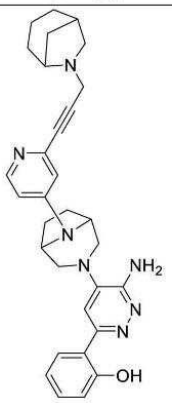
114		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(플루오로메틸)모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
115		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,4S)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
116		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

117		(1S,6S)-3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[4.1.0]헵탄-6-올
118		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,5R)-6-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
119		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

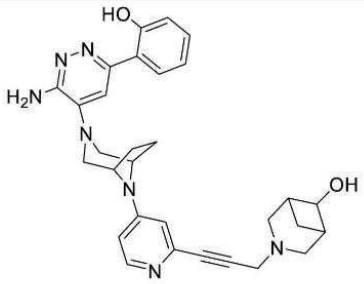
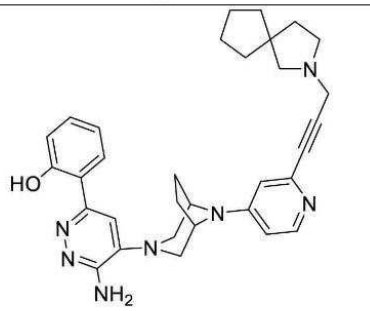
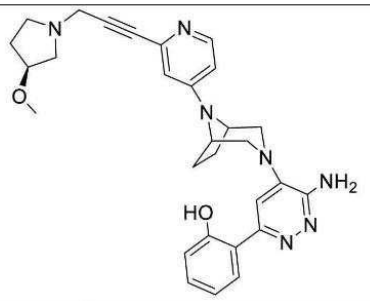
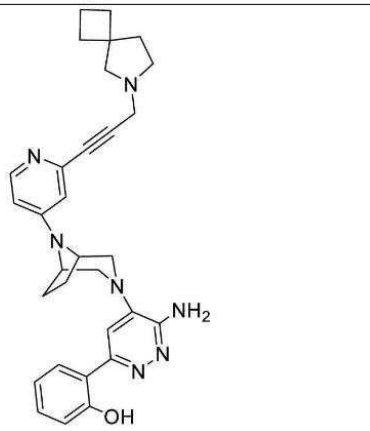
[1019]

120		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-카르보니트릴
121		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-7-아자비시클로[2.2.1]헵탄-7-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
122		(3S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-3-카르복스아미드

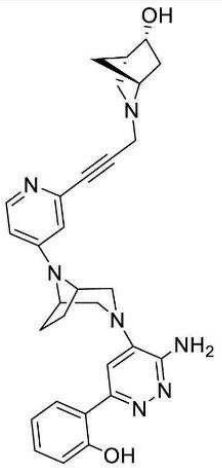
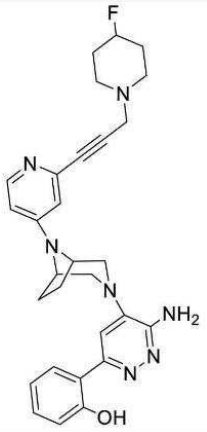
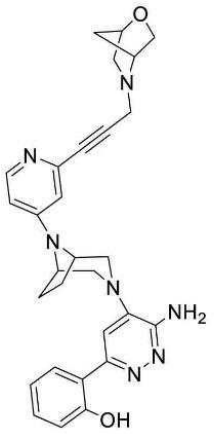
[1020]

123		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,2S,4S,5S)-6-아자트리시클로[3.2.1.02,4]옥탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
124		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-옥사-7-아자스피로[2.5]옥탄-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
125		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

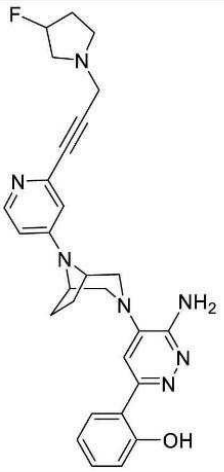
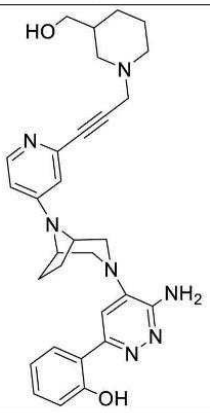
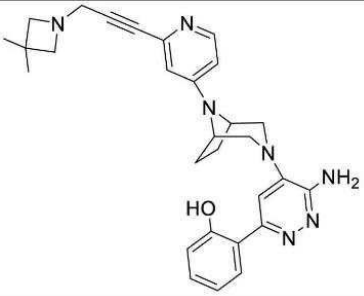
[1021]

126		3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.1]헵탄-6-올
127		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[4.4]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
128		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메톡시피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
129		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1022]

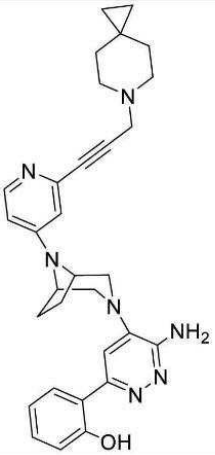
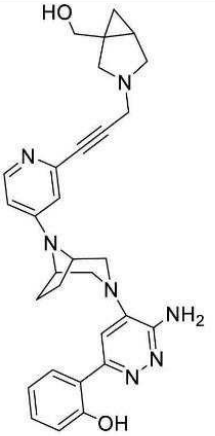
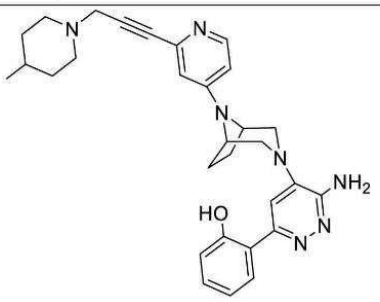
130		(1S,4S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-올
131		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
132		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1023]

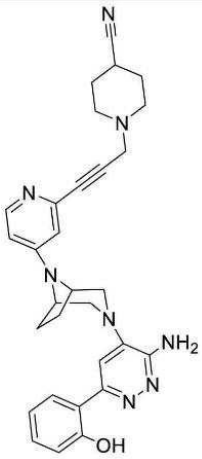
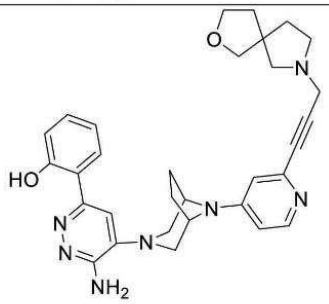
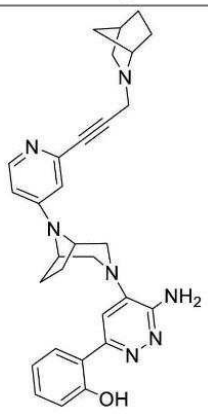
133		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
134		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
135		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

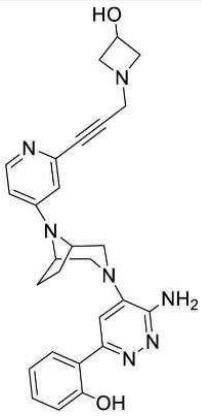
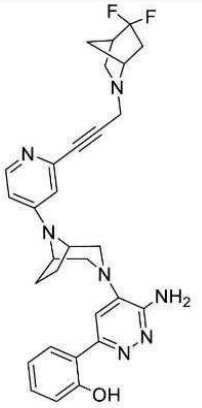
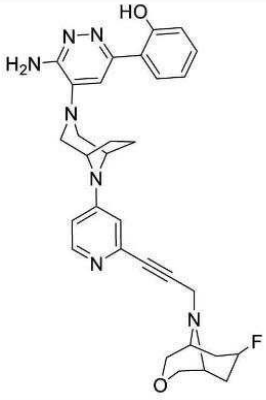
[1024]

[1025]

136		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
137		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
138		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

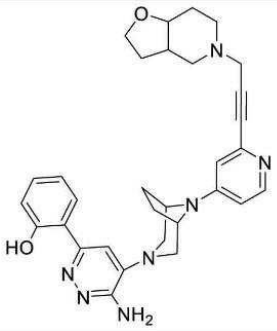
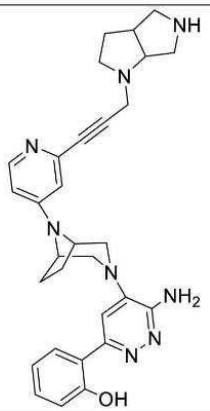
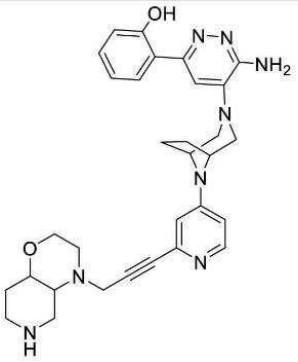
[1026]

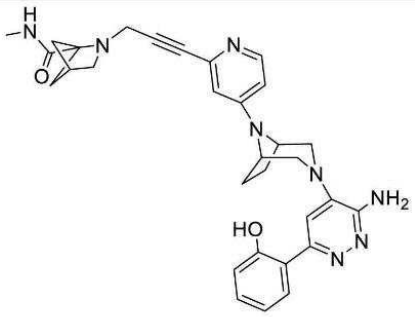
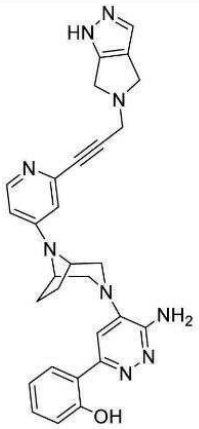
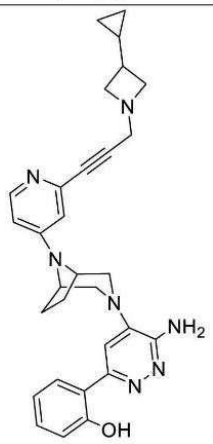
139		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르보니트릴
140		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
141		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

142		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올
143		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
144		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-플루오로-3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1027]

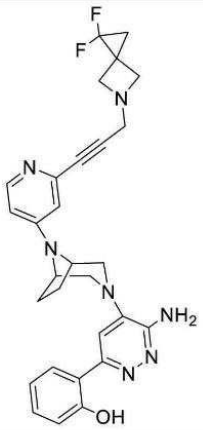
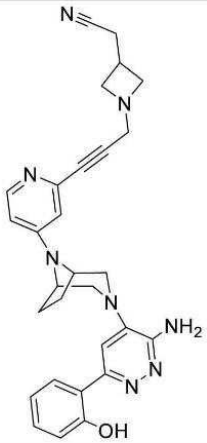
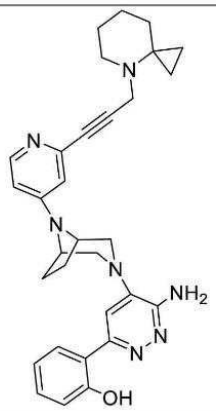
[1028]

145		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
146		2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-피롤로[3,4-b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀
147		2-[5-[8-[2-[3-(2,3,4a,5,6,7,8,8a-옥타히드로피리도[4,3-b][1,4]옥사진-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀

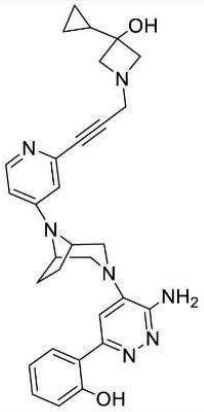
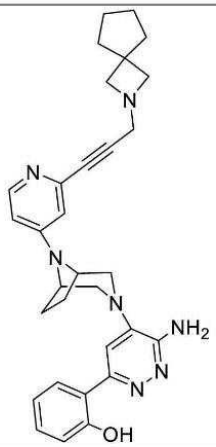
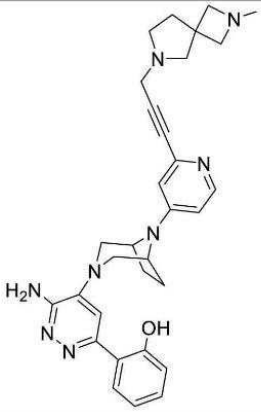
148		2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-1-카르복스아미드
149		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,6-디히드로-1H-피롤로[3,4-c]피라졸-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
150		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1029]

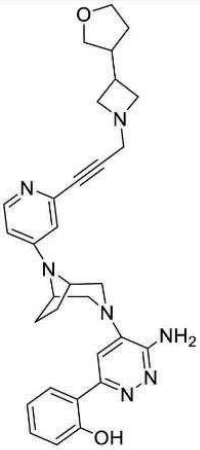
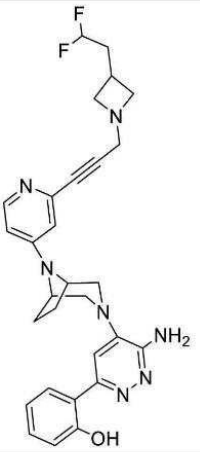
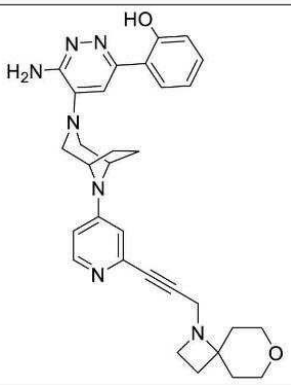
[1030]

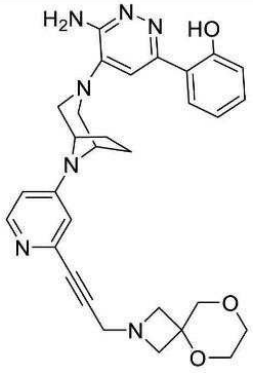
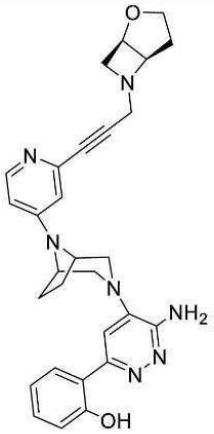
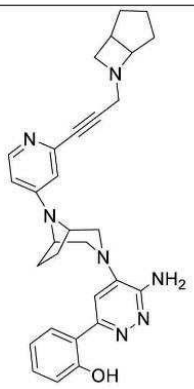
151		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
152		2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]아세토니트릴
153		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1031]

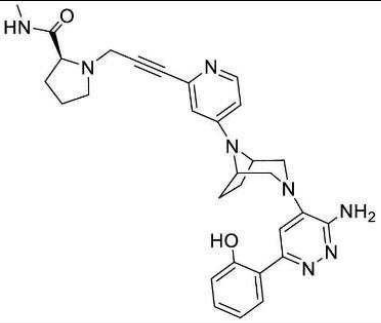
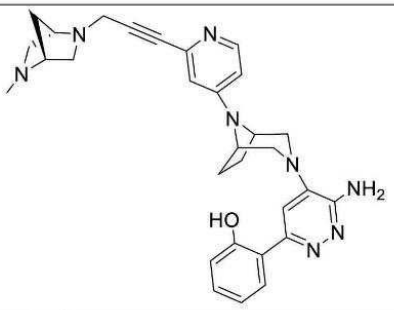
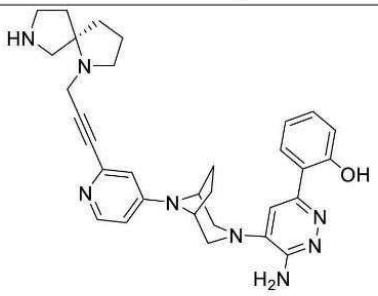
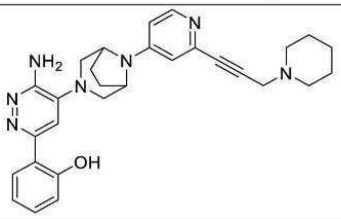
154		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-시클로프로필-아제티딘-3-올
155		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
156		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-2,6-디아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1032]

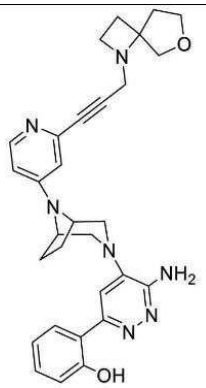
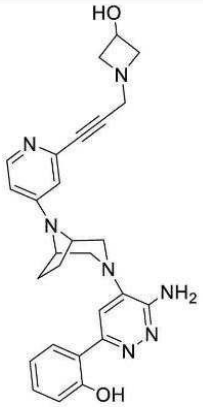
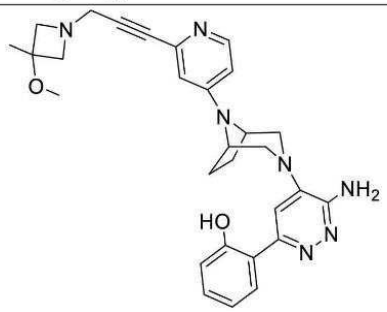
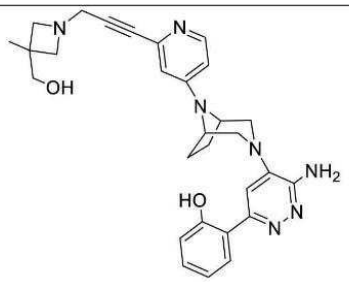
157		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-테트라히드로푸란-3-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
158		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(2,2-디플루오로에틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
159		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

160		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,8-디옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
161		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,5R)-2-옥사-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
162		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1033]

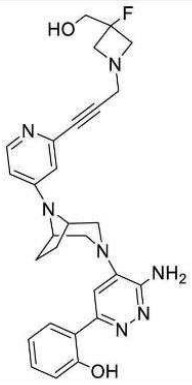
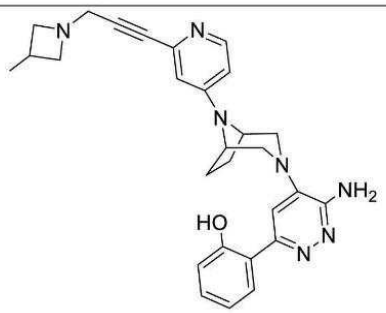
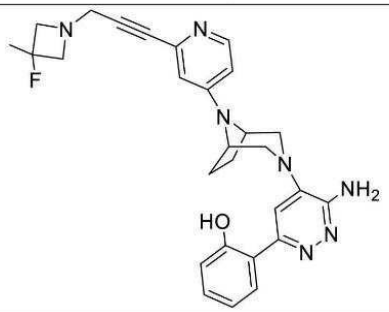
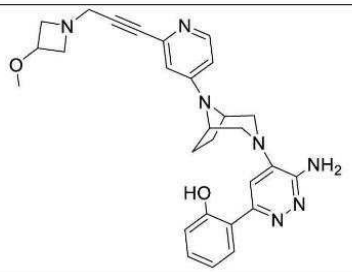
163		(2S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-2-카르복스아미드
164		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,4S)-5-메틸-2,5-디아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
165		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(5R)-1,7-디아자스피로[4.4]노난-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
166		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1034]

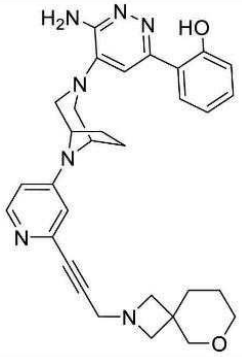
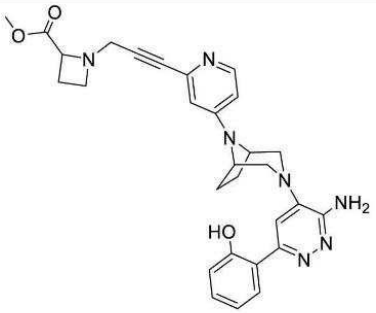
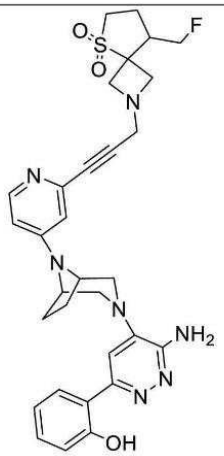
167		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
168		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올
169		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
170		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-메틸-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1035]

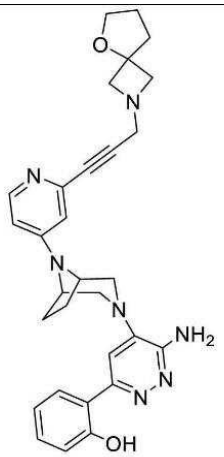
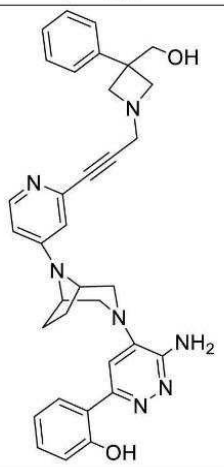
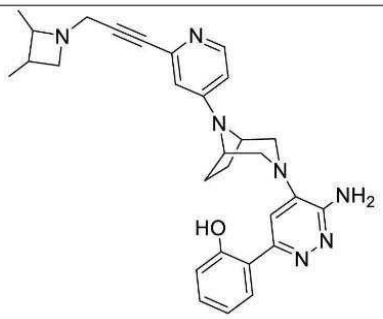
[1036]

171		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-플루오로-3-(히드록시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
172		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
173		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
174		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

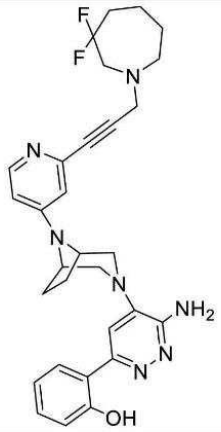
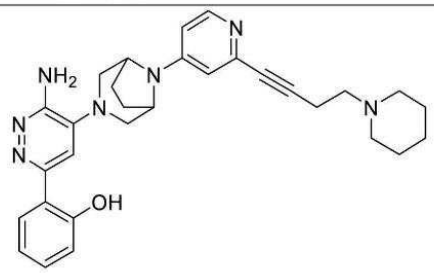
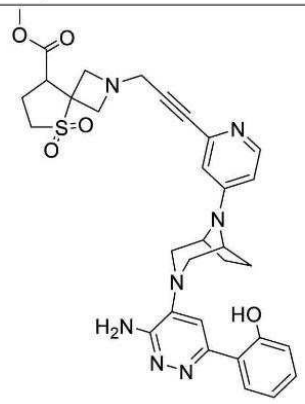
[1037]

175		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
176		메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-2-카르복실레이트
177		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[8-(플루오로메틸)-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

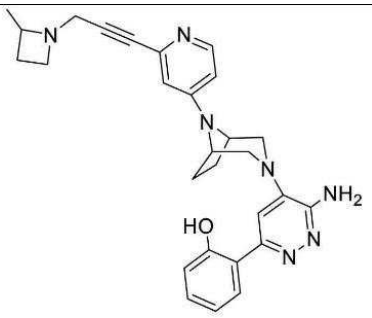
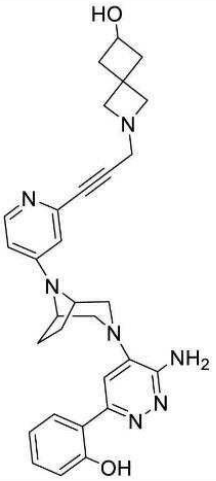
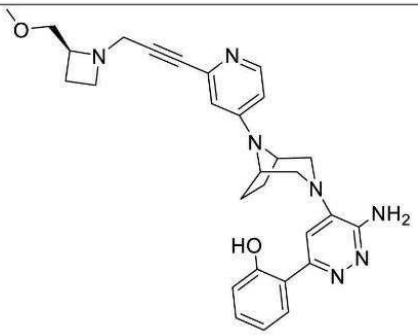
[1038]

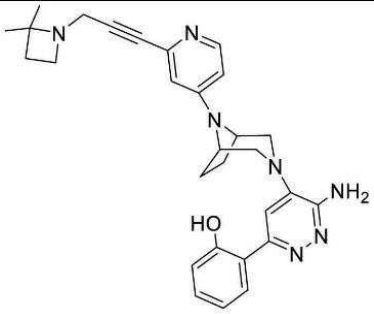
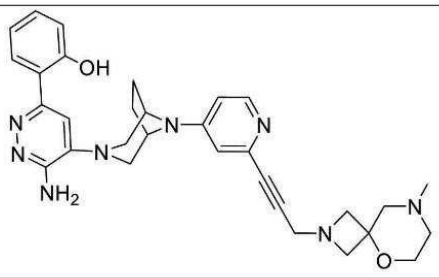
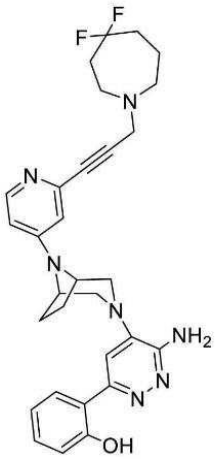
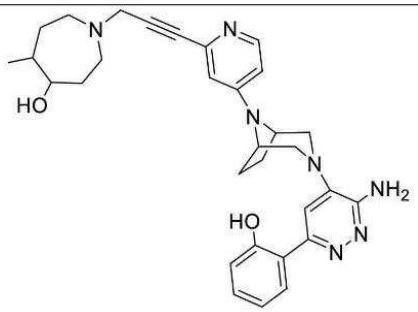
178		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
179		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-페닐-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
180		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1039]

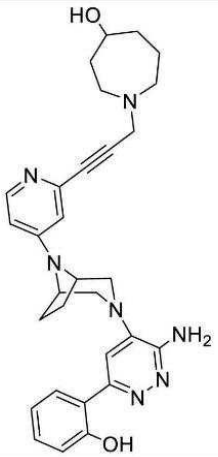
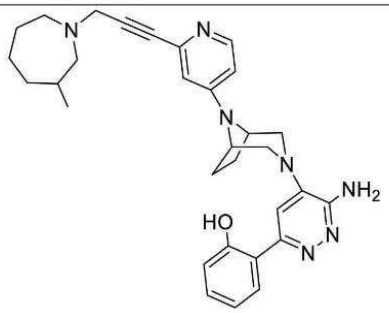
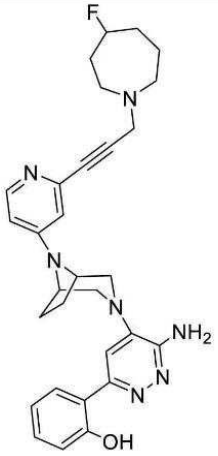
181		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
182		2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(1-피페리딜)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
183		메틸 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-8-카르복실레이트

[1040]

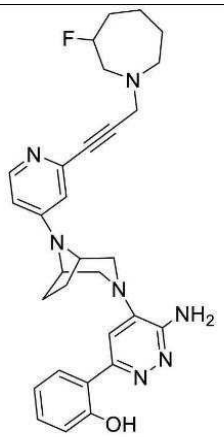
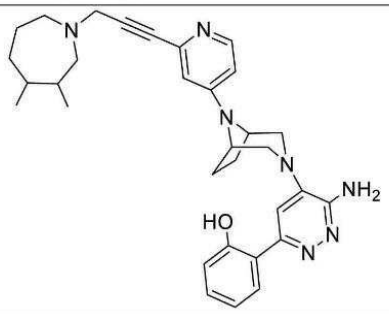
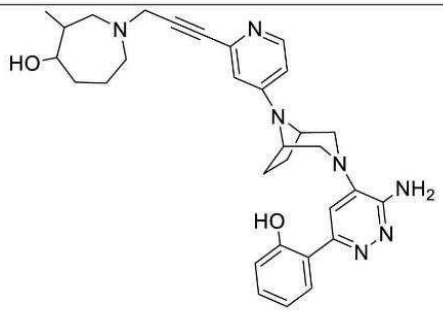
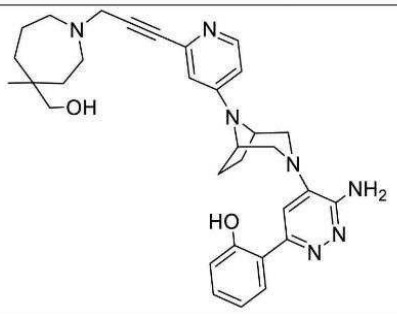
184		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
185		2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자스피로[3.3]헵탄-6-올
186		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(메톡시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

187		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
188		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-메틸-5-옥사-2,8-디아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
189		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
190		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-올

[1041]

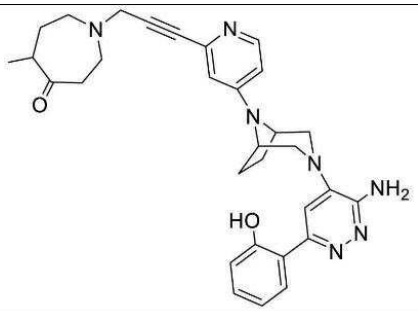
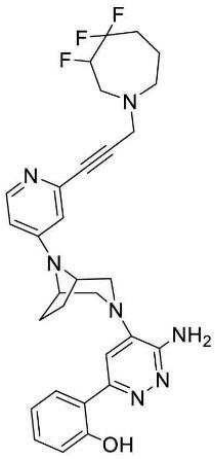
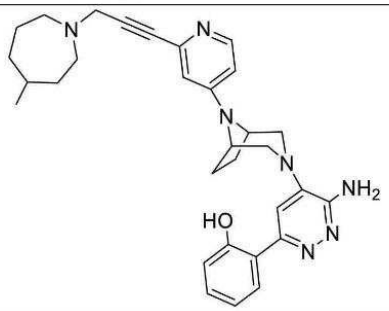
191		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-4-올
192		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
193		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1042]

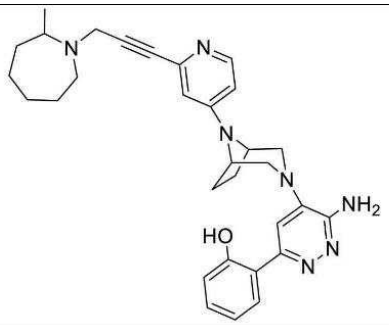
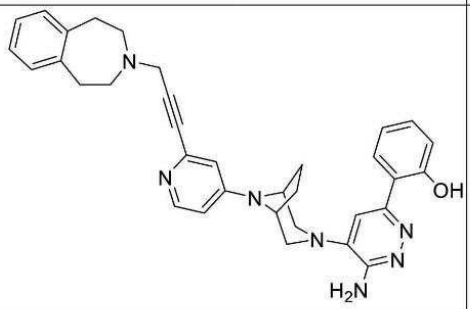
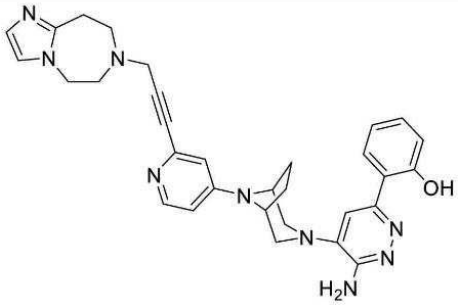
194		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
195		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
196		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-4-올
197		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-4-메틸-아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

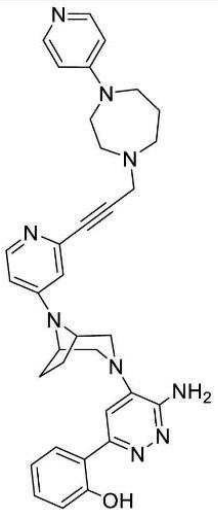
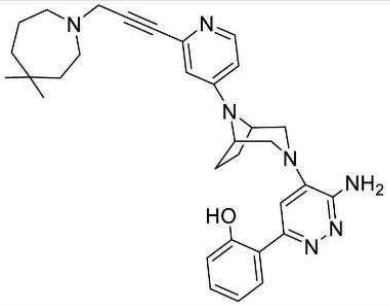
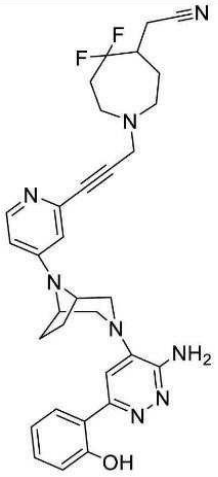
[1043]

[1044]

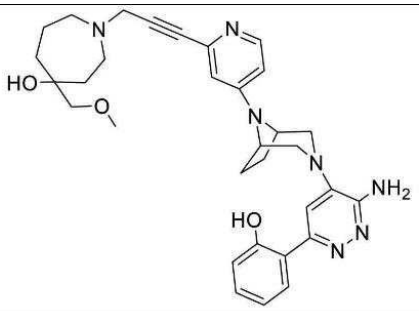
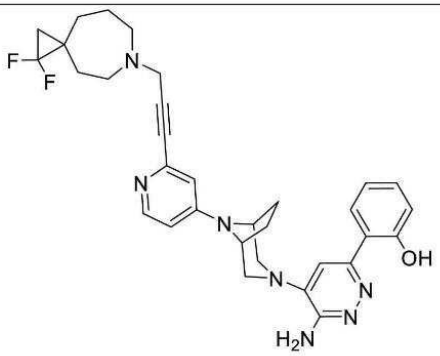
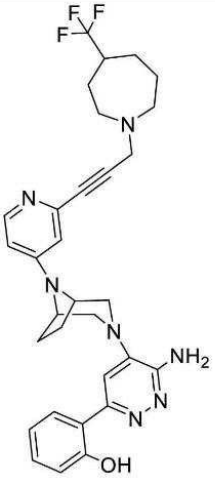
198		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-온
199		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4,4-트리플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
200		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1045]

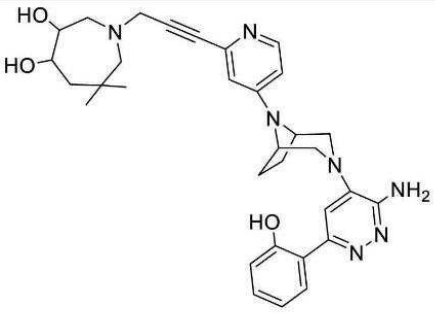
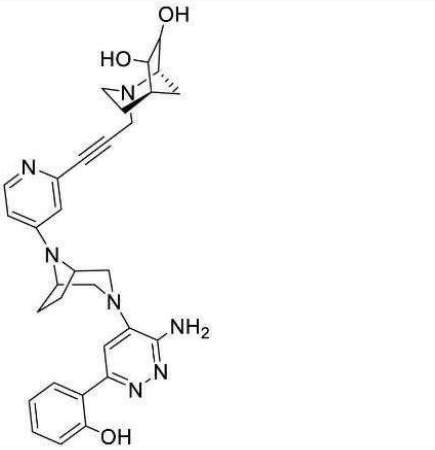
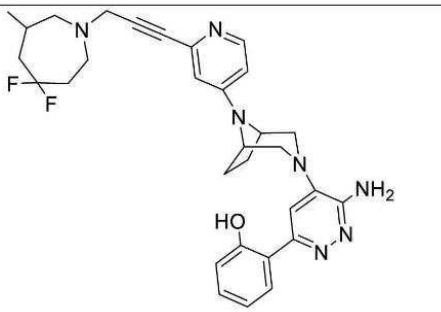
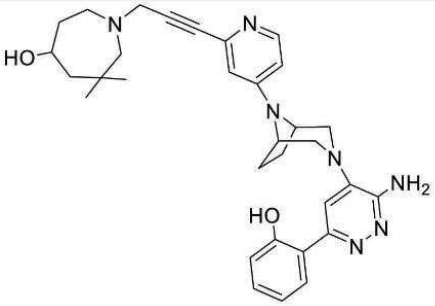
201		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
202		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,2,4,5-테트라히드로-3-벤즈아제핀-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
203		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,6,8,9-테트라히드로이미다조[1,2-d][1,4]디아제핀-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

204		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(4-피리딜)-1,4-디아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
205		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
206		2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디플루오로-아제판-4-일]아세토니트릴

[1046]

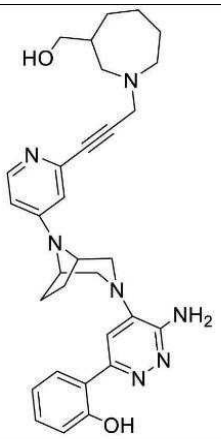
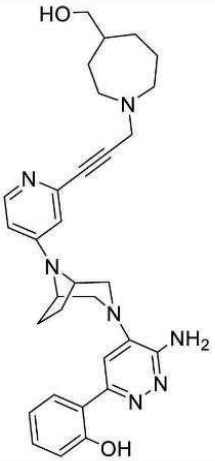
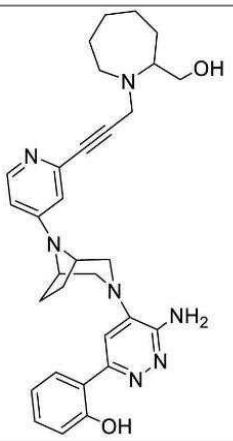
207		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-(메톡시메틸)아제판-4-올
208		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-7-아자스피로[2.6]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
209		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(트리플루오로메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1047]

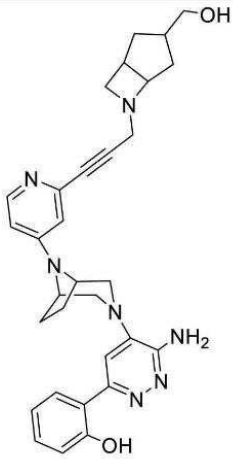
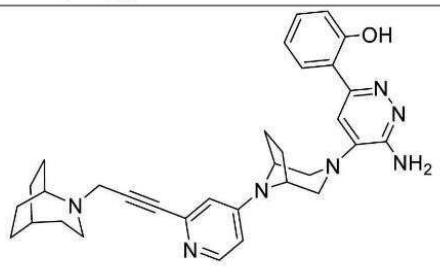
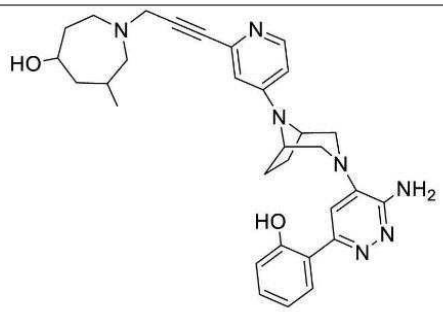
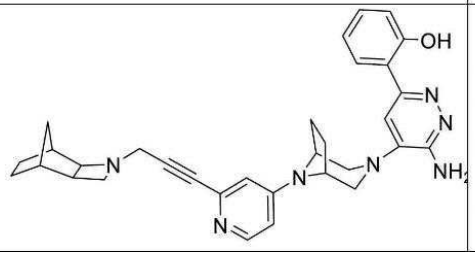
210		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-3,4-디올
211		(1S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6,7-디올
212		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
213		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-4-올

[1048]

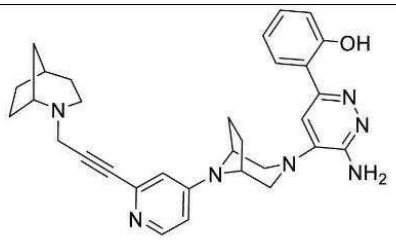
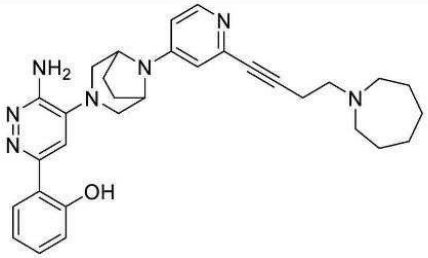
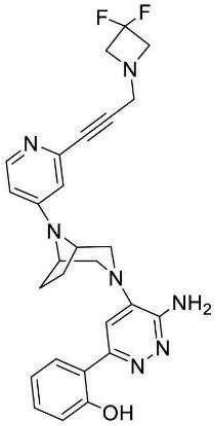
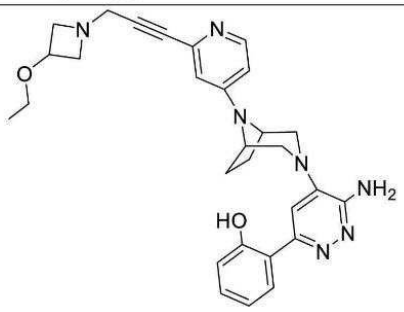
[1049]

214		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
215		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
216		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

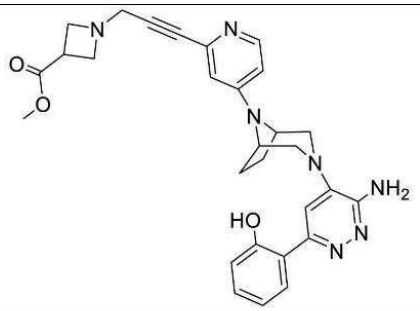
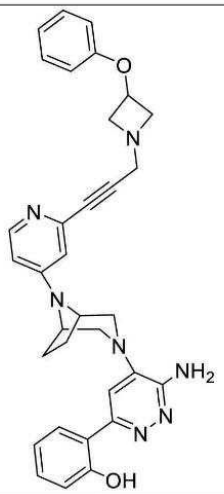
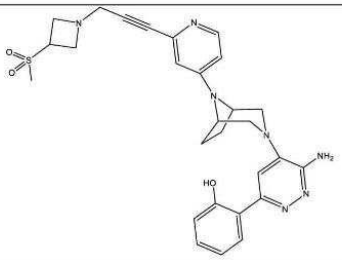
[1050]

217		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
218		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.2]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
219		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6-메틸-아제판-4-올
220		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자트리시클로[4.2.1.02,5]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

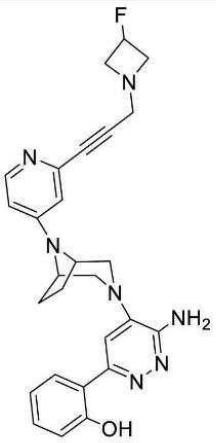
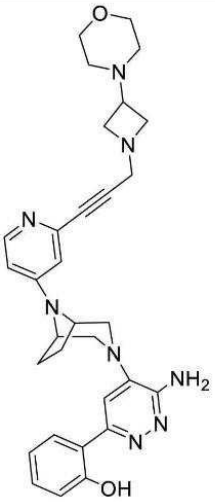
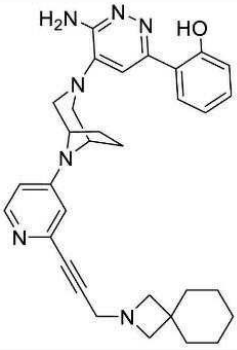
[1051]

221		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
222		2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(아제판-1-일)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
223		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
224		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-에톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

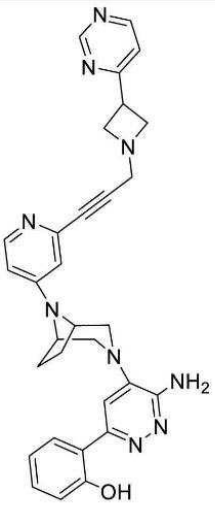
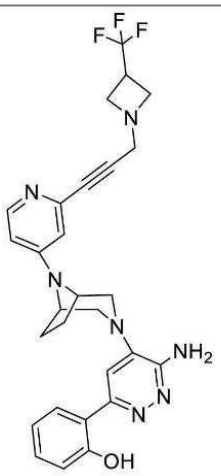
[1052]

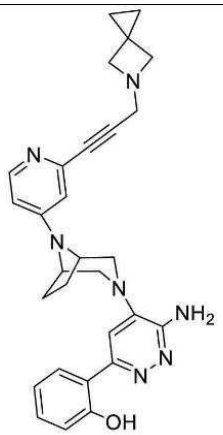
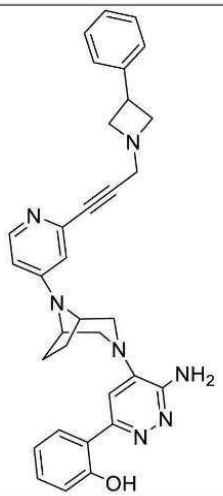
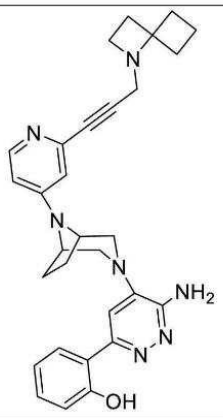
225		메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-카르복실레이트
226		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페녹시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
227		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸설포닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1053]

228		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
229		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
230		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

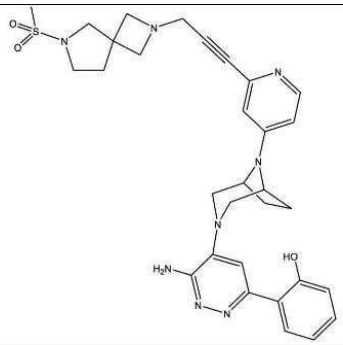
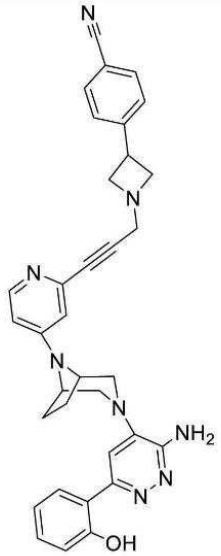
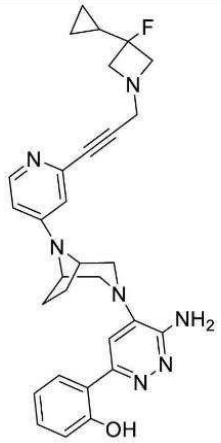
[1054]

231		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-피리미딘-4-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
232		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(트리플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

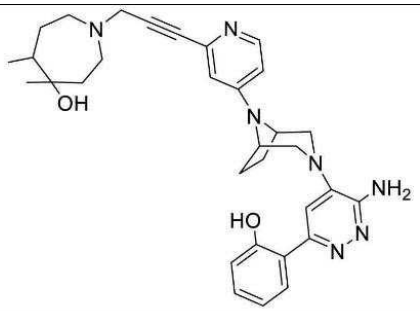
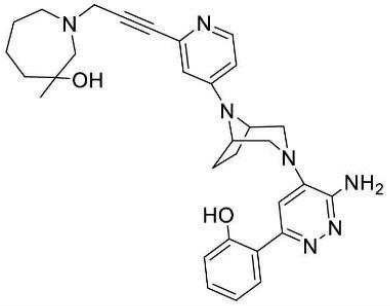
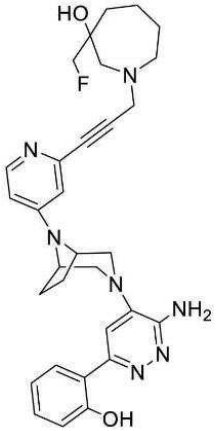
233		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
234		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
235		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-아자스피로[3.3]헵탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

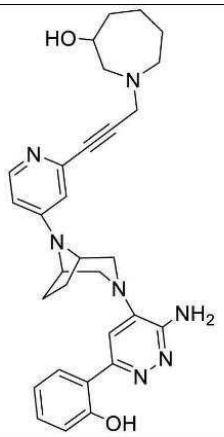
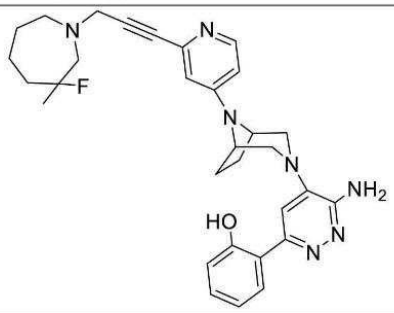
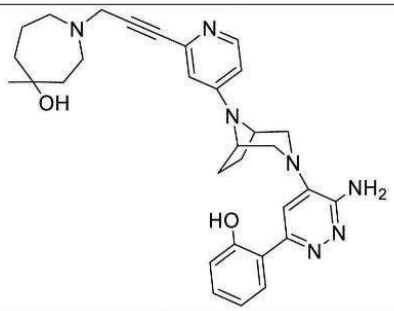
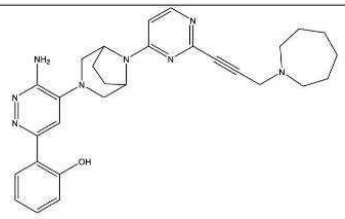
[1055]

[1056]

236		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메틸설포닐-2,7-디아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
237		4-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]벤조니트릴
238		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필-3-플루오로-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

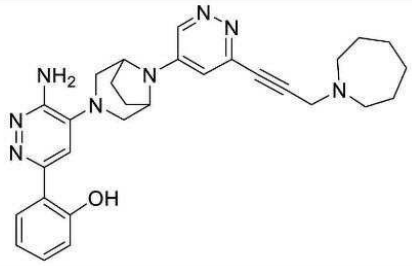
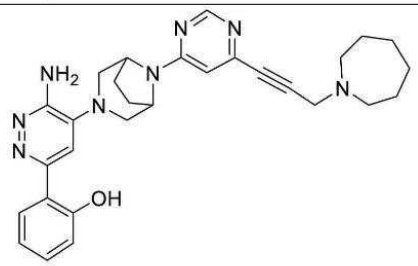
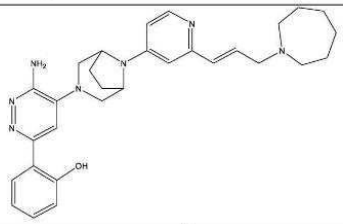
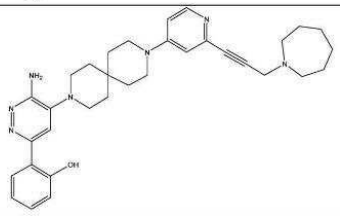
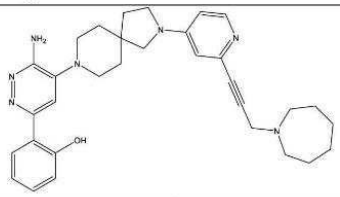
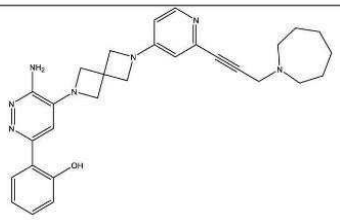
[1057]

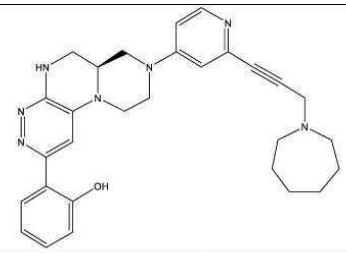
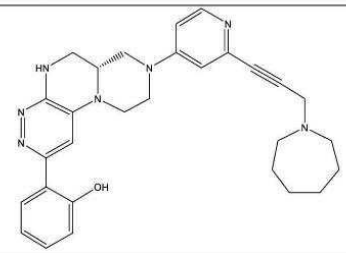
239		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4,5-디메틸-아제판-4-올
240		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-3-올
241		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-(플루오로메틸)아제판-3-올

242		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-3-올
243		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
244		1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-메틸-아제판-4-올
245		2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1058]

[1059]

246		2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
247		2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
248		2-[6-아미노-5-[8-[2-[(E)-3-(아제판-1-일)프로프-1-에닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀
249		2-[6-아미노-5-[9-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일]피리다진-3-일]페놀
250		2-[6-아미노-5-[2-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일]피리다진-3-일]페놀
251		2-[6-아미노-5-[6-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일]피리다진-3-일]페놀

252		2-[(10S)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀
253		2-[(10R)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀

[1060]

[1061] 표 1에서, 화합물 이름은 ChemDraw® 소프트웨어 버전 18.2.0.48을 사용하여 자동 생성되었음에 유념하라.

[1062] 구현예에서, 본 개시는 다음으로 :구성된 군으로부터 선택된 화합물에 관한 것이다:

[1063] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-(피페라진-1-일)부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1064] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1065] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((2-히드록시에틸)(메틸)아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1066] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(2-히드록시에톡시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1067] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(디에틸아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1068] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1069] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(모르폴린-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1070] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1071] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1072] 1-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)피페라진-2-온;

[1073] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(8-아미노옥트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1074] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-3-일옥시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1075] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1076] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1077] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1078] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1079] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1080] 4-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)티오모르폴린 1,1-디옥사이드;

[1081] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-4-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1082] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-아미노헥실)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1083] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((1-메틸-1H-피라졸-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1084] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((테트라히드로-2H-피란-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1085] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1086] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1087] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1088] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-히드록시부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1089] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-히드록시헥스-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1090] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페라진-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1091] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((4-아미노시클로헥실)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1092] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1093] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1094] 2-아미노-N-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로필)아세트아미드;

[1095] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로필)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀; 및

[1096] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-3-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀,

[1097] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1098] 구현예에서, 본 개시는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 화합물에 관한 것이다:

[1099] N-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르복스아미드;

[1100] 2-[6-아미노-5-[8-[2-(3-아미노-3-메틸-부트-1-이닐)-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1101] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1102] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-시클로프로필피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1103] 2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1104] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1105] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(메톡시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1106] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1107] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1108] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1109] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1110] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1111] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1,4-디아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1112] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3R)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1113] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1114] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-올;

[1115] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1,1-디옥소티올란-3-일)-메틸-아미노]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1116] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피롤리딘-3-올;

[1117] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,2-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1118] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로-1H-피롤로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1119] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1120] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,7-디히드로피롤로[3,4-b]피리딘-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1121] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1122] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1123] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S,6R)-2,6-디메틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1124] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aR)-1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1125] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1126] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-피롤리딘-3-올;

[1127] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-1H-시클로펜타[c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1128] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1129] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2R)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1130] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1131] 2-[5-[8-[2-[3-(3,4,6,7,8,8a-헥사히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1132] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1133] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1134] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1135] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-올;

[1136] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,5-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1137] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1138] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[4.1.0]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1139] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메틸피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1140] 2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1141] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-8-아자스피로[3.5]노난-8-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1142] (6R)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-6-올;

[1143] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,6-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1144] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1145] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1146] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메톡시-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1147] 7-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-옥사-7-아자비시클로[3.3.1]노난-9-올;

[1148] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.4]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1149] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐-메틸-아미노]-1-모르폴리노-에탄온;

[1150] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1151] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.1.0]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1152] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-푸로[3,4-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1153] 4-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-모르폴린-3-카르복스아미드;

[1154] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aS)-3,3a,5,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-b]피리딘-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1155] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.0]헵탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1156] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-피라노[3,4-c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1157] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1158] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1159] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(디플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1160] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피페리딘-2-카르복스아미드;

[1161] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-플루오로-2-아자스피로[3.3]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1162] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1163] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.5]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1164] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1165] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(9-옥사-3-아자비시클로[3.3.1]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1166] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,6R)-2-아자비시클로[4.2.0]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1167] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1168] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1169] 3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올;

[1170] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[3.4]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1171] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1172] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,6aR)-2-메틸-1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로피롤로[3,4-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1173] (1R,4S,6R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-6-올;

[1174] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-4-아자스피로[2.6]노난-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1175] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1176] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1177] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aR,6aR)-2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1178] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(플루오로메틸)모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1179] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,4S)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1180] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1181] (1S,6S)-3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[4.1.0]헵탄-6-올;

[1182] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,5R)-6-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1183] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1184] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-카르보니트릴;

[1185] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-7-아자비시클로[2.2.1]헵탄-7-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1186] (3S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-3-카르복스아미드;

[1187] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,2S,4S,5S)-6-아자트리시클로[3.2.1.02,4]옥탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1188] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-옥사-7-아자스피로[2.5]옥탄-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1189] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1190] 3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.1]헵탄-6-올;

[1191] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[4.4]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1192] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메톡시피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1193] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1194] (1S,4S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-올;

[1195] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1196] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1197] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1198] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1199] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1200] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1201] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1202] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1203] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르보니트릴;

[1204] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1205] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1206] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1207] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1208] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-플루오로-3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1209] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1210] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-피롤로[3,4-b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1211] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,4a,5,6,7,8,8a-옥타히드로피리도[4,3-b][1,4]옥사진-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1212] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-1-카르복스아미드;

[1213] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,6-디히드로-1H-피롤로[3,4-c]피라졸-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1214] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1215] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1216] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]아세토니트릴;

[1217] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1218] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-시클로프로필-아제티딘-3-올;

[1219] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1220] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-2,6-디아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1221] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-테트라히드로푸란-3-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1222] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(2,2-디플루오로에틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1223] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1224] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,8-디옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1225] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,5R)-2-옥사-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1226] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1227] (2S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-2-카르복스아미드;

[1228] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,4S)-5-메틸-2,5-디아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1229] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(5R)-1,7-디아자스피로[4.4]노난-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1230] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1231] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1232] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1233] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1234] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-메틸-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1235] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-플루오로-3-(히드록시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1236] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1237] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1238] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1239] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1240] 메틸
1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-2-카르복실레이트;

[1241] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[8-(플루오로메틸)-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1242] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1243] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-페닐-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1244] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1245] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥

탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1246] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(1-피페리딜)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1247] 메틸
2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-8-카르복실레이트;

[1248] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1249] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자스피로[3.3]헵탄-6-올;

[1250] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(메톡시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1251] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1252] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-메틸-5-옥사-2,8-디아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1253] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1254] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-올;

[1255] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-4-올;

[1256] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1257] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1258] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1259] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1260] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-4-올;

[1261] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-4-메틸-아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1262] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-온;

[1263] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4,4-트리플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1264] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1265] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1266] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,2,4,5-테트라히드로-3-벤즈아제핀-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1267] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,6,8,9-테트라히드로이미다조[1,2-d][1,4]디아제핀-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1268] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(4-피리딜)-1,4-디아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1269] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1270] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디플루오로-아제판-4-일]아세토니트릴;

[1271] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-(메톡시메틸)아제판-4-올;

[1272] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-7-아자스피로[2.6]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1273] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(트리플루오로메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1274] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-3,4-디올;

[1275] (1S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6,7-디올;

[1276] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1277] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-4-올;

[1278] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1279] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1280] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1281] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1282] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.2]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]페놀;

[1283] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6-메틸-아제판-4-올;

[1284] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자트리시클로[4.2.1.02,5]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1285] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1286] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(아제판-1-일)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1287] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1288] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-에톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1289] 메틸
1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-카르복실레이트;

[1290] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페녹시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1291] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸설포닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1292] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1293] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1294] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1295] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-피리미딘-4-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1296] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(트리플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1297] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1298] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1299] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-아자스피로[3.3]헵탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1300] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메틸설포닐-2,7-디아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1301] 4-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]벤조니트릴;

[1302] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필-3-플루오로-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1303] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4,5-디메틸-아제판-4-올;

[1304] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-3-올;

[1305] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-(플루오로메틸)아제판-3-올;

[1306] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-3-올;

[1307] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.

1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1308] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-메틸-아제판-4-올;

[1309] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1310] 2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1311] 2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀; 및

[1312] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-에닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀.

[1313] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1314] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1315] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1316] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-메틸-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1317] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-플루오로-3-(히드록시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1318] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1319] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1320] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1321] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1322] ;메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-2-카르복실레이트

[1323] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[8-(플루오로메틸)-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1324] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1325] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-페닐-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1326] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1327] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1328] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(1-피페리딜)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-

3-일]페놀

[1329] ;메틸 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-8-카르복실레이트

[1330] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1331] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자스피로[3.3]헵탄-6-올;

[1332] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(메톡시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1333] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1334] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-메틸-5-옥사-2,8-디아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1335] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1336] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-올;

[1337] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-4-올;

[1338] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1339] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1340] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1341] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1342] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-4-올;

[1343] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-4-메틸-아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1344] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-온;

[1345] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4,4-트리플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1346] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1347] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1348] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,2,4,5-테트라히드로-3-벤즈아제핀-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1349] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,6,8,9-테트라히드로이미다조[1,2-d][1,4]디아제핀-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-

3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1350] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(4-피리딜)-1,4-디아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1351] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1352] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디플루오로-아제판-4-일]아세토니트릴;

[1353] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-(메톡시메틸)아제판-4-올;

[1354] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-7-아자스피로[2.6]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1355] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(트리플루오로메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1356] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-3,4-디올;

[1357] (1S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6,7-디올;

[1358] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1359] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-4-올;

[1360] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1361] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1362] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1363] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1364] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.2]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1365] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6-메틸-아제판-4-올;

[1366] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자트리시클로[4.2.1.02,5]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1367] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1368] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(아제판-1-일)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1369] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1370] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-에톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-

3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1371] 메틸
1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-카르복실레이트;

[1372] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페녹시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1373] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸설포닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1374] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1375] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1376] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1377] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-피리미딘-4-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1378] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(트리플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1379] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1380] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1381] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-아자스피로[3.3]헵탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1382] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메틸설포닐-2,7-디아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1383] 4-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]벤조니트릴

[1384] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필-3-플루오로-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1385] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4,5-디메틸-아제판-4-올;

[1386] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-3-올;

[1387] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-(플루오로메틸)아제판-3-올;

[1388] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-3-올;

[1389] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀; 및

[1390] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-메틸-아제판-4-올,

[1391] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1392] 구현예에서, 본 개시는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 화합물에 관한 것이다:

[1393] 2-[6-아미노-5-[9-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1394] 2-[6-아미노-5-[2-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일]피리다진-3-일]페놀;

[1395] 2-[6-아미노-5-[6-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일]피리다진-3-일]페놀;

[1396] 2-[(10S)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀; 및

[1397] 2-[(10R)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀,

[1398] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1399] 구현예에서, 본 개시는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 화합물에 관한 것이다:

[1400] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-(피페라진-1-일)부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1401] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1402] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((2-히드록시에틸)(메틸)아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1403] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(2-히드록시에톡시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1404] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(디에틸아미노)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1405] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1406] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(모르폴린-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1407] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1408] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1409] 1-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)피페라진-2-온;

[1410] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(8-아미노옥트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1411] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-3-일옥시)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1412] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1413] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1414] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1415] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-2-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1416] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(아제티딘-2-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1417] 4-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)티오모르폴린 1,1-디옥사이드;

[1418] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-4-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1419] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-아미노헥실)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1420] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((1-메틸-1H-피라졸-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1421] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((테트라히드로-2H-피란-4-일)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1422] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1423] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1424] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피롤리딘-3-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1425] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-히드록시부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1426] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(6-히드록시헥스-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1427] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페라진-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1428] 2-(6-아미노-5-(8-(2-((4-아미노시클로헥실)에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1429] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(4-아미노부트-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1430] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(3-아미노피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀;

[1431] 2-아미노-N-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로필)아세트아미드;

[1432] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로필)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀; 및

[1433] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-3-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀,

[1434] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물

또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1435] 구현예에서, 본 개시는 다음으로 구성된 군으로부터 선택된 화합물에 관한 것이다:

[1436] N-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르복스아미드;

[1437] 2-[6-아미노-5-[8-[2-(3-아미노-3-메틸-부트-1-이닐)-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1438] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1439] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-시클로프로필피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1440] 2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1441] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸피페라진-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1442] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(메톡시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1443] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1444] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1445] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1446] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1447] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1448] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1,4-디아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1449] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3R)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1450] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1451] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-올;

[1452] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1,1-디옥소티올란-3-일)-메틸-아미노]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1453] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피롤리딘-3-올;

[1454] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,2-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1455] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로-1H-피롤로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1456] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1457] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,7-디히드로피롤로[3,4-b]피리딘-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1458] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1459] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1460] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S,6R)-2,6-디메틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1461] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aR)-1,3,3a,4,5,6,7,7a-옥타히드로이소인돌-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1462] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1463] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-피롤리딘-3-올;

[1464] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-1H-시클로펜타[c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1465] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-에틸모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1466] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2R)-2-(히드록시메틸)피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1467] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1468] 2-[5-[8-[2-[3-(3,4,6,7,8,8a-헥사히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1469] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1470] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1471] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,4-옥사제판-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1472] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-올;

[1473] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6,8-디히드로-5H-이미다조[1,5-a]피라진-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1474] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1475] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[4.1.0]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1476] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메틸피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1477] 2-[5-[8-[2-[3-(1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[3,4-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1478] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-8-아자스피로[3.5]노난-8-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1479] (6R)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-6-올;

[1480] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,6-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1481] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1482] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1483] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메톡시-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1484] 7-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-옥사-7-아자비시클로[3.3.1]노난-9-올;

[1485] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.4]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1486] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐-메틸-아미노]-1-모르폴리노-에탄온;

[1487] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1488] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.1.0]헥산-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1489] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-푸로[3,4-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1490] 4-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-모르폴린-3-카르복스아미드;

[1491] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,7aS)-3,3a,5,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-b]피리딘-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1492] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.0]헵탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1493] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-1H-피라노[3,4-c]피롤-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1494] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1495] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-시클로펜타[b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1496] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(디플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1497] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피페리딘-2-카르복스아미드;

[1498] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-플루오로-2-아자스피로[3.3]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1499] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-3-아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1500] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.5]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1501] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1502] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(9-옥사-3-아자비시클로[3.3.1]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1503] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,6R)-2-아자비시클로[4.2.0]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1504] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1505] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1506] 3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올;

[1507] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[3.4]옥탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1508] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디히드로-1H-피롤로[1,2-a]피라진-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1509] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aS,6aR)-2-메틸-1,3,3a,4,6,6a-헥사히드로피롤로[3,4-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1510] (1R,4S,6R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-6-올;

[1511] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-옥사-4-아자스피로[2.6]노난-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1512] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1513] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1514] 2-[5-[8-[2-[3-[(3aR,6aR)-2,3,3a,4,6,6a-헥사히드로푸로[2,3-c]피롤-5-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1515] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(플루오로메틸)모르폴린-4-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1516] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,4S)-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1517] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1518] (1S,6S)-3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[4.1.0]헵탄-6-올;

[1519] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,5R)-6-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1520] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸모르폴린-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1521] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-3-카르보니트릴;

[1522] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-7-아자비시클로[2.2.1]헵탄-7-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1523] (3S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-3-카르복스아미드;

[1524] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,2S,4S,5S)-6-아자트리시클로[3.2.1.02,4]옥탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1525] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-옥사-7-아자스피로[2.5]옥탄-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1526] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1527] 3-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-아자비시클로[3.1.1]헵탄-6-올;

[1528] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[4.4]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1529] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(3S)-3-메톡시피롤리딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1530] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1531] (1S,4S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-올;

[1532] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1533] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-5-아자비시클로[2.2.1]헵탄-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1534] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로피롤리딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1535] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-1-피페리딜]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1536] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1537] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1538] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[1-(히드록시메틸)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-3-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1539] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸-1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1540] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]피페리딘-4-카르보니트릴;

[1541] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-옥사-7-아자스피로[4.4]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1542] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1543] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1544] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-2-아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1545] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-플루오로-3-옥사-9-아자비시클로[3.3.1]노난-9-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1546] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,6,7,7a-헥사히드로-2H-푸로[3,2-c]피리딘-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1547] 2-[5-[8-[2-[3-(3,3a,4,5,6,6a-헥사히드로-2H-피롤로[3,4-b]피롤-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1548] 2-[5-[8-[2-[3-(2,3,4a,5,6,7,8,8a-옥타히드로피리도[4,3-b][1,4]옥사진-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-아미노-피리다진-3-일]페놀;

[1549] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-2-아자비시클로[2.1.1]헥산-1-카르복스아미드;

[1550] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,6-디히드로-1H-피롤로[3,4-c]피라졸-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1551] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1552] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1553] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]아세토니트릴;

[1554] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-아자스피로[2.5]옥탄-4-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1555] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-시클로프로필-아제티딘-3-올;

[1556] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1557] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸-2,6-디아자스피로[3.4]옥탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1558] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-테트라히드로푸란-3-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1559] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(2,2-디플루오로에틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1560] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.5]노난-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1561] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,8-디옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1562] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1R,5R)-2-옥사-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1563] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1564] (2S)-1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-N-메틸-피롤리딘-2-카르복스아미드;

[1565] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(1S,4S)-5-메틸-2,5-디아자비시클로[2.2.1]헵탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1566] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(5R)-1,7-디아자스피로[4.4]노난-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1567] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-피페리딜)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1568] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1569] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1570] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1571] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-메틸-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1572] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-플루오로-3-(히드록시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1573] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1574] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1575] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1576] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1577] 메틸
1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-2-카르복실레이트;

[1578] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[8-(플루오로메틸)-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1579] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1580] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-페닐-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1581] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-

3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1582] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1583] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(1-피페리딜)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1584] 메틸
2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-8-카르복실레이트;

[1585] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1586] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자스피로[3.3]헵탄-6-올;

[1587] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(메톡시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1588] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1589] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-메틸-5-옥사-2,8-디아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1590] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1591] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-올;

[1592] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-4-올;

[1593] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1594] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1595] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1596] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1597] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-4-올;

[1598] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-4-메틸-아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1599] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-온;

[1600] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4,4-트리플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1601] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1602] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1603] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,2,4,5-테트라히드로-3-벤즈아제핀-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1604] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,6,8,9-테트라히드로이미다조[1,2-d][1,4]디아제핀-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1605] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(4-피리딜)-1,4-디아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1606] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1607] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디플루오로-아제판-4-일]아세토니트릴;

[1608] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-(메톡시메틸)아제판-4-올;

[1609] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-7-아자스피로[2.6]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1610] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(트리플루오로메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1611] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-3,4-디올;

[1612] (1S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6,7-디올;

[1613] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1614] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-4-올;

[1615] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1616] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1617] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1618] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1619] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.2]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]페놀;

[1620] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6-메틸-아제판-4-올;

[1621] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자트리시클로[4.2.1.02,5]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1622] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1623] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(아제판-1-일)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1624] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1625] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-에톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1626] 메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-카르복실레이트;

[1627] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페녹시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1628] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸설포닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1629] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1630] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1631] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1632] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-피리미딘-4-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1633] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(트리플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1634] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1635] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1636] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-아자스피로[3.3]헵탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1637] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메틸설포닐-2,7-디아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1638] 4-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]벤조니트릴;

[1639] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필-3-플루오로-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1640] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4,5-디메틸-아제판-4-올;

[1641] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-3-올;

[1642] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-(플루오로메틸)아제판-3-올;

[1643] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프

로프-2-이닐]아제판-3-올;

[1644] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1645] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-메틸-아제판-4-올;

[1646] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1647] 2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1648] 2-[6-아미노-5-[8-[6-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]피리미딘-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀; 및

[1649] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-에닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀.

[1650] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-옥사-1-아자스피로[3.4]옥탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1651] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-올;

[1652] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1653] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-메틸-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1654] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-플루오로-3-(히드록시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1655] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1656] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1657] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1658] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(6-옥사-2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1659] ;메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-2-카르복실레이트

[1660] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[8-(플루오로메틸)-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1661] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-옥사-2-아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1662] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-3-페닐-아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1663] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,3-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1664] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥

탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1665] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(1-피페리딜)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀

[1666] ;메틸 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디옥소-5람다6-티아-2-아자스피로[3.4]옥탄-8-카르복실레이트

[1667] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1668] 2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자스피로[3.3]헵탄-6-올;

[1669] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[(2S)-2-(메톡시메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1670] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디메틸아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1671] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(8-메틸-5-옥사-2,8-디아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1672] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1673] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-올;

[1674] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-4-올;

[1675] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1676] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1677] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1678] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1679] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-4-올;

[1680] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)-4-메틸-아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1681] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5-메틸-아제판-4-온;

[1682] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,4,4-트리플루오로아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1683] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1684] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1685] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1,2,4,5-테트라히드로-3-벤즈아제핀-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시

클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1686] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,6,8,9-테트라히드로이미다조[1,2-d][1,4]디아제핀-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1687] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(4-피리딜)-1,4-디아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1688] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(4,4-디메틸아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1689] 2-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-5,5-디플루오로-아제판-4-일]아세토니트릴;

[1690] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-(메톡시메틸)아제판-4-올;

[1691] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2,2-디플루오로-7-아자스피로[2.6]노난-7-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1692] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(트리플루오로메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1693] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-3,4-디올;

[1694] (1S,5R)-2-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-6,7-디올;

[1695] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5,5-디플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1696] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6,6-디메틸-아제판-4-올;

[1697] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1698] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[4-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1699] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[2-(히드록시메틸)아제판-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1700] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(히드록시메틸)-6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1701] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.2]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1702] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-6-메틸-아제판-4-올;

[1703] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-아자트리시클로[4.2.1.02,5]노난-3-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1704] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자비시클로[3.2.1]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1705] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[4-(아제판-1-일)부트-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1706] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3,3-디플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]

옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1707] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-에톡시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1708] 메틸 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-카르복실레이트;

[1709] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페녹시아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1710] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-메틸설포닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1711] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1712] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-모르폴리노아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1713] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(2-아자스피로[3.5]노난-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1714] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-피리미딘-4-일아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1715] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-[3-(트리플루오로메틸)아제티딘-1-일]프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1716] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(5-아자스피로[2.3]헥산-5-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1717] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-페닐아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1718] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(1-아자스피로[3.3]헵탄-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1719] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(7-메틸설포닐-2,7-디아자스피로[3.4]옥탄-2-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1720] 4-[1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제티딘-3-일]벤조니트릴

[1721] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-시클로프로필-3-플루오로-아제티딘-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1722] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4,5-디메틸-아제판-4-올;

[1723] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-메틸-아제판-3-올;

[1724] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-3-(플루오로메틸)아제판-3-올;

[1725] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]아제판-3-올;

[1726] 2-[6-아미노-5-[8-[2-[3-(3-플루오로-3-메틸-아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1727] 1-[3-[4-[3-[3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐]-4-메틸-아제판-4-올;

[1728] 2-[6-아미노-5-[9-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일]피리다진-3-일]페놀;

[1729] 2-[6-아미노-5-[2-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일]피리다진-3-일]페놀;

[1730] 2-[6-아미노-5-[6-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일]피리다진-3-일]페놀;

[1731] 2-[(10S)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀; 및

[1732] 2-[(10R)-12-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-1,5,6,8,12-펜트아자트리시클로[8.4.0.02,7]테트라데카-2(7),3,5-트리엔-4-일]페놀,

[1733] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1734] 본원에 기재된 본 개시의 화합물은 고체 또는 액체 형태로 존재할 수 있다. 고체 상태에서, 화합물은 결정질 또는 비결정질 형태 또는 이들의 혼합물로 존재할 수 있다. 예를 들어, 약제학적으로 허용되는 용매화물은 결정질 또는 비결정질 화합물로부터 형성될 수 있다. 결정질 용매화물에서, 용매 분자는 결정화 동안 결정 격자에 혼입된다. 물이 결정 격자에 혼입된 용매인 용매화물은 전형적으로 "수화물"로 지칭된다. 수화물은 화학량론적 수화물뿐만 아니라 다양한 양의 물을 함유하는 조성물을 포함한다. 이의 다양한 용매화물을 포함하여 결정 형태로 존재하는 본원에 기재된 이러한 화합물은 다형성(즉 상이한 결정 구조로 발생하는 능력)을 나타낼 수 있다. 이러한 상이한 결정질 형태는 일반적으로 "다형체"로 공지되어 있다. 본원에 개시된 주제는 이러한 다형체를 포함한다. 다형체는 동일한 화학 조성을 갖지만 패킹, 기하학적 배열 및 결정질 고체 상태의 다른 서술적인 특징이 상이하다.

[1735] 본원에 기재된 화합물 또는 이의 염은 입체이성질체 형태로 존재할 수 있다 (예를 들어, 이는 하나 이상의 비대칭 탄소 원자를 포함한다). 개별 입체이성질체(거울상이성질체 및 부분입체이성질체) 및 이들의 혼합물은 본원에 개시된 주제의 범위 내에 포함된다. 마찬가지로, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)이 화학식에 나타난 것 이외의 호변이성질체 형태로 존재할 수 있고 이들이 본원에 개시된 주제의 범위 내에 또한 포함된다는 것이 이해된다. 본원에 개시된 주제는 본원에 기재된 특정 군의 조합 및 하위집합을 포함하는 것으로 이해되어야 한다. 본원에 개시된 주제의 범위는 입체이성질체의 혼합물뿐만 아니라 정제된 거울상이성질체 또는 거울상이성질체적으로/부분입체이성질체적으로 농축된 혼합물을 포함한다. 본원에 개시된 주제는 상기 본원에 정의된 특정 군의 조합 및 하위집합을 포함하는 것으로 이해되어야 한다.

[1736] 본원에 개시된 주제는 또한 하나 이상의 원자가 자연에서 일반적으로 발견되는 원자 질량 또는 질량 수와 상이한 원자 질량 또는 질량 수를 갖는 원자로 대체된다는 사실을 제외하고는 본원에 기재된 화합물의 동위원소 표지된 형태를 포함한다. 본원에 기재된 화합물 및 이의 약제학적으로 허용되는 염에 혼입될 수 있는 동위원소의 예는 수소, 탄소, 질소, 산소, 인, 황, 플루오린, 아이오딘 및 염소의 동위원소, 예컨대 ^{2}H, ^{3}H, ^{11}C, ^{13}C, ^{14}C, ^{15}N, ^{17}O, ^{18}O, ^{31}P, ^{32}P, ^{35}S, ^{18}F, ^{36}Cl, ^{123}I 및 ^{125}I를 포함한다.

[1737] 전술한 동위원소 및/또는 다른 원자의 다른 동이원소를 포함하는 본원에 개시된 화합물 및 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)은 본원에 개시된 주제의 범위 내에 있다. 동위원소 표지된 화합물은 본원에 개시되고, 예를 들어 ^{3}H, ^{14}C와 같은 방사성 동위원소가 혼입된 것이 약물 및/또는 기질 조직 분포 분석에 유용하다. 삼중수소화, 즉 ^{3}H 및 탄소-14, 즉 ^{14}C 동위원소가 제조의 용이성 및 검출 가능성으로 인해 일반적으로 사용된다. ^{11}C 및 ^{18}F 동위원소는 PET(양전자 방출 단층촬영)에 유용하고, ^{125}I 동위원소는 SPECT(단일 광자 방출

전산화 단층촬영)에 유용하며, 모두 뇌 영상화에 유용하다. 추가로, 중수소, 즉 ^{2}H와 같은 더 무거운 동위원소를 사용한 치환은 더 큰 대사 안정성, 예를 들어 증가된 생체내 반감기 또는 감소된 투여량 요구 사항으로 인한 특정 치료적 이점을 제공할 수 있고 따라서 일부 상황에서 바람직할 수 있다. 화학식 I의 동위원소 표지된 화합물은 일반적으로 동위원소 표지되지 않은 시약을 쉽게 입수 가능한 동위원소 표지된 시약으로 대체함으로써 반응식 및/또는 하기의 실시예에 개시된 절차를 수행하여 제조될 수 있다.

[1738] III. 제제

[1739] 추가 양태에서, 본 설명은 유효량의, 예를 들어 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 적어도 하나의 화합물을 포함하여 본원에 기재된 화합물 중 적어도 하나, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염) 및 이들의 조합을 포함하는 치료적 또는 약제학적 조성물을 제공한다. 일부 구현예에서, 본 설명은 유효량의 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 적어도 하나의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 이들의 조합을 포함하는 치료적 또는 약제학적 조성물을 제공한다. 일부 구현예에서, 본 설명은 유효량의 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 적어도 하나의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 이들의 조합을 포함하는 치료적 또는 약제학적 조성물을 제공한다. 유효량의 본 개시에 따른 적어도 하나의 화합물 및 선택적으로 본원에 달리 기재된 화합물 중 하나 이상을 유효량으로, 약제학적 유효량의 담체, 첨가제 또는 부형제 및 선택적으로 추가의 생물활성제와 조합으로 포함하는 약제학적 조성물은 본 개시의 추가 양태를 나타낸다.

[1740] 특정 구현예에서, 조성물은 본원에 기재된 바와 같은 화합물의 약제학적으로 허용되는 염, 특히 산 또는 염기 부가염을 포함한다. 전술한 염기 화합물의 약제학적으로 허용가능한 산 부가염을 제조하는 데 사용되는 산은, 비독성 산 부가염, 즉, 수많은 다른 것들 중에서도, 약리학적으로 허용되는 음이온을 함유하는 염, 예컨대, 하이드로클로라이드, 하이드로브로마이드, 하이드로아이오다이드, 니트레이트, 설페이트, 비설페이트, 포스페이트, 산 포스페이트, 아세테이트, 락테이트, 시트레이트, 산 시트레이트, 타르트레이트, 비타르트레이트, 석시네이트, 말레에이트, 푸마레이트, 글루코네이트, 사카레이트, 벤조에이트, 메탄설포네이트, 에탄설포네이트, 벤젠설포네이트, p-톨루엔설포네이트 및 파모에이트[즉, 1,1'-메틸렌-비스-(2-히드록시-3 나프토에이트)]염을 형성하는 것을 포함한다.

[1741] 약제학적으로 허용되는 염기 부가염은 또한 화합물 또는 유도체의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 제조하기 위해 사용될 수 있다. 사실상 산성인 본 발명의 화합물의 약제학적으로 허용되는 염기 염을 제조하기 위한 시약으로서 사용될 수 있는 화학적 염기는 이러한 화합물과 함께 비독성 염기 염을 형성하는 것이다. 이러한 비독성 염기 염은 특히 이러한 약리학적으로 허용되는 양이온, 예컨대 알칼리 금속 양이온(예를 들어 칼슘 및 나트륨) 및 알칼리 토금속 양이온(예를 들어 칼슘, 아연 및 마그네슘), 암모늄 또는 수용성 아민 부가염, 예컨대 N-메틸글루카민-(메글루민), 및 저급 알칸올암모늄 및 약제학적으로 허용되는 유기 아민의 기타 염기 염으로부터 유도된 것을 포함하지만 이에 제한되지 않는다.

[1742] 본원에 기재된 바와 같은 조성물은 특정 구현예에서 경구, 비경구 또는 국소 경로에 의해 단일 또는 분할 단위 용량으로 투여될 수 있다. 화합물의 투여는 연속(정맥내 점적 주입)으로부터 하루에 수회의 경구 투여(예를 들어, Q.I.D.)의 범위일 수 있고, 다른 투여 경로 중에서 흡입 스프레이에 의해, 직장으로, 질로 또는 이식된 저장소를 통해 경구, 국소, 비경구, 근육내, 정맥내, 피하, 경피(침투 강화제를 포함할 수 있음), 협측, 설하 및 좌약 투여를 포함할 수 있다. 장용 코팅된 경구 정제가 경구 투여 경로로부터 화합물의 생체이용률을 향상시키기 위해 또한 사용될 수 있다. 가장 효과적인 투여 형태는 환자에서 질환의 중증도뿐만 아니라 선택된 특정 작용제의 약동학에 의존할 것이다. 비강내, 기관내 또는 폐 투여를 위한 스프레이, 미스트 또는 에어로졸로서의 본 개시에 따른 화합물의 투여가 또한 사용될 수 있다. 따라서 본 개시는 또한, 선택적으로 약제학적으로 허용되는 담체, 첨가제 또는 부형제와 조합으로, 첨가제 또는 부형제와 조합으로, 본 개시에 따른 본 개시에 따른 화합물을 포함하는 약제학적 조성물에 관한 것이다. 본 개시에 따른 화합물은 즉시 방출, 중간 방출 또는 지속 또는 제어 방출 형태로 투여될 수 있다. 지속 또는 제어 방출 형태는 바람직하게는 경구 투여되지만, 좌약 및 경피 또는 다른 국소 형태로 투여될 수도 있다. 리포좀 형태의 근육내 주사는 주사 부위에서 화합물의 방출을 제어 또는 지속하기 위해 사용될 수도 있다.

[1743] 따라서 한 양태에서, 본원에 기재된 바와 같은 화합물의 약제학적 제제는 약제학적으로 허용되는 비경구 비히클과 함께 단위 투여량 주사 가능한 형태로 비경구 투여를 위해 제조될 수 있다. 본원에 사용된 용어 "비경구"는 피하, 정맥내, 근육내, 관절내, 활막내, 흉골내, 척수강내, 간내, 병변내 및 두개내 주사 또는 주입 기술을 포함한다. 바람직하게는, 조성물은 경구, 복강내 또는 정맥내로 투여된다. 원하는 정도의 순도를 갖는 본 개시의 화합물은 선택적으로 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제(Remington's Pharmaceutical Sciences (1980) 16th edition, Osol, A. Ed.; 본원에 그 전체가 참조로 포함됨)와 재구성을 위한 동결건조된 제제 또는 수용액 형태로 혼합된다.

[1744] 본 개시의 조성물은 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체를 사용하여 통상적인 방식으로 제제화될 수 있고, 또한 제어 방출 제제로 투여될 수 있다. 본 개시의 화합물은 표준 제약 관행에 따라 약제학적 조성물로 제제화될 수 있다. 이 양태에 따르면, 본 개시의 화합물, 예를 들어 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을, 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제와 공동으로 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다. 일부 구현예에서, 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을, 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제와 공동으로 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다. 일부 구현예에서 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을, 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제와 공동으로 포함하는 약제학적 조성물이 제공된다.

[1745] 전형적인 제제는 본 개시의 화합물을 담체 및/또는 희석제와 같은 부형제와 혼합하여 제조된다. 적합한 담체, 희석제 및 다른 부형제는 당업자에게 공지되어 있고 탄수화물, 왁스, 수용성 및/또는 팽윤성 중합체, 친수성 또는 소수성 물질, 젤라틴, 오일, 용매, 물 등과 같은 물질을 포함한다. 사용되는 특정 담체, 희석제 또는 부형제는 화합물이 적용되는 수단 및 목적에 따라 달라질 것이다. 이들 약제학적 조성물에 사용될 수 있는 다른 약제학적으로 허용되는 담체는 이온 교환제, 알루미나, 알루미늄 스테아레이트, 레시틴, 혈청 단백질, 예컨대 인간 혈청 알부민, 완충제 물질, 예컨대 인산염, 글리신, 소르브산, 소르브산칼륨, 포화 식물성 지방산의 부분 글리세라이드 혼합물, 물, 염 또는 전해질, 예컨대 프롤라민 설페이트, 인산수소이나트륨, 인산수소칼륨, 염화나트륨, 아연 염, 콜로이드 실리카, 마그네슘 트리실리케이트, 폴리비닐 피롤리돈, 셀룰로스계 물질, 폴리에틸렌 글리콜, 나트륨 카르복시메틸셀룰로스, 폴리아크릴레이트, 왁스, 폴리에틸렌-폴리옥시프로필렌-블록 중합체, 폴리에틸렌 글리콜 및 양모 지방을 포함하지만 이에 제한되지 않는다.

[1746] 용매는 당업자가 포유동물에게 투여하기에 안전한 것으로 인식하는 용매를 기반으로 일반적으로 선택된다. 일반적으로, 안전한 용매는 물 및 물에 가용성 또는 혼화성인 다른 비독성 용매와 같은 비독성 수성 용매이다. 적합한 수성 용매는 물, 에탄올, 프로필렌 글리콜, 폴리에틸렌 글리콜(예를 들어 PEG 400, PEG 300) 등 및 이들의 혼합물을 포함한다. 허용되는 희석제, 담체, 부형제 및 안정화제는 이용되는 투여량 및 농도에서 수용자에게 비독성이며, 완충액, 예컨대 포스페이트, 시트레이트 및 기타 유기산; 아스코르브산 및 메티오닌을 포함하는 항산화제; 보존제(예컨대 옥타데실디메틸벤질 암모늄 클로라이드; 헥사메토늄 클로라이드; 벤잘코늄 클로라이드, 벤제토늄 클로라이드; 페놀, 부틸 또는 벤질 알코올; 알킬 파라벤, 예컨대 메틸 또는 프로필 파라벤; 카테콜; 레조르시놀; 시클로헥산올; 3-펜탄올; 및 m-크레졸); 저분자량(약 10 개 미만의 잔기) 폴리펩티드; 단백질, 예컨대 혈청 알부민, 젤라틴 또는 면역글로불린; 친수성 중합체, 예컨대 폴리비닐피롤리돈; 아미노산, 예컨대 글리신, 글루타민, 아스파라긴, 히스티딘, 아르기닌 또는 리신; 단당류, 이당류 및 글루코스, 만노스 또는 덱스트린을 포함하는 기타 탄수화물; 킬레이트제, 예컨대 EDTA; 당, 예컨대 수크로스, 만니톨, 트레할로스 또는 소르비톨; 염 형성 반대 이온, 예컨대 소듐; 금속 착물(예를 들어 Zn-단백질 착물); 및/또는 비이온성 계면활성제, 예컨대 TWEEN™, PLURONICS™ 또는 폴리에틸렌 글리콜(PEG)을 포함한다.

[1747] 제제는 본 개시의 화합물의 명쾌한 제시를 제공하거나 의약품 제조를 보조하기 위해 하나 이상의 완충제, 안정화제, 계면활성제, 습윤제, 윤활제, 유화제, 현탁화제, 보존제, 항산화제, 불투명화제, 활택제, 가공조제, 착색제, 감미료, 방향제, 착향제 및 다른 공지된 첨가제를 또한 포함할 수 있다. 제제는 통상적인 용해 및 혼합 절차를 사용하여 제조될 수 있다.

[1748] 제제화는 주위 온도에서 적절한 pH에서, 그리고 원하는 정도의 순도에서, 생리학적으로 허용되는 담체, 즉 사용된 투여량 및 농도에서 수용자에게 비독성인 담체와 혼합하여 수행될 수 있다. 제제의 pH는 화합물의 특정 용도 및 농도에 주로 의존하지만, 약 3 내지 약 8 범위일 수 있다. pH 5의 아세테이트 완충액 중 제제가 적합한 구현예이다.

[1749] 약제학적 조성물은 멸균 주사 가능 제제, 예컨대, 멸균 주사 가능한 수성 또는 유성 현탁액의 형태일 수 있다. 특히, 생체내 투여에 이용될 제제는 멸균이어야 한다. 이러한 멸균은 멸균 여과막을 통한 여과에 의해 쉽게 달성된다. 이 현탁액은 위에 언급된 적합한 분산제 또는 습윤제 및 현탁화제를 이용하여 당해 분야에서 공지된 기술에 따라 제제화될 수 있다. 멸균 주사용 제제는 또한 1,3-부탄디올과 같은 비독성 비경구적으로 허용되는 희석제 또는 용매 중 멸균 주사용 용액 또는 현탁액일 수 있다. 멸균 주사용 제제는 또한 동결건조된 분말로 제조될 수 있다. 사용될 수 있는 허용되는 비히클 및 용매 중에는 물, 링거액 및 등장성 염화나트륨 용액이 있다. 또한, 멸균 고정유가 용매 또는 현탁 매질로서 통상적으로 사용될 수 있다. 이 목적을 위해, 합성 모노글리세라이드 또는 디글리세라이드를 포함하는 임의의 무자극(bland) 고정유가 사용될 수 있다. 또한, 올레산과 같은 지방산뿐만 아니라 올리브유 또는 피마자유와 같은 천연의 약제학적으로 허용되는 오일이, 특히 폴리옥시에틸화 버전으로 마찬가지로 주사제의 제조에 사용될 수 있다. 이러한 오일 용액 또는 현탁액은 또한 장쇄 알코올 희석제 또는 분산제, 예컨대 Ph. Helv 또는 유사 알코올을 함유할 수 있다.

[1750] 비경구 투여에 적합한 제제는 산화방지제, 완충제, 정균제 및 제제를 의도된 수용자의 혈액과 등장성이 되도록 하는 용질을 포함할 수 있는 수성 및 비수성 멸균 주사 용액; 및 현탁화제 및 증점제를 포함할 수 있는 수성 및 비수성 멸균 현탁액을 포함한다.

[1751] 본원에 기재된 바와 같은 약제학적 조성물은 캡슐, 정제, 수성 현탁액 또는 용액을 포함하지만 이에 제한되지 않는 임의의 경구로 허용되는 제형으로 경구로 투여될 수 있다. 경구 사용을 위한 정제의 경우, 통상적으로 사용되는 담체는 락토스 및 옥수수 전분을 포함한다. 윤활제, 예컨대 마그네슘 스테아레이트가 또한 전형적으로 첨가된다. 캡슐 형태의 경구 투여를 위해, 유용한 희석제는 락토스 및 건조 옥수수 전분을 포함한다. 경구 사용을 위해 수성 현탁액이 필요한 경우, 활성 성분은 유화제 또는 현탁화제와 조합된다. 원한다면, 특정 감미료, 착향제 또는 착색제가 또한 첨가될 수 있다.

[1752] 대안적으로, 본원에 기재된 바와 같은 약제학적 조성물은 직장 투여를 위한 좌제의 형태로 투여될 수 있다. 이들은 실온에서 고체이지만 직장 온도에서는 액체이므로 직장에서 녹아 약물을 방출할 적합한 비자극성 부형제와 제제를 혼합하여 제조될 수 있다. 이러한 물질은 코코아 버터, 밀랍 및 폴리에틸렌 글리콜을 포함한다.

[1753] 본원에 기재된 바와 같은 약제학적 조성물은 또한 국소적으로 투여될 수 있다. 적합한 국소 제제는 이들 영역 또는 기관 각각에 대해 용이하게 제조된다. 하부 장관에 대한 국소 적용은 직장 좌약 제제(상기 참조) 또는 적합한 관장 제제로 이루어질 수 있다. 국소적으로 허용되는 경피 패치가 또한 사용될 수 있다.

[1754] 국소 적용을 위해, 약제학적 조성물은 하나 이상의 담체에 현탁되거나 용해된 활성 성분을 포함하는 적합한 연고로 제제화될 수 있다. 대안적으로, 약제학적 조성물은 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체에 현탁되거나 용해된 활성 성분을 포함하는 적합한 로션 또는 크림으로 제제화될 수 있다.

[1755] 안과용 사용을 위해, 약제학적 조성물은 보존제가 있거나 없이 등장성 pH 조정된 멸균 식염수 중 미분화된 현탁액으로서 또는 등장성 pH 조정된 멸균 식염수 중 용액으로서 제제화될 수 있다. 대안적으로, 안과적 사용을 위해, 약제학적 조성물은 연고로 제제화될 수 있다.

[1756] 본 개시의 약제학적 조성물은 또한 비강 에어로졸 또는 흡입에 의해 투여될 수 있다. 이러한 조성물은 약제학적 제제 분야에 공지된 기술에 따라 제조된다.

[1757] 본 개시의 조성물은 통상적으로 고체 조성물, 동결건조된 제제 또는 수용액으로서 보관될 수 있다.

[1758] 본 개시의 화합물은 약물의 용이하게 제어 가능한 투여량을 제공하고 처방된 요법에 환자가 순응할 수 있도록 약제학적 제형으로 제제화될 수 있다. 적용을 위한 약제학적 조성물(또는 제제)는 약물을 투여하기 위해 사용된 방법에 따라 다양한 방식으로 포장될 수 있다. 일반적으로, 유통 물품은 적절한 형태의 약제학적 제제가 담겨 있는 용기를 포함한다. 적합한 용기는 당업자에게 공지되어 있고 병(플라스틱 및 유리), 사쉐, 앰플, 플라스틱 백, 금속 실린더 등과 같은 재료를 포함한다. 용기는 패키지의 내용물에 대한 무분별한 접근을 예방하기 위한 변조 방지 조립체를 또한 포함할 수 있다. 또한, 용기에는 용기의 내용물을 설명하는 라벨이 부착된다. 라벨은 적합한 주의사항을 또한 포함할 수 있다.

[1759] 제제는 단위 용량 또는 다중 용량 용기, 예를 들어, 밀봉된 앰풀 및 바이알에서 포장될 수 있고, 사용 직전에 주사를 위한 멸균 액체 담체, 예를 들어, 물의 첨가만을 필요로 하는 냉동 건조된(동결 건조) 상태에서 보관될 수 있다. 즉석 주사 용액 및 현탁액은 이전에 기재된 종류의 멸균 분말, 과립 및 정제로부터 제조된다. 바람직한 단위 투여량 제제는 본원에 전술한 바와 같이 일일 용량 또는 단위 일일 하위 용량, 또는 이의 적절한 분율의 활성 성분을 포함하는 것이다.

[1760] 임의의 특정 환자에 대한 특정 투여량 및 치료 요법은 사용된 특정 화합물의 활성, 연령, 체중, 일반적 건강, 성별, 식이, 투여 시간, 배설률, 약물 조합 및 치료 의사의 판단과 치료 중인 특정 질병 또는 병태의 중증도를 포함하는 다양한 요인에 따라 달라질 것으로 또한 이해되어야 한다.

[1761] 본 개시에 따른 화합물을 사용하는 요법을 필요로 하는 환자 또는 대상체는 선택적으로 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제 중 그 약제학적으로 허용되는 염, 용매화물 또는 다형체를 포함하여 유효량의 본 개시에 따른 화합물을, 단독으로 또는 본원에서 달리 확인된 다른 공지된 적혈구형성 자극제와 조합으로 환자(대상체)에게 투여함으로써 치료될 수 있다.

[1762] 활성 화합물(예를 들어 본 개시의 화합물 또는 이의 염)은 치료되는 환자에서 심각한 독성 효과를 일으키지 않으면서, 원하는 적응증에 대한 치료적 유효량을 환자에게 전달하기에 충분한 양으로 약제학적으로 허용되는 담체 또는 희석제에 포함된다. 본원에 언급된 병태에 대한 활성 화합물의 바람직한 용량은 일일 수용자/환자의 체중 킬로그램당 약 10 ng/kg 내지 300 mg/kg, 바람직하게는 0.1 내지 100 mg/kg, 더 일반적으로는 0.5 내지 약 25 mg의 범위이다. 위에 언급된 요소에 따라, 한 전형적인 일일 투여량의 범위는 약 1 μg/kg 내지 100 mg/kg 또는 그 이상일 수 있다. 전형적인 국소 투여량은 적합한 담체 중 0.01-5% wt/wt 범위일 것이다.

[1763] 화합물은 단위 투여량 형태당 1 mg 미만, 1 mg 내지 3000 mg, 바람직하게는 5 내지 500 mg의 활성 성분을 함유하는 것을 포함하지만 이에 제한되지 않는 임의의 적합한 단위 투여량 형태로 편리하게 투여된다. 약 25-250 mg의 경구 투여량이 흔히 편리하다.

[1764] 활성 성분은 바람직하게는 약 0.00001-30 mM, 바람직하게는 약 0.00001-0.01 mM, 또는 다른 구현예에서, 약 0.1-30 mM의 활성 화합물의 피크 혈장 농도를 달성하도록 투여된다. 이는 예를 들어, 선택적으로 식염수 또는 수성 매질 중 활성 성분의 용액 또는 제제의 정맥 주사에 의해 달성되거나 활성 성분의 볼루스(bolus)로서 투여될 수 있다. 경구 투여는 또한 유효 혈장 농도의 활성제를 생성하기에 적절하다.

[1765] 약물 조성물 중 활성 화합물의 농도는 약물의 흡수, 분포, 불활성화 및 배설률뿐만 아니라 당업자에게 공지된 다른 요인에 의존할 것이다. 투여량 값은 또한 완화될 병태의 중증도에 따라 달라질 것임에 유념해야 한다. 임의의 특정 대상체에 대해, 특정 투여량 요법은 조성물의 투여를 실시 또는 감독하는 사람의 개인적 필요성 및 전문적 판단에 따라 시간 경과에 따라 조정되어야 하고, 본원에 제시된 농도 범위는 단지 예시적이며 청구된 조성물의 범위 또는 실시를 제한하도록 의도되지 않는다는 것이 또한 이해되어야 한다. 활성 성분은 한 번에 투여될 수 있거나, 다양한 시간 간격으로 투여될 다수의 더 작은 용량으로 분할될 수 있다.

[1766] 구현예에서, 활성 화합물은 이식물 및 마이크로캡슐화 전달 시스템을 포함하는 제어 방출 제제와 같이 신체로부터의 빠른 제거로부터 화합물을 보호할 담체를 사용하여 제조된다. 생물분해성, 생체적합성 중합체, 예컨대, 에틸렌 비닐 아세테이트, 폴리무수물, 폴리글리콜산, 콜라겐, 폴리오르토에스테르 및 폴리락트산이 사용될 수 있다. 이러한 제제의 제조 방법은 당업자에게 명백할 것이다.

[1767] 리포좀 현탁액이 또한 약제학적으로 허용되는 담체일 수 있다. 이들은 예를 들어 미국 특허 번호 4,522,811(본원에 그 전체가 참조로 포함됨)에 설명된 바와 같이 당업자에게 공지된 방법에 따라 제조될 수 있다.

[1768] 구현예에서, 조성물은 예를 들어 화합물의 용해 및 생체이용률을 촉진하기 위해 환자의 위장관의 위액에서의 화합물의 용해도를 증가시키기 위해 제시되는 본원에 기재된 화합물 중 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 포함한다. 구현예에서, 약제학적으로 허용되는 염은, 적용 가능한 경우, 약제학적으로 허용되는 무기 또는 유기 염기 및 산으로부터 유도된 것을 포함한다. 적합한 염은 제약 분야에서 공지된 다수의 다른 산 및 염기 중에서, 칼륨 및 나트륨과 같은 알칼리 금속, 칼슘, 마그네슘 및 암모늄 염과 같은 알칼리 토금속으로부터 유도된 것을 포함한다.

[1769] 용어 "약제학적으로 허용되는 유도체"는 환자에게 투여 시 본 화합물 또는 본 화합물의 활성 대사산물을 직접적으로 또는 간접적으로 제공하는 임의의 약제학적으로 허용되는 전구약물 형태(예컨대 에스테르, 아미드 및 기타 전구약물 기)를 기재하기 위해 명세서 전체에 걸쳐 사용된다.

[1770] 따라서 주제는 따라서 수의학적 담체와 함께 위에 정의된 바와 같은 적어도 하나의 활성 성분을 포함하는 수의학적 조성물을 추가로 제공한다. 수의학적 담체는 조성물을 투여하는 목적에 유용한 물질이며 수의학 분야에서 불활성이거나 허용되는 고체, 액체 또는 기체 물질일 수 있고 활성 성분과 상용성이다. 이들 수의학적 조성물은 비경구적으로 또는 임의의 다른 원하는 경로에 의해 투여될 수 있다.

[1771] IV. 적응증 및 치료 방법

[1772] 본원에 개시된 화합물이 다양한 질환 또는 장애를 치료하는 데 사용될 수 있음이 고려된다. 일반적으로, 치료될 질환 또는 장애는 암과 같은 과증식성 질환이다.

[1773] 본 개시의 화합물 또는 이의 염은 치료될 병태에 적절한 임의의 경로에 의해 투여될 수 있다. 화합물은 전형적으로 비경구적으로, 즉 주입, 피하, 근육내, 정맥내, 진피내, 척추강내 및 경막외로 투여될 것이다.

[1774] "BRM 매개 질환, 장애 또는 병태"는 질환, 장애 또는 병태의 시작, 하나 이상의 증상 또는 질환 표지자의 표시, 중증도 또는 진행에서 BRM의 참여를 특징으로 한다. BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 SMARCA1, BRAHMA 또는 BRM 축적 및 응집과 연관될 수 있다. BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 SMARCA2 의존성일 수 있다.

[1775] BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML을 포함하지만 이에 제한되지 않는 암을 포함한다.

[1776] 구현예에서, BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 BRG1 돌연변이가 있는 SWI/SNF 연관 암 또는 BRG1 결핍 암 또는 정상 BRG1 발현에 비해 (예를 들어 야생형 BRG1을 갖는 유사하게 위치하는 비암성 세포에서 돌연변이되지 않은 BRG1 또는 BRG1의 발현에 비해) BRG1의 발현이 감소된 암과 같은 BRG1(SMARCA4) 관련 질환, 장애 또는 병태이다.

[1777] BRG1 관련 장애는 소세포 폐암 및 비소세포 폐암과 같은 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암을 포함하지만 이에 제한되지 않는 암을 포함한다.

[1778] 구현예에서, BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 암이다. 구현예에서, BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택된다.

[1779] 구현예에서, BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 폐암 또는 비소세포 폐암이다.

[1780] 구현예에서, 본 개시는 (시험관내 또는 생체내) BRM의 조절을 위한, 본 개시 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)의 용도에 관한 것이다. 구현예에서, 본 개시는 (시험관내 또는 생체내) BRM의 조절을 위한, 본 개시 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-

A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)의 용도에 관한 것이다. 구현예에서, 본 개시는 (시험관내 또는 생체내) BRM의 조절을 위한, 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)의 용도에 관한 것이다. 구현예에서, 본 개시는 (시험관내 또는 생체내) BRM의 조절을 위한, 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염))의 용도에 관한 것이다.

[1781] 특정 구현예에서, 본 개시는 치료를 필요로 하는 대상체(예를 들어 인간 대상체)의 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체(예를 들어 인간 대상체)에게 유효량의 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법에 관한 것이다. 특정 구현예에서, 본 개시는 치료를 필요로 하는 대상체(예를 들어 인간 대상체)의 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체(예를 들어 인간 대상체)에게 유효량의 본 개시의 화합물(예를 들어 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물), 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법에 관한 것이다. 특정 구현예에서, 본 개시는 치료를 필요로 하는 대상체(예를 들어 인간 대상체)의 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체(예를 들어 인간 대상체)에게 유효량의 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법에 관한 것이다. 특정 구현예에서, 본 개시는 치료를 필요로 하는 대상체(예를 들어 인간 대상체)의 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체(예를 들어 인간 대상체)에게 유효량의 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법에 관한 것이다.

[1782] 구현예에서, 병태, 질환 또는 장애는 BRM 매개 장애이다. 따라서, 또 다른 구현예는 치료를 필요로 하는 대상체의 BRM 매개 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 치료를 필요로 하는 대상체의 BRM 매개 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 치료를 필요로 하는 대상체의 BRM 매개 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 치료를 필요로 하는 대상체의 BRM 매개 병태, 질환 또는 장애를 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식

(II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 본 개시의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다.BRM 매개 장애는 본원에 기재된 장애를 포함하지만 이에 제한되지 않는다.

[1783] 또 다른 구현예는 세포에서 BRM 함유 단백질을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 본 개시의 화합물(예를 들어 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염))을 포함하는 조성물에 노출하는 것을 포함하고, 여기서 화합물은 BRM 함유 단백질의 분해를 유발하는 방법에 관한 것이다. 또 다른 구현예는 세포에서 BRM 함유 단백질을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 본 개시의 화합물(예를 들어 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염))을 포함하는 조성물에 노출시키는 것을 포함하고, 여기서 화합물은 BRM 함유 단백질의 분해를 유발하는 방법에 관한 것이다. 또 다른 구현예는 세포에서 BRM 함유 단백질을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 조성물에 노출시키는 것을 포함하고, 여기서 화합물은 BRM 함유 단백질의 분해를 유발하는 방법에 관한 것이다. 또 다른 구현예는 세포에서 BRM 함유 단백질을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 조성물에 노출시키는 것을 포함하고, 여기서 화합물은 BRM 함유 단백질의 분해를 유발하는 방법에 관한 것이다. 용어 "분해하는"은, 세포에서 BRM 함유 단백질을 분해하는 것과 관련하여 사용될 때, 세포에서 단백질의 수준이 감소됨을 의미한다. 세포는, 예를 들어, 인간 세포를 포함하는 임의의 동물 세포일 수 있다.

[1784] 또 다른 구현예는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염을 포함하는 약제학적으로 허용되는 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염을 포함하는 약제학적으로 허용되는 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염을 포함하는 약제학적으로 허용되는 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 상기 화합물 또는 염을 포함하는 약제학적으로 허용되는 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다.

[1785] 특정 구현예에서, 치료제는 하나 이상의 증상이 발생한 후에 투여될 수 있다. 다른 구현예에서, 치료제는 증상 없이 투여될 수 있다. 예를 들어, 치료제는 (예를 들어 증상의 병력에 비추어 및/또는 유전적 또는 기타 민감성 요인에 비추어) 증상의 발현 전에 민감한 개체에게 투여될 수 있다. 예를 들어 재발을 예방하거나 지연시키기 위해 증상이 해결된 후에도 치료를 또한 계속할 수 있다.

[1786] 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에

노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1787] 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2) 또는 (I-J3)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2) 또는 (I-J3)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 세포에서 BRM을 분해하는 방법으

로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1788] 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1789] 구현예에서, BRM 매개 질환, 장애 또는 병태는 BRG-1 관련 질환, 장애 또는 병태이다.

[1790] 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 본원에서는 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-J), (I-J1), (I-J2) 또는 (I-

J3)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2) 또는 (I-J3)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 치료를 필요로 하는 개체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1791] 구현예에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것

들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1792] 구현예에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I')의 화합물, (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (III')의 화합물, 예컨대 화학식의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 개체에게 (1) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 세포를 (1) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 (2) (i) 유효량의 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1793] 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9),

(I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[1794] 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM 또는 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[1795] 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (III')의

화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[1796] 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (I)의 화합물, 예컨대 화학식 (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1) 또는 (I-G)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이 제공된다. 구현예에서, 본원에서는 암의 치료에 사용하기 위한, 화학식 (II') 또는 화학식 (II)의 화합물, 예컨대 화학식 (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염의 용도가 제공된다.

[1797] 병용 투여

[1798] 본 개시의 화합물은 요법에서 단독으로 사용되거나 다른 작용제와 병용될 수 있다. 예를 들어, 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)은 적어도 하나의 추가 치료제와 병용 투여될 수 있다. 일부 구현예에서, 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)은 적어도 하나의 추가 치료제와 병용 투여될 수 있다. 일부 구현예에서, 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)은 적어도 하나의 추가 치료제와 병용 투여될 수 있다. 일부 구현예에서, 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)은 적어도 하나의 추가 치료제와 병용 투여될 수 있다. 상기 언급된 병용 요법은 병용 투여(여기서 두 가지 이상의 치료제가 동일한 또는 별도의 제제에 포함됨) 및 별도의 투여를 포함하며, 이 경우, 본 개시의 화합물의 투여는 추가 치료제 및/또는 보조제의 투여 전에, 투여와 동시에(예를 들어 함께) 및/또는 투여 이후에 일어날 수 있다. 본 개시의 화합물 또는 이의 염은 방사선 요법과 병용될 수도 있다.

[1799] 용어 "병용 투여" 또는 "병용 요법"은 두 가지 이상의 화합물 각각의 유효량 또는 농도가 환자에서 주어진 시점에 발견될 수 있도록, 적어도 두 가지의 화합물 또는 조성물이 환자에게 동시에 투여됨을 의미한다. 본 개시에

따른 화합물이 환자에게 동시에 병용 투여될 수 있지만, 상기 용어는 동시에 또는 상이한 시간에 두 가지 이상의 제제의 투여를 모두 포함하고, 단 병용 투여된 화합물 또는 조성물의 유효 농도가 주어진 시간에 대상체에서 발견된다.

[1800] 용어 "추가 치료제"는 개시된 화합물이 사용되는 의도된 요법, 억제 및/또는 예방(prevention/prophylaxis) 수행을 보조하기 위해 생물학적 활성을 갖는 제제로서 개시된 화합물과 조합하여 사용되는, 본원에 기재된 화합물 이외의 제제를 기재하기 위해 사용된다. 본원에서 사용하기 위한 추가 치료제는 개시된 화합물이 사용되거나 투여되는 것과 유사한 약리학적 활성 또는 치료 효과를 갖는 제제를 포함할 수 있다. 구현예에서, 본원에 기재된 화합물, 추가 치료제 또는 둘 모두가 유효량으로 또는, 특정 구현예에서, 상승적 유효량으로 존재한다.

[1801] 본 개시는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 본 개시는 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는 방법을 포함한다. 일부 구현예에서, 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다. 일부 구현예에서, 대상체의 암을 치료하는 방법으로서, 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는 방법이 제공된다.

[1802] 또 다른 구현예는 대상체에게 (a) 유효량의 화학식 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는, 대상체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4) 또는 (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는, 대상체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는, 대상체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법을 포함한다. 또 다른 구현예는 대상체에게 유효량의 (a) 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B) 또는 (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 및 (b) 하나 이상의 항암제, 예컨대 세포독성제 또는 화학요법제를 투여하는 것을 포함하는, 대상체에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법을 포함한다.

[1803] 본원에서 사용된 용어 "세포독성제" 또는 "화학요법제"는 세포 기능을 억제하거나 예방하고 및/또는 세포 사멸 또는 파괴를 야기하는 물질을 지칭한다. 세포독성제는 방사성 동위원소(예를 들어 At^{211}, I^{131}, I^{125}, Y^{90}, Re^{186}, Re^{188}, Sm^{153}, Bi^{212}, P^{32}, Pb^{212} 및 Lu의 방사성 동위원소); 화학요법제; 성장 억제제; 효소 및 이의 단편, 예컨대 핵산분해 효소; 및 독소, 예컨대 소분자 독소 또는 세균, 진균, 식물 또는 동물 기원의 효소적 활성 독소를, 이들의 단편 및/또는 변이체를 포함하여 포함하지만 이에 제한되지 않는다.

[1804] 구현예에서 세포독성제는 항미세소관제, 백금 배위 복합체, 알킬화제, 항생제, 토포이소머라제 II 억제제, 항대

사물질, 토포이소머라제 I 억제제, 호르몬 및 호르몬 유사체, 신호 전달 경로 억제제, 비수용체 티로신 키나제 혈관신생 억제제, 면역치료제, 세포자멸유도제, LDH-A 억제제, 지방산 생합성 억제제, 세포 주기 신호전달 억제제, HDAC 억제제, 프로테아솜 억제제 및 암 대사 억제제로부터 선택된다.

[1805] 투여

[1806] 본 개시의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염(및 임의의 추가 치료제) 및 본 개시의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염(및 임의의 추가 치료제)을 포함하는 약제학적 조성물은 우수한 의료적 관행에 일치하는 방식, 즉 양, 농도, 일정, 과정, 비히클 및 투여 경로로 제제화, 투약 및 투여될 수 있다.

[1807] 구현예에서, 이러한 화합물, 염, 조성물 및 제제는 비경구, 폐내 및 비강내, 그리고 국소 치료를 위해 원하는 경우, 병변내 투여를 포함하는 임의의 적합한 수단에 의해 투여된다. 비경구 주입은 근육내, 정맥내, 동맥내, 복강내 또는 피하 투여를 포함한다. 투여 경로는 투여가 단기인지 만성인지 여부에 적어도 부분적으로 기초하여 결정될 수 있다. 투여는 단회 또는 다양한 시점에 걸친 다회 투여, 볼루스 투여 및 펄스 주입을 포함하지만 이에 제한되지 않는 투약 일정으로 이루어질 수 있다.

[1808] 질환의 예방 또는 치료를 위해, (단독으로 또는 하나 이상의 다른 추가 치료제와 조합으로 사용되는 경우) 본 개시의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염의 적절한 투여량은 치료될 질병의 유형, 질병의 중증도 및 경과, 장애의 원인, 제제 전달 부위, 투여 방법, 투여 일정, 투여될 화합물(들)의 유형, 화합물 또는 이의 염이 예방 또는 치료 목적으로 투여되는지 여부, 개별 환자의 임상 상태, 환자가 받은 이전의 요법, 환자의 임상 병력 및 화합물에 대한 반응 및 의사에게 알려진 다른 요인과 같은 요인에 따라 달라질 것이다.

[1809] 적어도 부분적으로 이들 요인에 따라, 본 개시의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염은 약 10 ng/kg 내지 300 mg/kg(예를 들어 0.1 mg/kg - 10 mg/kg)와 같은 적합한 투여량 또는 투여량들로 1 회 이상의 개별 투여에 의해 또는 연속 주입에 의해 "치료적 유효량"으로 환자에게 적합하게 투여된다. 하나의 전형적인 일일 투여량은 약 1 μg/kg 내지 100 mg/kg 이상의 범위일 수 있다. 그러한 용량은 간헐적으로, 예를 들어 매주마다 또는 3주마다 투여될 수 있다 (예를 들어, 따라서 환자가 약 2 회 내지 약 20 회, 또는 예를 들어 약 6회 용량을 투여받는다). 초기의 더 높은 부하 용량에 이어서, 하나 이상의 낮은 용량이 투여될 수 있다. 그러나, 다른 투여량 요법이 유용할 수 있다. 이 요법의 진행은 통상적인 기술 및 분석법에 의해 쉽게 모니터링되고 일반적으로 적어도 하나의 질환 증상 또는 생물학적 표지자의 원하는 억제가 발생할 때까지 지속될 수 있다.

[1810] 투여될 화합물의 "치료적 유효량"은 이러한 고려사항에 의해 좌우될 것이며, 이러한 양은 바람직하게는 숙주에게 독성이거나 숙주를 원하지 않는 부작용에 현저하게 더 민감하게 만드는 양보다 적다.

[1811] V. 제조 물품

[1812] 또 다른 양태에서, 본원에서는 제조 물품이 기재되고, 예를 들어, 위에 기재된 질환 및 장애의 치료에 유용한 물질을 포함하는 "키트"가 제공된다. 키트는 본 개시의 화합물 또는 이의 염을 포함하는 용기를 포함한다. 키트는 용기 상에 또는 용기와 결합된 라벨 또는 패키지 삽입물을 더 포함할 수 있다. 용어 "패키지 삽입물"은 치료 제품의 적응증, 사용법, 투여량, 투여법, 사용에 관한 금기 및/또는 경고에 대한 정보를 포함하는, 치료 제품의 상업적 패키지에 통상적으로 포함되는 설명서를 지칭하기 위해 사용된다.

[1813] 적합한 용기는 예를 들어 병, 바이알, 주사기, 블리스터 팩 등을 포함한다. "바이알"은 액체 또는 동결건조 제제를 담기에 적합한 용기이다. 구현예에서, 바이알은 일회용 바이알, 예를 들면 마개가 있는 20-cc 일회용 바이알이다. 용기는 유리 또는 플라스틱과 같은 다양한 재료로 형성될 수 있다. 용기는 병태 치료에 효과적인 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1) 또는 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 이의 제제를 수용할 수 있고 멸균 접근 포트를 가질 수 있다 (예를 들어, 용기는 정맥주사 용액 백 또는 피하주사 바늘로 뚫을 수 있는 마개를 갖는 바이알일 수 있다). 용기는 병태 치료에 효과적인 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 이의 제제를 수용할 수 있고 멸균 접근 포트를 가질 수 있다 (예를 들어, 용기는 정맥주사 용액 백 또는 피하주사 바늘로 뚫을 수 있는 마개를 갖는 바

이알일 수 있다). 용기는 병태 치료에 효과적인 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염), 또는 이의 제제를 수용할 수 있고 멸균 접근 포트를 가질 수 있다 (예를 들어, 용기는 정맥주사 용액 백 또는 피하주사 바늘로 뚫을 수 있는 마개를 갖는 바이알일 수 있다).

[1814] 조성물 내 적어도 하나의 활성제는 본 개시의 화합물 또는 이의 염이다. 라벨 또는 패키지 삽입물은 조성물이 암과 같은 선택된 병태를 치료하는 데 사용된다는 것을 지시한다. 또한, 라벨 또는 패키지 삽입물은 치료될 환자가 과증식성 장애, 신경변성, 심장 비대, 통증, 편두통 또는 신경외상성 질환 또는 이벤트와 같은 장애를 갖는 환자임을 나타낼 수 있다. 구현예에서, 라벨 또는 패키지 삽입물은 본 개시의 화합물 또는 이의 염을 포함하는 조성물이 비정상 세포 성장으로 인한 장애를 치료하는 데 사용될 수 있음을 나타낸다. 라벨 또는 패키지 삽입물은 조성물이 기타의 장애를 치료하는 데 사용될 수 있음을 나타낼 수도 있다. 대안적으로 또는 추가적으로, 제조 물품은 약제학적으로 허용되는 완충액, 예컨대 주사용 정균수(BWFI), 인산염 완충 식염수, 링거액 및 덱스트로스 용액을 포함하는 제2 용기를 더 포함할 수 있다. 이는 다른 완충액, 희석제, 필터, 바늘 및 주사기를 포함하는, 상업적 관점 및 이용자 관점으로부터 바람직한 다른 재료를 추가로 포함할 수 있다.

[1815] 키트는 화합물 또는 이의 염 및 존재하는 경우 제2 약제학적 제제의 투여를 위한 지시사항을 추가로 포함할 수 있다. 예를 들어, 키트가 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1) 또는 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 제1 조성물 및 제2 약제학적 제제를 포함하는 경우, 키트는 필요로 하는 환자에게 제1 및 제2 약제학적 조성물을 동시, 순차 또는 개별 투여하기 위한 지시사항을 추가로 포함할 수 있다. 키트가 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 제1 조성물 및 제2 약제학적 제제를 포함하는 경우, 키트는 필요로 하는 환자에게 제1 및 제2 약제학적 조성물을 동시, 순차 또는 개별 투여하기 위한 지시사항을 추가로 포함할 수 있다. 키트가 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)을 포함하는 제1 조성물 및 제2 약제학적 제제를 포함하는 경우, 키트는 필요로 하는 환자에게 제1 및 제2 약제학적 조성물을 동시, 순차 또는 개별 투여하기 위한 지시사항을 추가로 포함할 수 있다.

[1816] 구현예에서, 키트는 본 개시의 화합물 또는 이의 염의 고체 경구 형태, 예컨대 정제 또는 캡슐의 전달에 적합하다. 이러한 키트는 바람직하게는, 다수의 단위 투여량을 포함한다. 이러한 키트는 이의 의도된 사용 순서로 지정된 투여량 갖는 카드를 포함할 수 있다. 이러한 키트의 예는 "블리스터 팩"이다. 블리스터 팩은 포장 산업에서 공지되어 있으며 약학적 단위 제형을 포장하는 데 널리 사용된다. 원하는 경우에, 예를 들어, 숫자, 문자 또는 기타 표시의 형태로 또는 치료 일정에서 투여량이 투여될 수 있는 일자를 지정하는 일정표 삽입물로 기억 보조 장치가 제공될 수 있다.

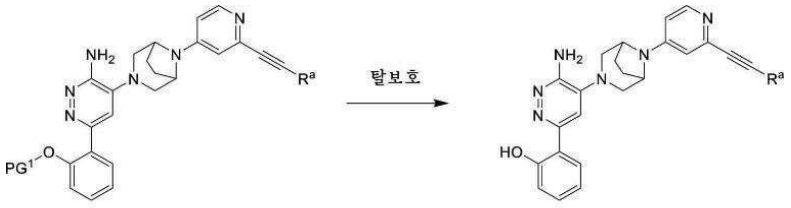
[1817] 한 구현예에 따르면, 키트는 (a) 본 개시의 화합물, 예를 들어 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-L5), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-M5), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (IV'-N5), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1) 또는 (III')의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)이 내부에 포함된 제1 용기; 및 선택적으로 (b) 제2 약제학적 제제(여기서 제2 약제학적 제제는 항과증식 활성을 갖는 제2 화합물을 포함함)가 내부에 포함된 제2 용기를 포함할 수 있다. 일부 구현예에서, 키트는 (a) 본 개시의 화합물, 예를 들어 화학식 (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)이 내부에 포함된 제1 용기; 및 선택적으로 (b) 제2 약제학적 제제(여기서 제2 약제학적 제제는 항과증식 활성을 갖는 제2 화합물을 포함함)가 내부에 포함된 제2 용기를 포함할 수 있다. 일부 구현예에서, 키트는 (a) 본 개시의 화합물, 예를 들어 화학식 (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1)의 화합물, 또는 이의 염(예를 들어 약제학적으로 허용되는 염)이 내부에 포함된

제1 용기; 및 선택적으로 (b) 제2 약제학적 제제(여기서 제2 약제학적 제제는 항과증식 활성을 갖는 제2 화합물을 포함함)가 내부에 포함된 제2 용기를 포함할 수 있다. 대안적으로 또는 추가적으로, 키트는 약제학적으로 허용되는 완충액, 예컨대 정균성 주사용수(BWFI), 인산염 완충 식염수, 링거액 및 덱스트로스 용액을 포함하는 제3 용기를 추가로 포함할 수 있다. 이는 다른 완충액, 희석제, 필터, 바늘 및 주사기를 포함하는, 상업적 관점 및 이용자 관점으로부터 바람직한 다른 재료를 추가로 포함할 수 있다.

[1818] 키트가 본 개시의 화합물 또는 이의 염 및 제2 치료제를 포함하는 특정한 다른 구현예에서, 키트는 분할된 병 또는 분할된 호일 패킷과 같은 별도의 조성물이 들어 있는 용기를 포함할 수 있지만; 별도의 조성물이 분할되지 않은 단일 용기 내에 들어 있을 수도 있다. 전형적으로, 키트는 개별 성분의 투여를 위한 지시사항을 포함한다. 키트 형태는 개별 성분이 바람직하게는 상이한 투여 제형(예컨대, 경구 및 비경구)로 투여되거나, 상이한 투여 간격으로 투여되거나, 조합의 개별 성분의 적정이 처방 의사에 의해 요구되는 경우에 특히 유리하다.

[1819] VI. 공정 구현예

[1820] 일부 구현예에서, 화학식 (I'), (I), (II'), (II), (III') 또는 (IV'), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물(예를 들어 화학식 (I-F)의 화합물 포함)을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-1에 따라 화학식 S1의 화합물(여기서 PG^1은 보호기)을 반응시켜 화학식 (I-F)의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

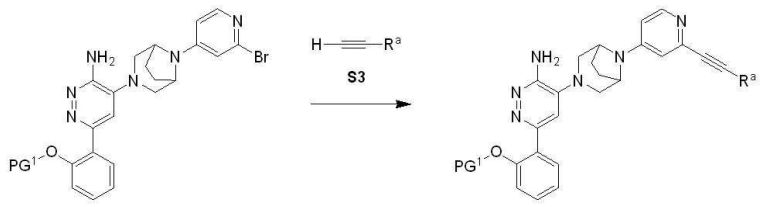


[1821] S1 I-F

[1822] **반응식 A-1**

[1823] 일부 구현예에서, PG^1은 메톡시메틸 에테르이다. 일부 구현예에서, 반응식 A-1의 탈보호 단계는 산을 사용한 처리를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 산은 염산을 포함한다. 일부 구현예에서, R^a는 보호기를 또한 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, R^a에 포함된 보호기는 PG^1과 상이하다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 추가의 탈보호 단계를 포함하여 R^a에 포함된 보호기를 제거한다.

[1824] 일부 구현예에서, 화학식 S1의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-2에 따라 화학식 S2의 화합물을 화학식 S3의 화합물과 반응시켜 화학식 S1의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

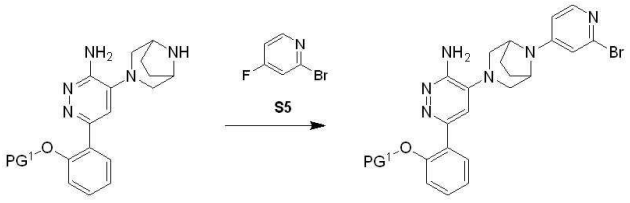


[1825] S2 S1

[1826] **반응식 A-2**

[1827] 일부 구현예에서, 공정은 Cu, Pd 및 염기의 첨가를 추가로 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Cu(I), Pd(II) 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 CuI, $Pd(PPh_3)_2Cl_2$ 및 K_2CO_3의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 반응 혼합물은 적어도 약 100 ℃로 가열된다.

[1828] 일부 구현예에서, 화학식 S2의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-3에 따라 화학식 S4의 화합물을 화학식 S5의 화합물과 반응시켜 화학식 S2의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

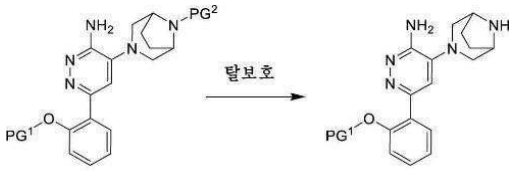


[1829] S4 S2

[1830] **반응식 A-3**

[1831] 일부 구현예에서, 공정은 유기 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서 공정은 N,N-디이소프로필에틸아민(DIEA)의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 반응 혼합물을 적어도 약 100 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 DMSO를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1832] 일부 구현예에서, 화학식 S4의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-4에 따라 화학식 S6의 화합물(여기서 PG^2는 보호기)을 반응시켜 화학식 S4의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

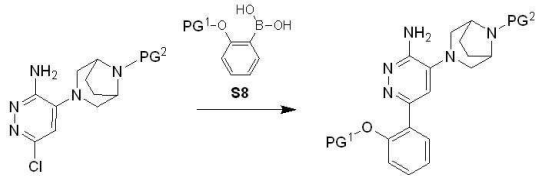


[1833] S6 S4

[1834] **반응식 A-4**

[1835] 일부 구현예에서, PG^2는 벤질옥시카르보닐이다. 일부 구현예에서, 반응식 A-4의 탈보호 단계는 Pd(II) 함유 화합물의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 탈보호 단계는 $Pd(OH)_2/C$를 사용한 처리를 포함한다. 일부 구현예에서, 탈보호 단계는 알코올 용매를 포함하는 용매에서 수행된다. 이러한 일부 구현예에서, 용매는 메탄올(MeOH)을 포함한다.

[1836] 일부 구현예에서, 화학식 S6의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-5에 따라 화학식 S7의 화합물을 화학식 S8의 화합물과 반응시켜 화학식 S6의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

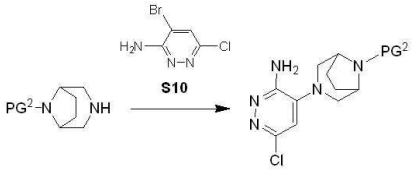


[1837] S7 S6

[1838] **반응식 A-5**

[1839] 일부 구현예에서, 반응식 A-5의 공정은 Pd의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Pd^0 화합물의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 $Pd(PPh_3)_4$의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 100 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 디옥산을 포함하는 용매에서 수행된다.

[1840] 일부 구현예에서, 화학식 S7의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 A-6에 따라 화학식 S9의 화합물을 화학식 S10의 화합물과 반응시켜 화학식 S7의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

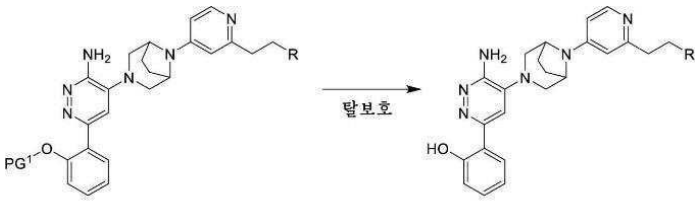


[1841]

[1842] **반응식 A-6**

[1843] 일부 구현예에서, 반응식 A-6의 공정은 유기 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 DIPEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 130 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 디메틸설폭사이드(DMSO)를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1844] 일부 구현예에서, 화학식 (I'), (I), (II') 또는 (II), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물(예를 들어 화학식 (I-B) 또는 화학식 (I-B2)의 화합물 포함)을 제조하는 공정으로서, 반응식 B-1에 따라 화학식 S13의 화합물(여기서 PG^1은 보호기)을 반응시켜 화학식 (I-B2)의 화합물을 생성하고 여기서 R은 R^g 또는 $-(CH_2)_{(n-2)}-R^g$일 수 있는 공정이 제공된다.

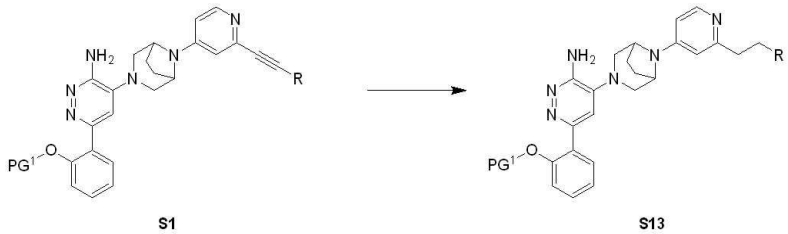


[1845]

[1846] **반응식 B-1**

[1847] 일부 구현예에서, PG^1은 메톡시메틸 에테르이다. 일부 구현예에서, 반응식 A-1의 탈보호 단계는 산을 사용한 처리를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 산은 염산을 포함한다.

[1848] 일부 구현예에서, 화학식 S13의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 B-2에 따라 화학식 S1의 화합물을 반응시켜 화학식 S13의 화합물을 생성하는 것을 포함하고 여기서 R는 R^g 또는 $-(CH_2)_{(n-2)}-R^g$일 수 있는 공정이 제공된다.



[1849]

[1850] **반응식 B-2**

[1851] 일부 구현예에서, 반응식 B-2의 공정은 수소화를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Pd/C 및 $SiEt_3H$의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 50 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 알코올 용매를 포함하는 용매에서 수행된다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 MeOH를 포함하는 용매에서 수행된다. 일부 구현예에서, 공정은 산의 존재하에 수행된다. 이러한 일부 구현예에서, 산은 HCl을 포함한다.

[1852] 일부 구현예에서, 화학식 (I'), (I), (II') 또는 (II), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물(예를 들어 화학식 (I-C)의 화합물 포함)을 제조하는 공정으로서, 반응식 C-1에 따라 화학식 S14의 화합물(여기서 PG^1은 보호기)을 반응시켜 화학식 (I-C)의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

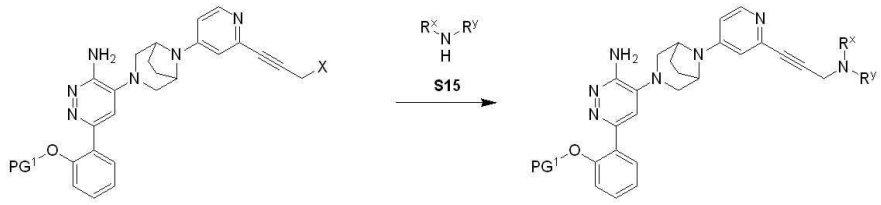


[1853]

[1854] **반응식 C-1**

[1855] 일부 구현예에서, PG^1은 메톡시메틸 에테르이다. 일부 구현예에서, 반응식 A-1의 탈보호 단계는 산을 사용한 처리를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 산은 염산을 포함한다. 이러한 다른 구현예에서, 산은 유기산을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 산은 HCl을 포함한다. 일부 구현예에서 반응은 알코올 용매를 포함하는 용매에서 수행된다. 이러한 일부 구현예에서, 반응은 MeOH를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1856] 일부 구현예에서, 화학식 S14의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 C-2에 따라 화학식 S15의 화합물(여기서 X는 이탈기)을 화학식 S16의 화합물과 반응시켜 화학식 S14의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

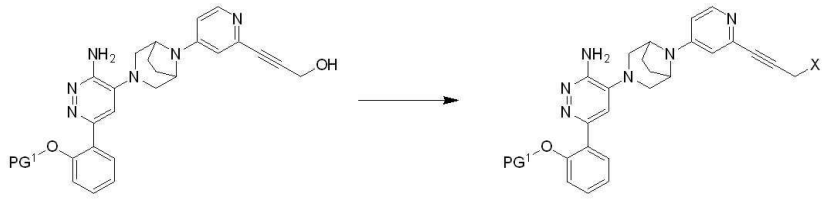


[1857]

[1858] **반응식 C-2**

[1859] 일부 구현예에서, 반응식 C-2의 공정은 유기 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 DIEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 DCM을 포함하는 용매에서 수행된다. 일부 구현예에서, X는 할로겐이다. 이러한 일부 구현예에서, X는 Br이다. 일부 구현예에서, X는 설포네이트 기이다. 일부 구현예에서, X는 메틸설포네이트(OMs)이다.

[1860] 일부 구현예에서, 화학식 S15의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 C-3에 따라 화학식 S17의 화합물을 반응시켜 화학식 S15의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

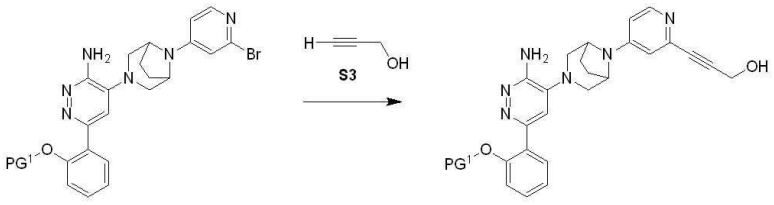


[1861]

[1862] **반응식 C-3**

[1863] 일부 구현예에서, X는 할로겐이다. 이러한 일부 구현예에서, X는 Br이다. 일부 구현예에서, X는 OMs이다. 일부 구현예에서, 반응식 C-3의 공정은 CBr_4 및 PS-PPh_3의 첨가를 포함한다. 다른 구현예에서, 공정은 메탄설포닐 클로라이드(MsCl)의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 DCM을 포함하는 용매에서 수행된다.

[1864] 일부 구현예에서, 화학식 S17의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 C-4에 따라 화학식 S2의 화합물을 화학식 S18의 화합물과 반응시켜 화학식 S17의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

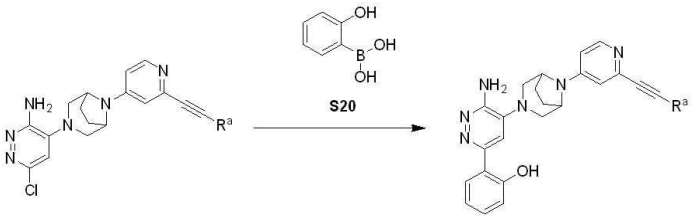


[1865]

[1866] **반응식 C-4**

[1867] 일부 구현예에서, 공정은 Cu, Pd 및 염기의 첨가를 추가로 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Cu(I), Pd^0 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 CuI, $Pd(PPh_3)_4$, PPh_3 및 TEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 반응 혼합물은 적어도 약 80 ℃로 가열된다. 일부 구현예에서, 반응은 DMF를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1868] 일부 구현예에서, 화학식 (I'), (I), (II') 또는 (II), 또는 이의 임의의 적용 가능한 하위 화학식의 화합물(예를 들어 화학식 (I-A)의 화합물 포함)을 제조하는 공정으로서, 반응식 D-1에 따라 화학식 S19의 화합물을 화학식 S20의 화합물과 반응시켜 화학식 (I-D)의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

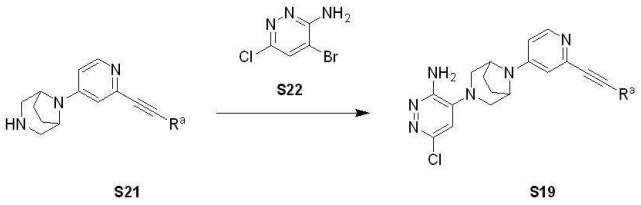


[1869]

[1870] **반응식 D-1**

[1871] 일부 구현예에서, 공정은 Pd 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Pd^0 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 $Pd(PPh_3)_4$ 및 K_2CO_3의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 90 ℃로 가열하는 것을 포함한다.

[1872] 일부 구현예에서, 화학식 S19의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 D-2에 따라 화학식 S21의 화합물을 화학식 S22의 화합물과 반응시켜 화학식 S19의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

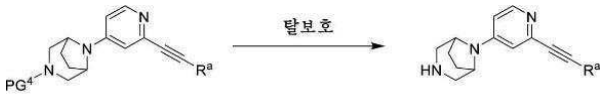


[1873]

[1874] **반응식 D-2**

[1875] 일부 구현예에서, 공정은 유기 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 DIEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 130 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 DMSO를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1876] 일부 구현예에서, 화학식 S21의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 D-3에 따라 화학식 S23의 화합물을 반응시켜 화학식 S21의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

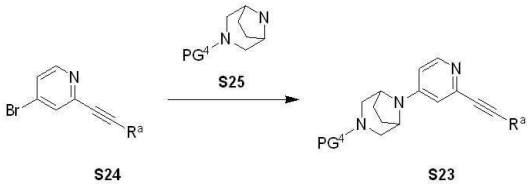


[1877]

[1878] **반응식 D-3**

[1879] 일부 구현예에서, 공정은 유기 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 TEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 반응은 냉각을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 반응은 약 0 ℃로 냉각하는 것을 포함한다.

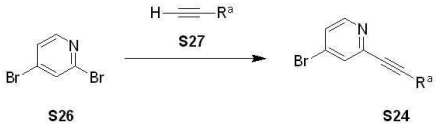
[1880] 일부 구현예에서, 화학식 S23의 화합물을 제조하는 공정으로서, 반응식 D-4에 따라 화학식 S24의 화합물을 화학식 S25의 화합물과 반응시켜 화학식 S23의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

[1881] 

[1882] **반응식 D-4**

[1883] 일부 구현예에서, 공정은 Pd 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Ruphos Pd G3 및 Cs_2CO_3의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 가열을 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 적어도 약 110 ℃로 가열하는 것을 포함한다. 일부 구현예에서, 공정은 톨루엔을 포함하는 용매에서 수행된다.

[1884] 일부 구현예에서, 화학식 S24의 화합물(예를 들어 화학식 (I-D)의 화합물 포함)을 제조하는 공정으로서, 반응식 D-5에 따라 화학식 S26의 화합물을 화학식 S27의 화합물과 반응시켜 화학식 S24의 화합물을 생성하는 것을 포함하는 공정이 제공된다.

[1885] 

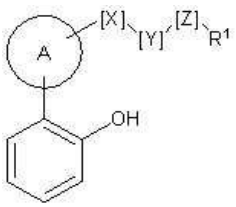
[1886] **반응식 D-5**

[1887] 일부 구현예에서, 공정은 Pd, Cu 및 염기의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Pd, Cu 및 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 Pd^0, Cu(I) 및 3차 아민의 첨가를 포함한다. 이러한 일부 구현예에서, 공정은 $Pd(PPh_3)$, CuI, PPh_3 및 TEA의 첨가를 포함한다. 일부 구현예에서, 반응은 DMF를 포함하는 용매에서 수행된다.

[1888] VII. 열거된 구현예

[1889] **열거된 구현예 (A)**

[1890] 구현예 A1 화학식 (I)의 화합물:

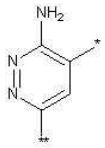
[1891] 

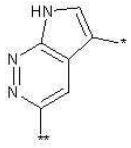
(I),

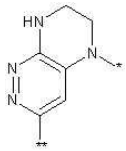
[1892] 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염이고, 여기서:

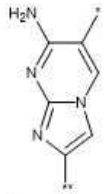
[1893] 

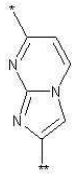
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

[1894] (a)  ;

[1895] (b)  ;

[1896] (c)  ;

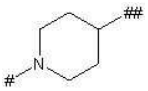
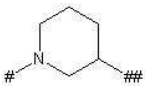
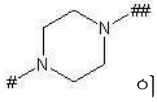
[1897] (d)  ; 및

[1898] (e)  ,

[1899] 여기서, (a)-(e)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[1900] 여기서:

[1901] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1902] 단,  가 (a)인 경우, [X]는  ,  또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

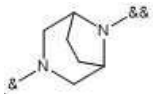
[1903] [Y]는 부재하고, 그리고

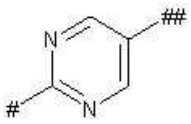
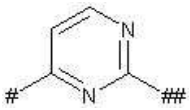
[1904] [Z]는 부재하고; 또는

[1905] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[1906] [Y]는 부재하고, 그리고

[1907] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1908] 단,  가 (a)이고 [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에

대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는 이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; 또는

[1909] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1910] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[1911] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; 또는

[1912] (iv) [X]는 부재하고,

[1913] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[1914] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1915] 단 는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[1916] (v) [X]는 부재하고,

[1917] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[1918] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1919] 단 는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[1920] (vi) [X]는 부재하고,

[1921] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[1922] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[1923] 단 는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 그리고

[1924] R^1은:

[1925] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[1926] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[1927] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[1928] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[1929] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[1930] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[1931] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[1932] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[1933] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[1934] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[1935] (b) -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[1936] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[1937] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고;

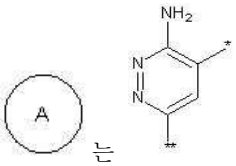
[1938] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, -N(R^x)(R^y) 또는 -C(O)-N(R^x)(R^y)이고; 그리고

[1939] -C(O)N(R^x)(R^y) 및 -N(R^x)(R^y)의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, -C(O)-$(CH_2)_p$-N(R^p)(R^q), 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

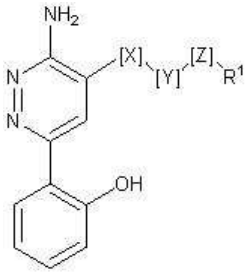
[1940] *p*는 1-6의 정수이고,

[1941] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[1942] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

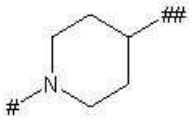
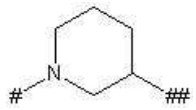
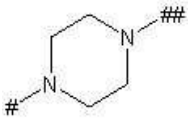
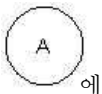
[1943] 구현예 A2 구현예 A1에 있어서, 

는 이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-A)의 화합물:

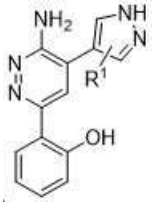
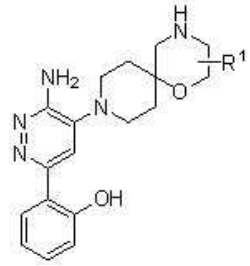
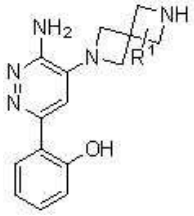
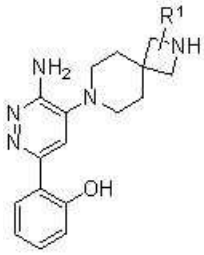
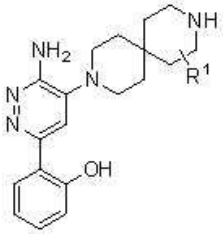
[1944] 

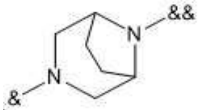
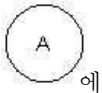
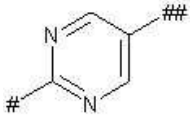
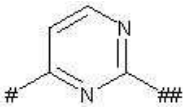
(I-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

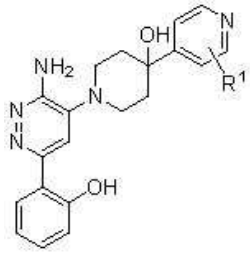
[1945] 구현예 A3 구현예 A2에 있어서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단 [X]는

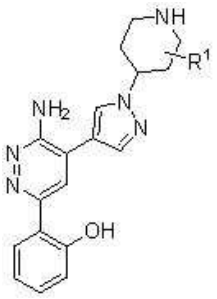
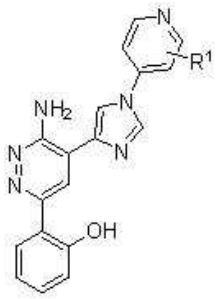





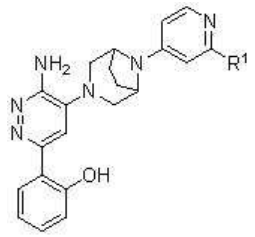
이 아니고, 여기서 #는 에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; [Y]는 부재하고; [Z]는 부재하는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1946] 구현예 A4 구현예 A3에 있어서, 화합물은 , , , , , 및 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1947] 구현예 A5 구현예 A2에 있어서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고; [Y]는 부재하고; [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 단, [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는  이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1948] 구현예 A6 구현예 A5에 있어서, 화합물은 , ,

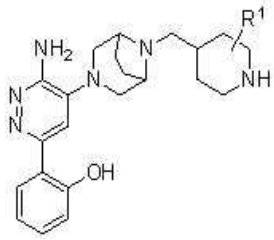


및 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.



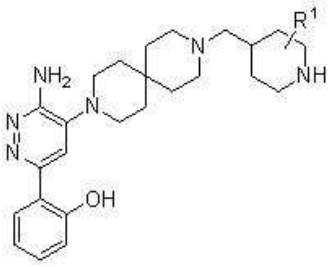
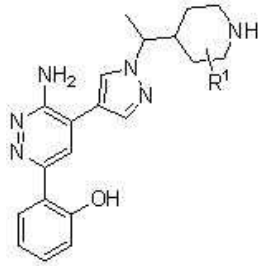
[1949] 구현예 A7 구현예 A6에 있어서, 화합물은 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1950] 구현예 A8 구현예 A7에 있어서, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염은 표 1의 화합물 1 내지 34로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

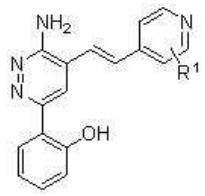
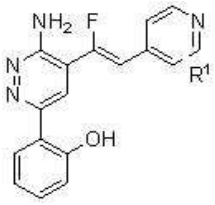
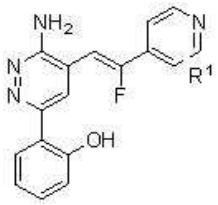
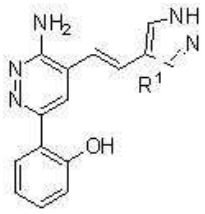
[1951] 구현예 A9 구현예 A2에 있어서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.



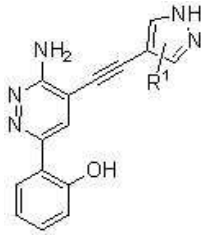
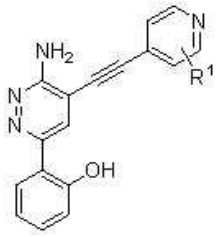
[1952] 구현예 A10 구현예 A9에 있어서, 화합물은 ,



및 , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

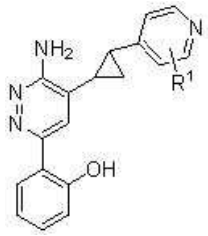
[1953] 구현예 A11 구현예 A2에 있어서, [X]는 부재하고, [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

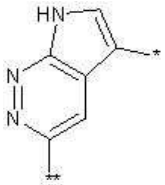
[1954] 구현예 A12 구현예 A11에 있어서, 화합물은  ,  ,  및  , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

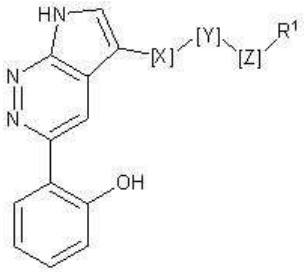
[1955] 구현예 A13 구현예 A2에 있어서, [X]는 부재하고, [Y]는 에티닐렌이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

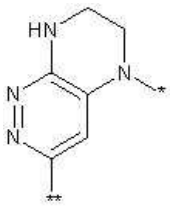
[1956] 구현예 A14 구현예 A13에 있어서, 화합물은  및  , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

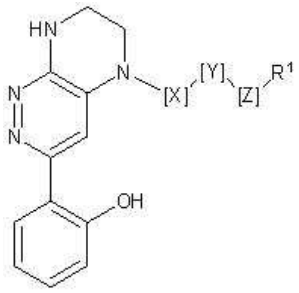
[1957] 구현예 A15 구현예 A2에 있어서, [X]는 부재하고, [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, [Z]는 5-20 원 헤테로아릴인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

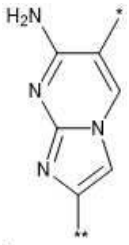
[1958] 구현예 A16 구현예 A15에 있어서, 화합물은  , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

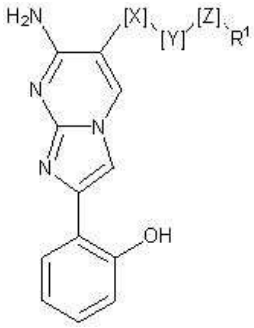
[1959] 구현예 A17 구현예 A1에 있어서,  는  이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-B)의 화합물:

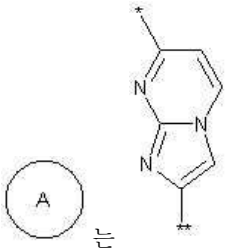
[1960]  (I-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

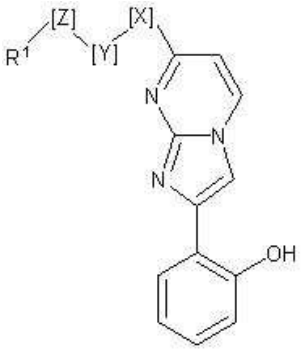
[1961] 구현예 A18 구현예 A1에 있어서, A 는  이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-C)의 화합물:

[1962]  (I-C), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1963] 구현예 A19 구현예 A1에 있어서, A 는  이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-D)의 화합물:

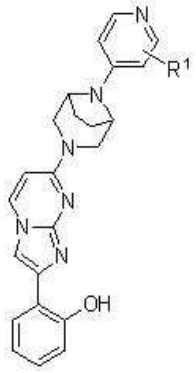
[1964]  (I-D), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1965] 구현예 A20 구현예 A1에 있어서,  는 이어서, 화학식 (I)의 화합물은 화학식 (I-E)의 화합물:



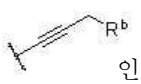
[1966] (I-E), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1967] 구현예 A21 구현예 A20에 있어서, [X]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; [Y]는 부재하고; [Z]는 5-20 원 헤테로아릴인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1968] 구현예 A22 구현예 A21에 있어서, 화합물은  , 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1969] 구현예 A23 구현예 A1-A22 중 어느 하나에 있어서, R^1은 $-C\equiv C-R^a$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1970] 구현예 A24 구현예 A23에 있어서, R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

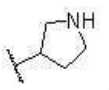
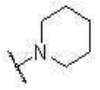
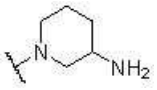
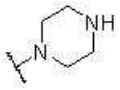
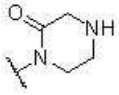
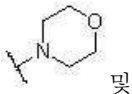
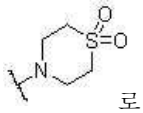
[1971] 구현예 A25 구현예 A23 또는 구현예 A24에 있어서, R^1은  인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1972] 구현예 A26 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성

질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

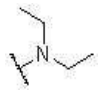
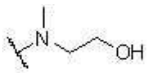
[1973] 구현예 A27 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1974] 구현예 A28 구현예 A26 또는 구현예 A27에 있어서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1975] 구현예 A29 구현예 A24-A28 중 어느 하나에 있어서, R^b는 , , , , , , , , ,  및  로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1976] 구현예 A30 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

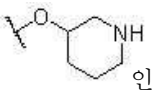
[1977] 구현예 A31 구현예 A30에 있어서, R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1978] 구현예 A32 구현예 A24, A25, A30 및 A31 중 어느 하나에 있어서, R^b는 ,  및  로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

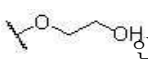
[1979] 구현예 A33 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 -OH인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1980] 구현예 A34 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 -O-(3-15 원 헤테로시클릴)인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1981] 구현예 A35 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 -O-(4-6 원 헤테로시클릴)인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1982] 구현예 A36 구현예 A24, A25, A34 및 35 중 어느 하나에 있어서, R^b는 인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

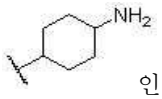
[1983] 구현예 A37 구현예 A24 또는 구현예 A25에 있어서, R^b는 C_{1-6}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1984] 구현예 A38 구현예 A24, A25 및 A37 중 어느 하나에 있어서, R^b는 인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1985] 구현예 A39 구현예 A23에 있어서, R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1986] 구현예 A40 구현예 A23에 있어서, R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

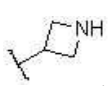
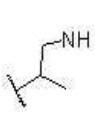
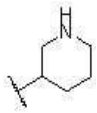
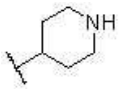
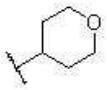
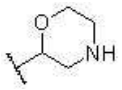
[1987] 구현예 A41 구현예 A40에 있어서, R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1988] 구현예 A42 구현예 A39-A41 중 어느 하나에 있어서, R^a는  인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1989] 구현예 A43 구현예 A23에 있어서, R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1990] 구현예 A44 구현예 A23에 있어서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

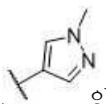
[1991] 구현예 A45 구현예 A44에 있어서, R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1992] 구현예 A46 구현예 A43-A45 중 어느 하나에 있어서, R^a는 , , , , , ,  및  로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1993] 구현예 A47 구현예 A23에 있어서, R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1994] 구현예 A48 구현예 A23에 있어서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1995] 구현예 A49 구현예 A48에 있어서, R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1996] 구현예 A50 구현예 A47-A49 중 어느 하나에 있어서, R^a는  인, 화합물 또는 이의 입체이성

질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1997] 구현예 A51 구현예 A1-A22 중 어느 하나에 있어서, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1998] 구현예 A52 구현예 A51에 있어서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[1999] 구현예 A53 구현예 A52에 있어서, R^x 및 R^y는 모두 H인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2000] 구현예 A54 구현예 A52에 있어서, R^x 및 R^y 중 하나는 H이고 R^x 및 R^y 중 다른 하나는 $-C(O)-CH_2-NH_2$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2001] 구현예 A55 구현예 A51-A54 중 어느 하나에 있어서, n은 3인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2002] 구현예 A56 구현예 A1에 있어서, 화합물은 표 1의 화합물 1 내지 34, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2003] 구현예 A57 (i) 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염; 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는, 약제학적 조성물.

[2004] 구현예 A58 구현예 A57에 있어서, 추가의 생물활성제를 더 포함하는, 약제학적 조성물.

[2005] 구현예 A59 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 포함하는 조성물, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법.

[2006] 구현예 A60 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 포함하는 조성물, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법.

[2007] 구현예 A61 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 포함하는 조성물, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법.

[2008] 구현예 A62 치료를 필요로 하는 인간의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 조성물을 투여하는 것을 포함하는, 방법.

[2009] 구현예 A63 구현예 A62에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 방법.

[2010] 구현예 A64 구현예 A63에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및

필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법.

[2011] 구현예 A65 치료를 필요로 하는 인간의 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 조성물을 투여하는 것을 포함하는, 방법.

[2012] 구현예 A66 구현예 A65에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 방법.

[2013] 구현예 A67 구현예 A66에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법.

[2014] 구현예 A68 인간에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2015] 구현예 A69 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2016] 구현예 A70 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2017] 구현예 A71 구현예 A68-A70 중 어느 하나에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법.

[2018] 구현예 A72 BRM에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물의 용도.

[2019] 구현예 A73 구현예 A72에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 용도.

[2020] 구현예 A74 구현예 A73에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2021] 구현예 A75 BRG1에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물의 용도.

[2022] 구체예 A76 구체예 A75에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 용도.

[2023] 구현예 A77 구현예 A76에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2024] 구현예 A78 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물의 용도.

[2025] 구현예 A79 구현예 A78에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2026] 구현예 A80 BRM에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A1-A56 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2027] 구체예 A81 구체예 A80에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2028] 구현예 A82 구현예 A81에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2029] 구현예 A83 BRG1에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A1-A56 중 어느 한 항의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2030] 구현예 A84 구현예 A83에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2031] 구현예 A85 구현예 A84에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두

부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 이루어진 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2032] 구현예 A86 암의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A1-A56 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2033] 구현예 A87 구현예 A86에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2034] 구현예 A88 BRM에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물.

[2035] 구현예 A89 구현예 A88에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 약제학적 조성물.

[2036] 구현예 A90 구현예 A89에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

[2037] 구현예 A91 BRG1에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물.

[2038] 구현예 A92 구현예 A91에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 약제학적 조성물.

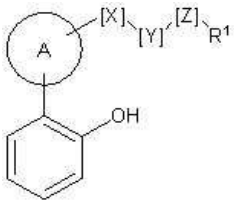
[2039] 구현예 A93 구현예 A92에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

[2040] 구현예 A94 암의 치료에 사용하기 위한, 구현예 A57 또는 구현예 A58의 약제학적 조성물.

[2041] 구현예 A95 구현예 A94에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종,

성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

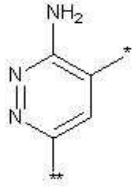
[2042] 구현예 A96 화학식 (I)의 화합물:



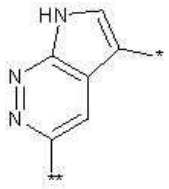
[2043] (I), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정, 여기서

[2044] 

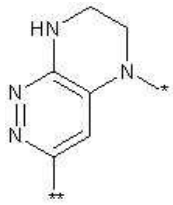
는 다음으로 구성된 군으로부터 선택되고:

[2045] (a) 

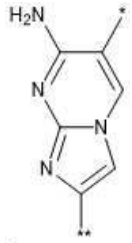
;

[2046] (b) 

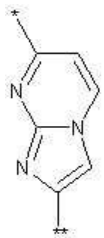
;

[2047] (c) 

;

[2048] (d) 

; 및

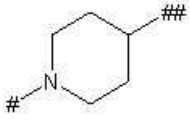
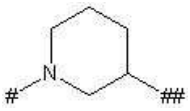
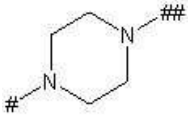
[2049] (e) 

,

[2050] 여기서, (a)-(e)에 대해, *는 [X]에 대한 부착점을 나타내거나, [X]가 부재하는 경우, *는 [Y]에 대한 부착점을 나타내고, **는 분자의 나머지에 대한 부착점을 나타내고;

[2051] 여기서:

[2052] (i) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2053] 단,  가 (a)인 경우, [X]는 ,  또는  이 아니고, 여기서 #는  에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고,

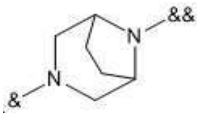
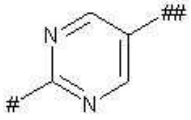
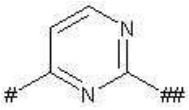
[2054] [Y]는 부재하고, 그리고

[2055] [Z]는 부재하고; 또는

[2056] (ii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 [X]의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 -OH 또는 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고,

[2057] [Y]는 부재하고, 그리고

[2058] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2059] 단,  가 (a)이고 [X]가  이고, 여기서 &는  에 대한 부착점을 나타내고 &&는 [Z]에 대한 부착점을 나타내는 경우, [Z]는  또는  이 아니고, 여기서 #는 [X]에 대한 부착점을 나타내고 ##는 R^1에 대한 부착점을 나타내고; 또는

[2060] (iii) [X]는 3-15 원 헤테로시클릴 또는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2061] [Y]는 메틸렌이고, 여기서 [Y]의 메틸렌은 하나 이상의 메틸 기로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2062] [Z]는 3-15 원 헤테로시클릴이고; 또는

[2063] (iv) [X]는 부재하고,

[2064] [Y]는 에테닐렌이고, 여기서 [Y]의 에테닐렌은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2065] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2066] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[2067] (v) [X]는 부재하고,

[2068] [Y]는 에티닐렌이고, 그리고

[2069] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2070] 단  는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 또는

[2071] (vi) [X]는 부재하고,

[2072] [Y]는 시클로프로필 또는 시클로부틸이고, 그리고

[2073] [Z]는 5-20 원 헤테로아릴이고,

[2074] 단 

는 (a), (b), (d) 또는 (e)이고; 그리고

[2075] R^1은:

[2076] (a) $-C\equiv C-R^a$이고, 여기서

[2077] (i) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[2078] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), $-C(O)-C_{1-6}$알콕시, $-C(O)-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-N(R^x)(R^y)$이고, 여기서

[2079] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[2080] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2081] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 $-C(O)-C_{1-6}$알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2082] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[2083] (ii) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2084] (iii) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2085] (iv) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$로 선택적으로 치환되고, 또는

[2086] (b) $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[2087] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[2088] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고;

[2089] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[2090] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[2091] *p*는 1-6의 정수이고,

[2092] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

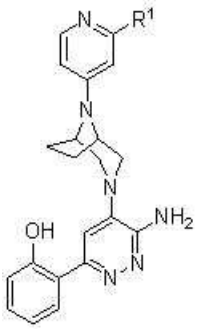
[2093] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[2094] 구현예 A97 구현예 A96의 공정에 의해 제조되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2095] 구현예 A98 열거된 구현예 (A)에서 전술한 바와 같은 발명.

[2096] **열거된 구현예 (B)**

[2097] 구현예 B1 화학식 (II)의 화합물:



[2098] (II), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 여기서:

[2099] (i) R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[2100] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[2101] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[2102] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[2103] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2104] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2105] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[2106] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2107] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2108] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2109] (ii) R^1은 -$(CH_2)_n$-R^g이고, 여기서

[2110] R^g는 -N(R^x)(R^y) 또는 -OH이고, 그리고

[2111] n은 1-6의 정수이고;

[2112] 여기서

[2113] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

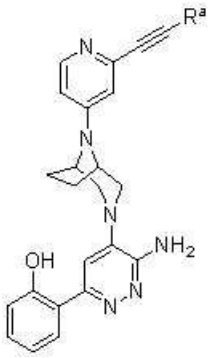
[2114] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서

[2115] p는 1-6의 정수이고,

[2116] R^p 및 R^q는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 그리고

[2117] R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

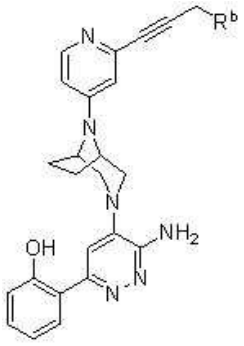
[2118] 구현예 B2 구현예 B1에 있어서, R^1은 $-C\equiv C-R^a$이어서, 화학식 (II)의 화합물은 화학식 (II-A)의 화합물:



[2119] (II-A), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2120] 구현예 B3 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2121] 구현예 B4 구현예 B1-B3 중 어느 하나에 있어서, 화학식 (II)의 화합물은 화학식 (II-A1)의 화합물:



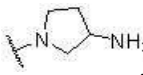
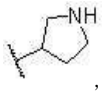
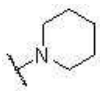
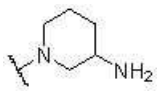
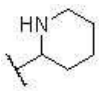
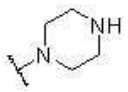
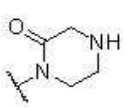
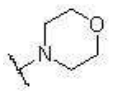
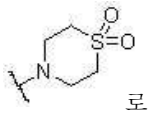
[2122] (II-A1), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2123] 구현예 B5 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는

이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

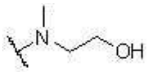
[2124] 구현예 B6 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^b의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2125] 구현예 B7 구현예 B5 또는 구현예 B6에 있어서, 각 R^c는 독립적으로 옥소 또는 $-NH_2$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2126] 구현예 B8 구현예 B3-B7 중 어느 하나에 있어서, R^b는 , , , , , , , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2127] 구현예 B9 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 $-N(R^x)(R^y)$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

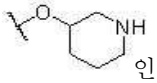
[2128] 구현예 B10 구현예 B9에 있어서, R^x 및 R^y는 각각 독립적으로 H 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2129] 구현예 B11 구현예 B3, B4, B9 및 B10 중 어느 하나에 있어서, R^b는 ,  및 로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2130] 구현예 B12 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 -OH인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2131] 구현예 B13 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 -O-(3-15 원 헤테로시클릴)인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2132] 구현예 B14 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 -O-(4-6 원 헤테로시클릴)인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2133] 구현예 B15 구현예 B3, B4, B13 및 B14 중 어느 하나에 있어서, R^b는 인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

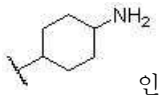
[2134] 구현예 B16 구현예 B3 또는 구현예 B4에 있어서, R^b는 C_{1-6}알콕시이고, 여기서 R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되는 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2135] 구현예 B17 구현예 B3, B4 및 B16 중 어느 하나에 있어서, R^b는 인 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2136] 구현예 B18 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2137] 구현예 B19 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 C_{4-6}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

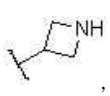
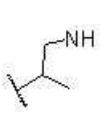
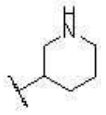
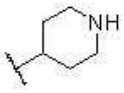
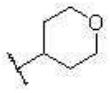
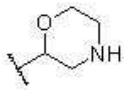
[2138] 구현예 B20 구현예 B19에 있어서, R^a의 C_{4-6}시클로알킬은 하나 이상의 $-NH_2$로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2139] 구현예 B21 구현예 B18-B20중 어느 하나에 있어서, R^a는  인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2140] 구현예 B22 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2141] 구현예 B23 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 4-6 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

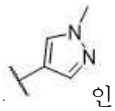
[2142] 구현예 B24 구현예 B23에 있어서, R^a의 4-6 원 헤테로시클릴은 치환되지 않는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2143] 구현예 B25 구현예 B22-B24 중 어느 하나에 있어서, R^a는 , , , , , ,  및 로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2144] 구현예 B26 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

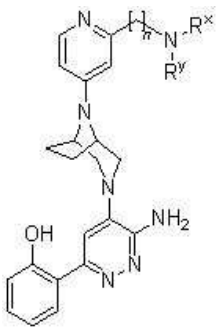
[2145] 구현예 B27 구현예 B1 또는 구현예 B2에 있어서, R^a는 5-6 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2146] 구현예 B28 구현예 B27에 있어서, R^a의 5-6 원 헤테로아릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2147] 구현예 B29 구현예 B26-B28 중 어느 하나에 있어서, R^a는  인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2148] 구현예 B30 구현예 B1에 있어서, R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서 n은 1-6의 정수이고 R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2149] 구현예 B31 구현예 B30에 있어서, R^g는 $-N(R^x)(R^y)$이어서, 화학식 (II)의 화합물은 화학식 (II-B)의 화합물:



[2150] (II-B), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2151] 구현예 B32 구현예 B31에 있어서, R^x 및 R^y는 모두 H인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2152] 구현예 B33 구현예 B31에 있어서, Rx 및 R^y 중 하나는 H이고 Rx 및 R^y 중 다른 하나는 $-C(O)-CH_2-NH_2$인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2153] 구현예 B34 구현예 B32 또는 구현예 B33에 있어서, n은 3인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2154] 구현예 B35 구현예 B1에 있어서, 화합물은 표 1의 화합물 1 내지 34, 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2155] 구현예 B36 (i) 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염; 및 (ii) 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 부형제를 포함하는, 약제학적 조성물.

[2156] 구현예 B37 구현예 B36, 추가의 생물활성제를 더 포함하는, 약제학적 조성물.

[2157] 구현예 B38 세포에서 BRM을 조절하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물에 노출하는 것을 포함하는 방법.

[2158] 구현예 B39 세포에서 BRM을 억제하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물에 노출하는 것을 포함하는 방법.

[2159] 구현예 B40 세포에서 BRM을 분해하는 방법으로서, 세포를 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나에 따른 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물에 노출시키는 것을 포함하는 방법.

[2160] 구현예 B41 치료를 필요로 하는 인간의 BRM 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2161] 구현예 B42 구현예 B41에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 방법.

[2162] 구현예 B43 구현예 B41에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법

[2163] 구현예 B44 치료를 필요로 하는 인간의 BRG1 매개 질환, 장애 또는 병태를 치료하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2164] 구현예 B45 구현예 B44에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 방법.

[2165] 구현예 B46 구현예 B45에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법.

[2166] 구현예 B47 인간에서 암 치료 효능을 증가시키는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2167] 구현예 B48 인간에서 세포독성제에 대한 암 내성의 발생을 예방 또는 지연하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2168] 구현예 B49 인간에서 암 요법에 대한 반응 기간을 연장하는 방법으로서, 인간에게 유효량의 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물을 투여하는 것을 포함하는 방법.

[2169] 구현예 B50 구현예 B47-B49 중 어느 하나에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 방법.

[2170] 구현예 B51 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물의 용도.

[2171] 구현예 B52 구현예 B51에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 용도.

[2172] 구현예 B53 구현예 B52에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2173] 구현예 B54 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물의 용도.

[2174] 구현예 B55 구현예 B54에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 용도.

[2175] 구현예 B56 구현예 B55에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2176] 구현예 B57 암의 치료에 사용하기 위한 약제의 제조에서, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물의 용도.

[2177] 구현예 B58 구현예 B50에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 용도.

[2178] 구현예 B59 BRM에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

[2179] 구현예 B60 구현예 B59에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2180] 구현예 B61 구현예 B60에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종,

신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2181] 구현예 B62 BRG1에 의해 매개되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

[2182] 구현예 B63 구현예 B62에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2183] 구현예 B64 구현예 B63에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2184] 구현예 B65 암의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B1-B35 중 어느 하나의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

[2185] 구현예 B66 구현예 B65에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2186] 구현예 B67 BRM에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

[2187] 구현예 B68 구현예 B67에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 약제학적 조성물.

[2188] 구현예 B69 구현예 B68에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL 및 필라델피아 염색체 양성 CML로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

[2189] 구현예 B70 BRR1에 의해 조절되는 질환, 장애 또는 병태의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

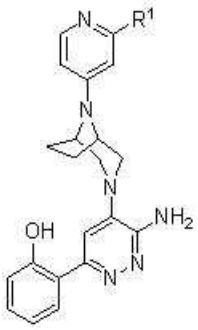
[2190] 구현예 B71 구현예 B70에 있어서, 질환, 장애 또는 병태는 암인, 약제학적 조성물.

[2191] 구현예 B72 구현예 B71에 있어서, 암은 비소세포 폐암, 결장직장암, 방광암, 원발부위 불명암, 신경교종, 유방암, 흑색종, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 췌장암, 간담도암, 연조직 육종, 난소암, 두부암, 경부암, 신세포 암종, 골암, 비호지킨 림프종, 소세포 폐암, 전립선암, 배아 종양, 생식세포 종양, 자궁경부암, 갑상선암, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

[2192] 구현예 B73 암의 치료에 사용하기 위한, 구현예 B36 또는 구현예 B37의 약제학적 조성물.

[2193] 구현예 B74 구현예 B73에 있어서, 암은 편평세포 암종, 기저세포 암종, 선암종, 간세포 암종, 신세포 암종, 방광암, 장암, 유방암, 자궁경부암, 결장암, 식도암, 두부암, 신장암, 간암, 폐암, 경부암, 난소암, 췌장암, 전립선암, 위암, 고환암, 갑상선암, 자궁암, 백혈병, 림프종, 버킷 림프종, 비호지킨 림프종, 흑색종, 골수증식성 질환, 육종, 유잉 육종, 혈관육종, 카포시 육종, 지방육종, 근육종, 말초 신경상피종, 활막 육종, 신경교종, 성상세포종, 희소돌기아교세포종, 뇌실막종, 교모세포종, 신경모세포종, 신경절신경종, 신경절교종, 수모세포종, 송과체 세포 종양, 수막종, 수막 육종, 신경섬유종, 신경초종, 성상세포종, 암육종, 호지킨병, 윌름스 종양, 기형암종, T계열 급성 림프구성 백혈병(T-ALL), T계열 림프구성 림프종(T-LL), 말초 T세포 림프종, 성인 T세포 백혈병, Pre-B ALL, Pre-B 림프종, 거대 B세포 림프종, B세포 ALL, 필라델피아 염색체 양성 ALL, 필라델피아 염색체 양성 CML, 비소세포 폐암, 결장직장암, 원발부위 불명암, 비흑색종 피부암, 자궁내막암, 식도위암, 간담도암, 연조직 육종, 골암, 소세포 폐암, 배아 종양, 생식세포 종양, 타액선암, 위장관 신경내분비 종양, 자궁 육종, 위장관 기질 종양, CNS 암, 흉선 종양, 부신피질 암종, 충수암, 소장암 및 음경암으로 구성된 군으로부터 선택되는, 약제학적 조성물.

[2194] 구현예 B75 화학식 (II)의 화합물:



[2195] (II), 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하는 공정, 여기서:

[2196] (i) R^1은 -C≡C-R^a이고, 여기서

[2197] (a) R^a는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^a의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 R^b로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^b는 독립적으로 3-15 원 헤테로시클릴, -O-(3-15 원 헤테로시클릴), C_{1-6}알콕시, -OH, -CN, 할로 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[2198] R^b의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^c로 선택적으로 치환되고, 여기서 각 R^c는 독립적으로 -OH, -CN, 할로, 옥소, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, C_{3-10}시클로알킬, 3-15 원 헤테로시클릴, 5-20 원 헤테로아릴, -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴), -C(O)-C_{1-6}알콕시, -C(O)-N(R^x)(R^y) 또는 -N(R^x)(R^y)이고, 여기서

[2199] R^c의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알콕시 또는 3-15 원 헤테로시클릴로 선택적으로 치환되고,

[2200] R^c의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 할로로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2201] R^c의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 C_{1-6}알킬 또는 -C(O)-C_{1-6}알킬로 선택적으로 치환되고, 그리고

[2202] R^b의 C_{1-6}알콕시는 하나 이상의 -OH로 선택적으로 치환되고, 또는

[2203] (b) R^a는 C_{3-10}시클로알킬이고, 여기서 R^a의 C_{3-10}시클로알킬은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2204] (c) R^a는 3-15 원 헤테로시클릴이고, 여기서 R^a의 3-15 원 헤테로시클릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2205] (d) R^a는 5-20 원 헤테로아릴이고, 여기서 R^a의 5-20 원 헤테로아릴은 하나 이상의 R^z로 선택적으로 치환되고, 또는

[2206] (ii) R^1은 $-(CH_2)_n-R^g$이고, 여기서

[2207] *n*은 1-6의 정수이고, 그리고

[2208] R^g는 $-N(R^x)(R^y)$ 또는 -OH이고,

[2209] 여기서

[2210] R^z는, 독립적으로 각 경우에, -OH, -CN, 할로, C_{1-6}알킬, C_{1-6}알콕시, $-N(R^x)(R^y)$ 또는 $-C(O)-N(R^x)(R^y)$이고; 그리고

[2211] $-C(O)N(R^x)(R^y)$ 및 $-N(R^x)(R^y)$의 R^x 및 R^y는, 서로 독립적으로 및 각 경우에 독립적으로, H, $-C(O)-(CH_2)_p-N(R^p)(R^q)$, 5-20 원 헤테로아릴 또는 C_{1-6}알킬이고, 여기서 R^x 또는 R^y의 C_{1-6}알킬은 하나 이상의 -OH, 3-15 원 헤테로시클릴 또는 -C(O)-(3-15 원 헤테로시클릴)로 선택적으로 치환된다.

[2212] 구현예 B76 구현예 B75의 공정에 의해 제조되는, 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염.

[2213] 구현예 B77 열거된 구현예 (B)에서 전술한 바와 같은 발명.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[2214] **실시예**

[2215] 다음 실시예는 제한이 아니라 예시를 위해 제공된다.

[2216] 약어

[2217] Ac - 아세틸

[2218] ACN - 아세토니트릴

[2219] ATP - 아데노신 트리포스페이트

[2220] Boc - tert-부톡시카르보닐

[2221] Cbz - 벤질옥시카르보닐

[2222] DCM - 디클로로메탄

[2223] DIEA/DIPEA - N,N-디이소프로필에틸아민

[2224] DMF - 디메틸포름아미드

[2225] DMSO - 디메틸설폭사이드

[2226] Et - 에틸

[2227] Et_3N - 트리에틸아민

[2228] EtOAc - 에틸 아세테이트

[2229] EtOH - 에탄올

[2230] FBS - 소 태아 혈청

[2231] HPLC - 고성능 액체 크로마토그래피

[2232] LCMS - 액체 크로마토그래피 질량 분석법

[2233] Me - 메틸

[2234] MeOH - 메탄올

[2235] MOM - 메톡시메틸

[2236] NMR - 핵자기 공명

[2237] Pd/C - 탄소 담지 팔라듐

[2238] Ph - 페닐

[2239] t-Bu - tert-부틸

[2240] t-BuONO - tert-부틸 니트라이트

[2241] TCEP - 트리스(2-카르복시에틸)포스핀

[2242] TEA - 트리에틸아민

[2243] TFA - 트리플루오로아세트산

[2244] TLC - 박층 크로마토그래피

[2245] UV - 자외선

[2246] 일반 반응식 및 실시예에 상세히 나타난 하기 합성 반응식은 본 개시의 화합물(또는 이의 임의의 구현예 또는 양태)가 합성될 수 있는 방법 중 일부를 단지 예시할 뿐이다. 이들 합성 반응식에 대한 다양한 수정이 이루어질 수 있으며, 본 출원에 포함된 개시 내용을 참조한 당업자에게 제시될 수 있을 것이다.

[2247] 이들 화합물 제조에 사용되는 출발 물질 및 시약은 일반적으로 Aldrich Chemical Co.와 같은 상업적 공급업체로부터 입수 가능하거나, 각각 그 전체가 본원에 참조로 포함되는 *Fieser and Fieser's Reagents for Organic Synthesis*; Wiley & Sons: New York, 1991, Volumes 1-15; *Rodd's Chemistry of Carbon Compounds*, Elsevier Science Publishers, 1989, Volumes 1-5 and Supplementals; 및 *Organic Reactions*, Wiley & Sons: New York, 1991, Volumes 1-40과 같은 참고문헌에 제시된 절차에 따라 당업자에게 공지된 방법에 의해 제조된다.

[2248] 합성 반응식의 출발 물질 및 중간체는 원하는 경우 여과, 증류, 결정화, 크로마토그래피 등을 포함하지만 이에 제한되지 않는 통상적인 기술을 사용하여 분리 및 정제될 수 있다. 이러한 물질은 물리적 상수 및 스펙트럼 데이터를 포함하는 통상적인 수단을 사용하여 특징분석될 수 있다.

[2249] 달리 명시되지 않는 한, 본원에 기재된 반응은 바람직하게는 불활성 분위기하에 대기압에서 약 -78 ℃ 내지 약 150 ℃, 더욱 바람직하게는 약 0 ℃ 내지 약 125 ℃의 반응 온도 범위에서 수행된다.

[2250] 본 명세서에서 특정 예시적인 구현예가 설명되지만, 본 개시(또는 이의 구현예 또는 양태)의 화합물은 본 명세서에 일반적으로 설명된 방법 및/또는 당업자가 이용 가능한 방법에 따라 적절한 출발 물질을 사용하여 제조될 수 있다.

[2251] 중간체 및 최종 화합물은 플래시 크로마토그래피 및/또는 역상 분취용 HPLC(고성능 액체 크로마토그래피) 및/또는 초임계 유체 크로마토그래피 및/또는 분취용 박층 크로마토그래피(Prep TLC)에 의해 정제되었다.

[2252] 일반적인 LCMS 조건이 산성 및 염기성 조건하에 수행되었다. 산성 조건: 이동상: 1.5 mL/4 L 물 중 TFA(용매 A) 및 0.75 mL/4 L 아세토니트릴 중 TFA(용매 B), 0.6 mL/분 또는 0.8 ml/분의 유량으로 3.85 분에 걸쳐 용리 구배 0%-100% 또는 1%-100% 또는 10-100% (용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI. 염기성 조건: 이동상: 2 mL/4 L 물 중 $NH_3 \cdot H_2O$(용매 A) 및 아세토니

트릴(용매 B), 0.6 mL/분 또는 0.8 mL/분의 유량으로 3.40-3.90 분에 걸쳐 용리 구배 0%-100% 또는 5%-100% 또는 15-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2253] 특정 LCMS 조건 A: 이동상: 1.5mL/4L 물 중 TFA(용매 A) 및 0.75mL/4L 아세토니트릴 중 TFA(용매 B), 0.6ml/분의 유량으로 3.85 분에 걸쳐 용리 구배 0%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2254] 특정 LCMS 조건 B: 이동상: 1.5mL/4L 물 중 TFA(용매 A) 및 0.75mL/4L 아세토니트릴 중 TFA(용매 B), 0.8mL/min의 유량으로 3.85 분에 걸쳐 용리 구배 1%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2255] 특정 LCMS 조건 C: 이동상: 1.5mL/4L 물 중 TFA(용매 A) 및 0.75mL/4L 아세토니트릴 중 TFA(용매 B), 0.8mL/분의 유량으로 3.85 분에 걸쳐 용리 구배 10%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2256] 특정 LCMS 조건 D: 이동상 2mL/4L 물 중 $NH_3 \cdot H_2O$(용매 A) 및 아세토니트릴 (용매 B), 0.6mL/분의 유량으로 3.90 분에 걸쳐 용리 구배 0%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 30℃; MS 이온화: ESI.

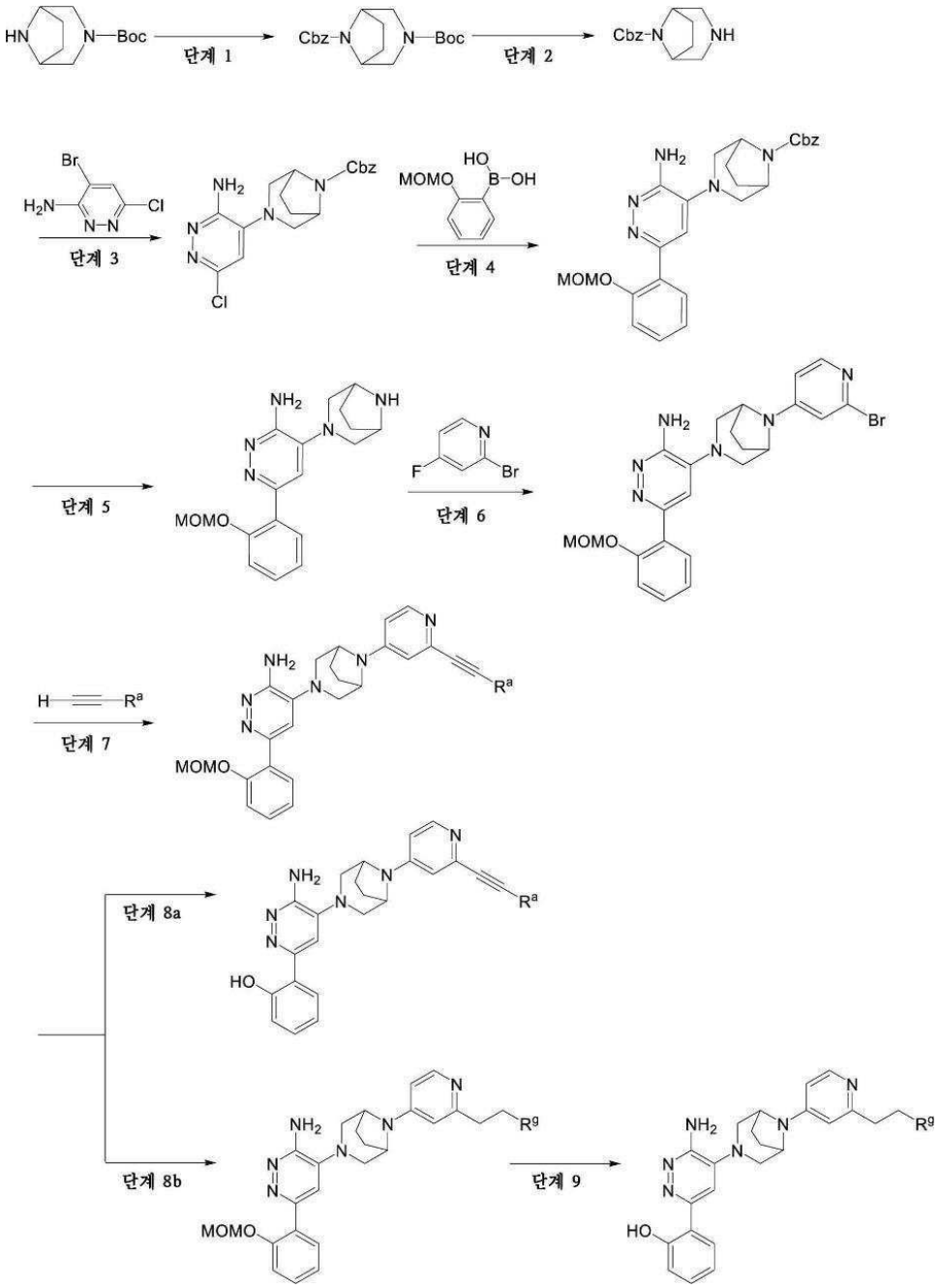
[2257] 특정 LCMS 조건 E: 이동상 2mL/4L 물 중 $NH_3 \cdot H_2O$(용매 A) 및 아세토니트릴 (용매 B), 0.8ml/분의 유량으로 3.60 분에 걸쳐 용리 구배 5%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2258] 특정 LCMS 조건 F: 이동상 2mL/4L 물 중 $NH_3 \cdot H_2O$(용매 A) 및 아세토니트릴 (용매 B), 0.8mL/분의 유량으로 3.40 분에 걸쳐 용리 구배 15%-100%(용매 B) 사용; 컬럼: Waters, Xbridge C18 50*2.1mm, 5μm; 파장: UV 220nm; 컬럼 온도: 40℃; MS 이온화: ESI.

[2259] 공기에 민감한 시약과 관련된 모든 반응은 불활성 분위기하에 수행되었다. 달리 언급되지 않는 한, 시약은 상업적 공급 업체로부터 받은 대로 사용되었다.

[2260] 하기 일반 반응식은 개시된 화합물, 중간체 및 이의 약제학적으로 허용되는 염을 제조하기 위해 사용된다. 개시된 화합물 및 중간체는 표준 유기 합성 기술과 시판되는 출발 물질 및 시약을 사용하여 제조될 수 있다. 개시된 화합물 및 중간체의 제조에 사용되는 합성 절차는 화합물 또는 중간체에 존재하는 특정 치환기에 따라 달라지며, 유기 합성에서 표준적인 다양한 보호, 탈보호 및 전환 단계가 요구될 수 있으나, 하기의 일반 반응식에는 예시되지 않을 수 있음이 이해될 것이다. 하기 일반 반응식 중 임의의 것에 나타난 임의의 단계는 원하는 중간체 또는 개시된 화합물을 달성하기 위해 화학적으로 실행가능한 임의의 조합 및 임의의 순서로 사용될 수 있음을 또한 이해해야 한다.

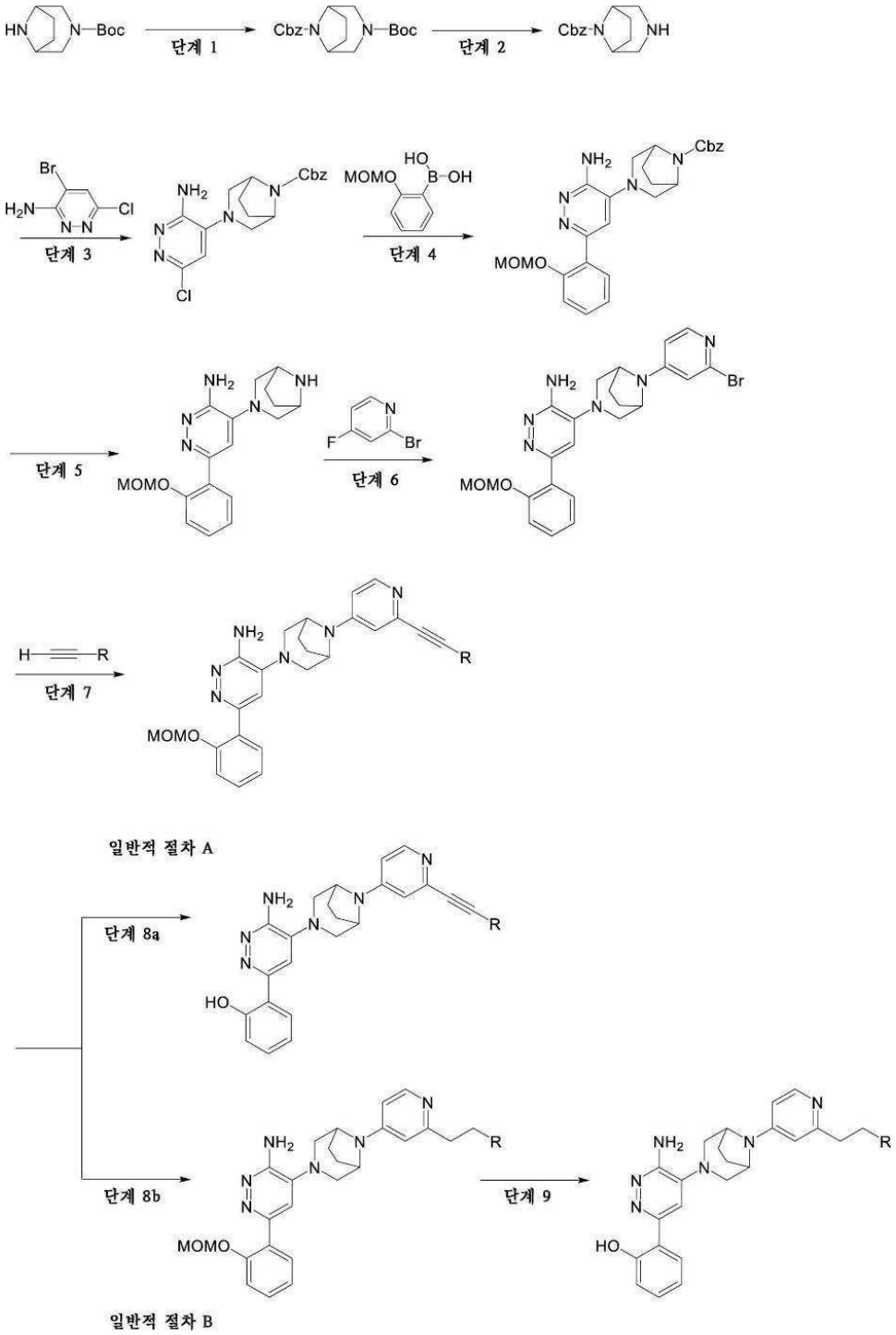
[2261] 반응식 1



[2262]

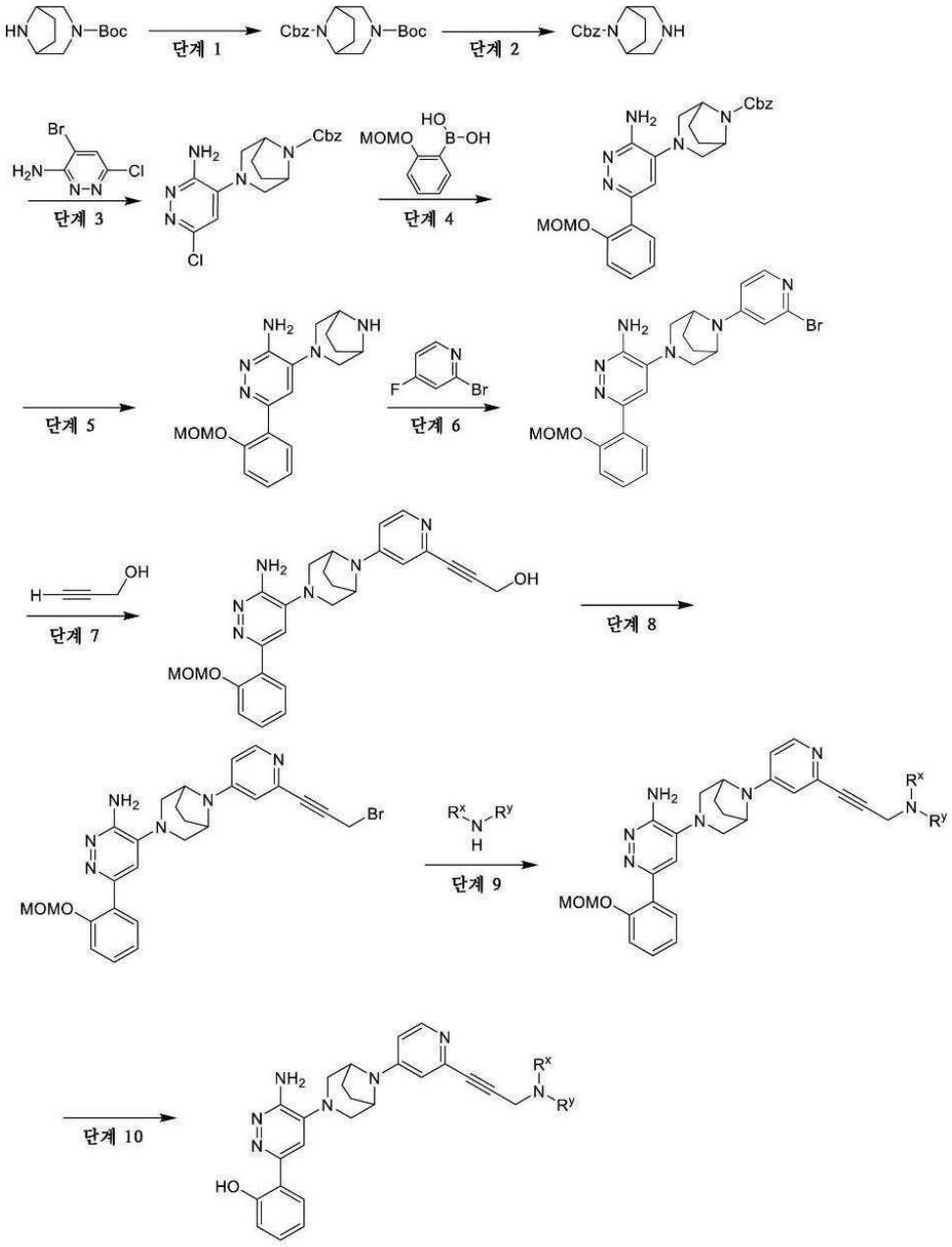
[2263] 반응식 1에서, R^a 및 R^g는 본원의 다른 곳에 기재된 바와 같은, 화학식 (I)의 화합물, 또는 이의 임의의 변형 또는 구현예, 예컨대 화학식 (I'), (I), (I-A), (I-A1), (I-A2), (I-A3), (I-A4), (I-A5), (I-A6), (I-A7), (I-A8), (I-A9), (I-B), (I-C), (I-D), (I-E), (I-E1), (I-F), (I-F1), (I-G), (I-H), (I-I), (I-J), (I-J1), (I-J2), (I-J3), (I-J4), (I-J5), (I-J6), (I-K), (I-K1), (I-K2), (I-K3), (I-K4), (I-K5), (I-K6), (IV'), (IV'-L), (IV'-L1), (IV'-L2), (IV'-L3), (IV'-L4), (IV'-M), (IV'-M1), (IV'-M2), (IV'-M3), (IV'-M4), (IV'-N), (IV'-N1), (IV'-N2), (IV'-N3), (IV'-N4), (II'), (II), (II-A), (II-A1), (II-B), (II-B1) 또는 (III')의 화합물 또는 이의 입체이성질체 또는 호변이성질체, 또는 이것들 중 임의의 것의 약제학적으로 허용되는 염에 대해 정의된 바와 같음에 유념하라.

[2264] 반응식 2. 일반적 합성 절차 A 및 B



[2265]

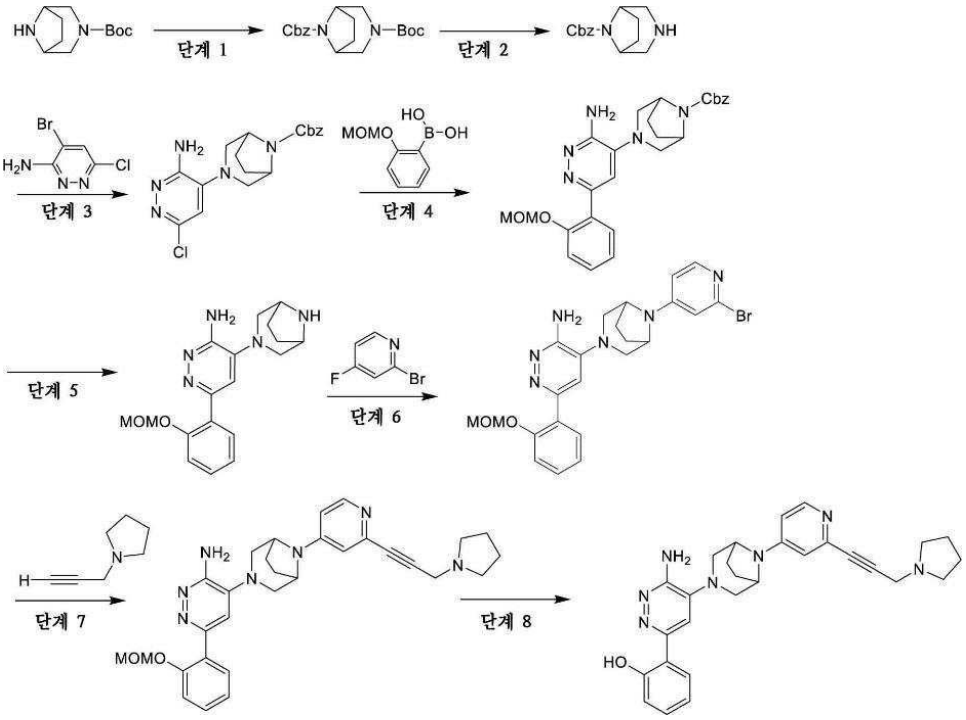
[2266] 반응식 3. 일반적 합성 절차 C



[2267] 일반적 절차 C

[2268] 실시예 1

[2269] 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 2)



[2270]

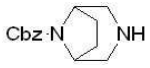
[2271] **단계 1: 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트**



[2272]

[2273] DCM(620 mL) 중 tert-부틸 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트(125 g, 589 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, TEA(179 g, 1.77 mol, 246 mL, 3.00 eq) 및 CbzCl(151 g, 883 mmol, 126 mL, 1.50 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 25℃에서 3 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. TLC(석유 에테르: 에틸 아세테이트 = 3: 1)는 새로운 스팟(R_f = 0.37)이 형성되었음을 보여주었다. 용액을 물 50.0 mL로 세척하고, EtOAc 150×3 mL로 추출하고, 염수 50.0 mL로 세척하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 3: 1)로 정제하여 표제 화합물(89.0 g, 257 mmol, 43.6% 수율)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.38-7.34 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.30 (s, 2H), 3.87-3.70 (m, 2H), 3.03 (d, J = 28.8 Hz, 2H), 1.95 (s, 2H), 1.88 (d, J = 16.8 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H).

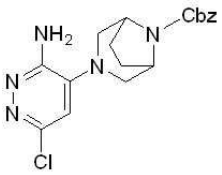
[2274] **단계 2: 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2275]

[2276] EtOAc(150 mL) 중 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트(89.0 g, 257 mmol, 1.00 eq)의 용액에 HCl/EtOAc(4 M, 321 mL, 5.00 eq)를 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. 용액을 감압하에 농축하여 대부분의 용매를 제거하고 여과하여 표제 화합물(59.0 g, 209 mmol, 81.2% 수율)을 미정제 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.32 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.44 (s, 2H), 3.20 (s, 4H), 2.32-2.27 (m, 2H), 2.16-2.00 (m, 2H).

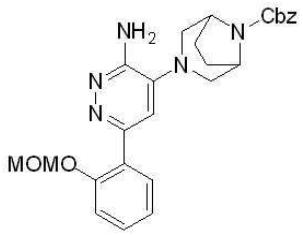
[2277] **단계 3: 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2278]

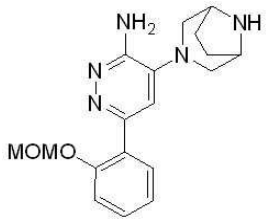
[2279] DMSO(410 mL) 중 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(59.0 g, 209 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, 4-브로모-6-클로로-피리다진-3-아민(45.7 g, 219 mmol, 1.05 eq), DIPEA(108 g, 835 mmol, 145 mL, 4.00 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 130℃에서 16 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 물 100 mL를 첨가하고, 동일한 생성물의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합하고, EtOAc 150 x 3 mL로 추출한 다음, 염수 20.0 mL로 세척하고, 감압하에 농축하여 표제 화합물(200 g, 미정제)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.27 (m, 5H), 6.70 (s, 1H), 5.17 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 4.46 (s, 2H), 3.25 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 2.89 (d, J = 33.6 Hz, 2H), 2.08-2.05 (m, 2H), 1.95-1.91 (m, 2H).

[2280] **단계 4: 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**

[2281] 

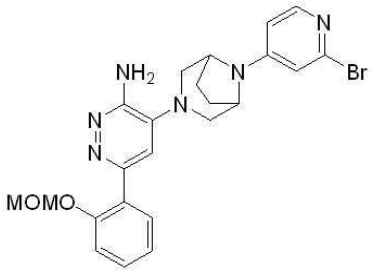
[2282] 디옥산(800 mL) 및 H_2O(150 mL) 중 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(100 g, 268 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에 (2-(메톡시메톡시)페닐)보론산(73.0 g, 401 mmol, 1.50 eq), $Pd(PPh_3)_4$(30.9 g, 26.8 mmol, 0.100 eq) 및 K_2CO_3(73.9 g, 534 mmol, 2.00 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 100℃에서 2 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 100 mL 물을 첨가하고 동일한 반응의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합했다. 혼합물을 EtOAc 200 mL × 3으로 추출하고, 유기물을 염수 100 mL로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 0: 1)로 정제하여 표제 화합물(182 g, 조합 수율: 71.7%)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.68 (d, J =1.2 Hz, 1H), 7.66-7.25 (m, 6H), 7.17 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.11-7.10 (m, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.39 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.17 (d, J = 10.0 Hz, 2H), 2.83 (d, J = 46.8 Hz, 2H), 1.92-2.15 (m, 4H).

[2283] **단계 5: 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

[2284] 

[2285] MeOH(1.27 L) 중 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(182 g, 383 mmol, 1.00 eq)의 용액에 $Pd(OH)_2$/C(53.8 g, 38.3 mmol, 10.0% 순도, 0.100 eq.)를 N_2 분위기하에 첨가했다. 현탁액을 탈기하고 H_2로 3 회 퍼징했다. 혼합물을 H_2하에 35℃에서 16 시간 동안 교반했다. 용액을 여과하고 여액을 감압하에 농축하여 표제 화합물(100 g, 미정제)을 갈색 고체로 얻었다.

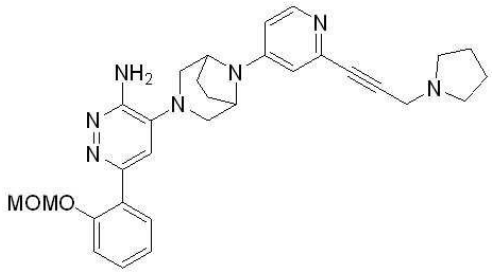
[2286] **단계 6: 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2287]

[2288] DMSO(96 mL) 중 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(16 g, 46.9 mmol)의 용액에 2-브로모-4-플루오로-피리딘(8.25 g, 46.9 mmol) 및 DIEA(60.6 g, 469 mmol, 81.6 mL)를 첨가한 다음 혼합물을 5 시간 동안 130℃에서 교반했다. 반응 혼합물을 H_2O 100 mL의 첨가에 의해 퀀칭하고, EtOAc 100 mL로 희석하고 EtOAc(100 mL × 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수 100 mL로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 미정제 생성물을 MeOH: DCM = 1: 20로 15℃에서 30 동안 트리터레이션한 다음, 여과하고 감압하에 농축하여 표제 화합물(17 g, 72.49% 수율)을 밝은 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.00 (d, *J*=5.96 Hz, 1 H), 7.72 (dd, *J*=7.63, 1.67 Hz, 1 H), 7.22 (s, 1 H) 7.31-7.38 (m, 1 H), 7.15 (d, *J*=7.89 Hz, 1 H), 7.10 (t, *J*=7.37 Hz, 1 H), 6.77 (d, *J*=2.15 Hz, 1 H), 6.54 (dd, *J*=5.96, 2.27 Hz, 1 H), 5.13 (s, 2 H), 5.10 (s, 2 H), 4.37 (s, 2 H), 3.36 (s, 3 H), 3.23 (d, *J*=10.13 Hz, 2 H), 3.02 (d, *J*=11.21 Hz, 2 H), 2.10-2.24 (m, 4 H).

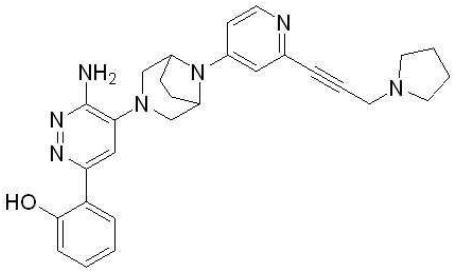
[2289] **단계 7: 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민**



[2290]

[2291] 질소하에, DMF(2 mL) 중 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(100 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq) 및 1-(프로프-2-인-1-일)피롤리딘(33 mg, 0.300 mmol, 1.5 eq)의 용액에 CuI(1.9 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq), $Pd(PPh_3)_2Cl_2$(7 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq) 및 K_2CO_3(83 mg, 0.600 mmol, 3.0 eq)를 첨가했다. 생성된 용액을 100 ℃에서 16 시간 동안 진탕했다. 반응 혼합물을 스피드 백으로 농축하고 잔류물을 prep-TLC로 정제하고 표제 화합물의 정량적 수율을 가정하며 계속했다.

[2292] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



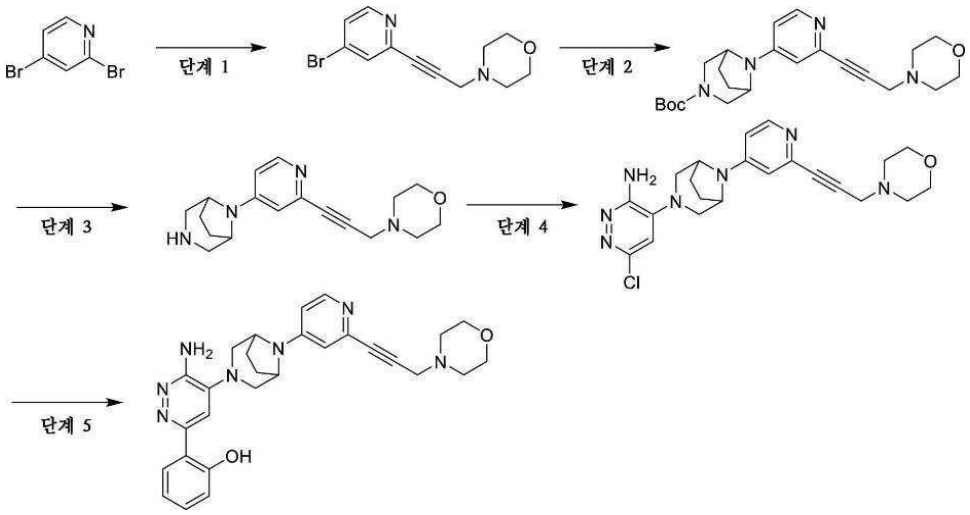
[2293]

[2294] HCl(MeOH 중 4 M, 2 mL) 중 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-(피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민(105 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq.)의 용액을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 혼합물을 증발시키고 1.5 mL의 MeOH로 희석했다. 이후 수성 $NH_3.H_2O$를 사용하여 pH를 7~8로 조정했다. 미정제 생성물을 prep-HPLC(® C18 150*25mm*5μm, 물(10mM 중탄산암모늄 및 0.05% 수산화암

모듐 v/v)-ACN, 36-61%)로 정제하여 표제 화합물(7.7 mg, 8% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.95 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 - 6.82 (m, 2H), 6.80 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (t, J = 3.4 Hz, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.26 (dd, J = 12.0, 2.3 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.62 (d, J = 6.0 Hz, 4H), 2.20 (q, J = 6.2, 5.7 Hz, 2H), 1.97 (dd, J = 8.0, 4.0 Hz, 2H), 1.79 - 1.68 (m, 4H). LCMS (ESI): *m/z* 482.3 $(M+H)^+$.

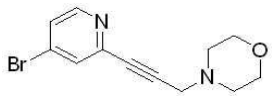
[2295] **실시예 2**

[2296] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 9)**



[2297]

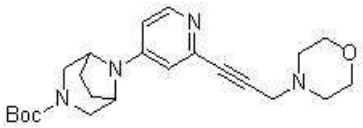
[2298] **단계 1: 4-(3-(4-브로모피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)모르폴린**



[2299]

[2300] DMF(60 mL) 중 4-프로프-2-이닐모르폴린 (2.6 g, 21.11 mmol)의 용액에 2,4-디브로모피리딘(5.0 g, 21.11 mmol), $Pd(PPh_3)_4$(3.6 g, 3.17 mmol), CuI(1.2 g, 6.33 mmol), PPh_3(1.6 g, 6.33 mmol) 및 Et_3N(5.88 mL, 42.21 mmol)을 26℃에서 첨가했다. 반응 용액을 30℃에서 16 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 이후 반응 혼합물을 EtOAc(100 mL)로 희석하고, 염수(30 mL × 3)로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고 농축했다. 잔류물을 실리카 겔상의 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르 중 0-30% EtOAc)로 정제하여 표제 화합물(2.4 g, 40%)을 황색 오일로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.36 (d, J = 5.2 Hz, 1 H), 7.59 (d, J = 1.6 Hz, 1 H), 7.40 (d, J = 5.2, 1.6 Hz, 1 H), 3.68 - 3.85 (m, 4 H), 3.56 (s, 2 H), 2.66 (d, J = 4.0 Hz, 4 H). LCMS (ESI): *m/z* 282.8 $(M+H)^+$.

[2301] **단계 2: *tert*-부틸 8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트**

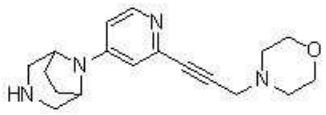


[2302]

[2303] 톨루엔(30 mL) 중 Ruphos Pd G3 (428 mg, 0.51 mmol)의 용액에 Cs_2CO_3(6.9 g, 21.34 mmol), *tert*-부틸 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트(1.8 g, 8.54 mmol), and 4-[3-(4-브로모-2-피리딜)프로프-2-이닐]모르폴린(2.4 g, 8.54 mmol)을 첨가하고, 생성된 혼합물을 110 ℃에서 16 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다.

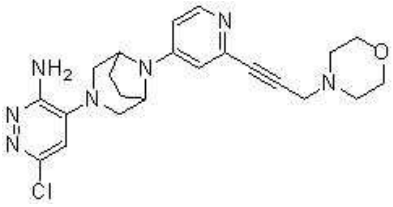
이후 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고, EtOAc(30 mL)로 희석하고 염수(15 mL × 2)로 세척했다. 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 농축했다. 잔류물을 실리카 겔 상의 플래시 크로마토그래피(DCM 중 0 - 10% MeOH)로 정제하여 표제 화합물(3 g, 85%)을 황색 오일로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.05 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 6.89 (d, J = 2.4 Hz, 1 H), 6.73 (d, J = 6.0, 2.4 Hz, 1 H), 4.40 (s, 2 H) 3.45 - 3.84 (m, 10 H), 2.50 (s, 4 H), 1.89 (d, J = 4.0 Hz, 2 H), 1.66 (d, J = 6.8 Hz, 2 H), 1.36 (s, 9 H). LCMS (ESI): m/z 413.2 $(M+H)^+$.

[2304] **단계 3: 4-(3-(4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)모르폴린**

[2305] 

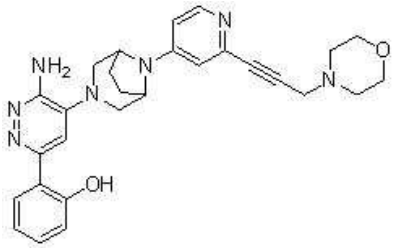
[2306] DCM(30 mL) 중 *tert*-부틸 8-[2-(3-모르폴리노프로프-1-이닐)-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트(3.0 g, 7.27 mmol)의 용액에 TFA(56.03 mL, 727.22 mmol)를 0 ℃에서 첨가했다. 25 ℃에서 6 시간 동안 교반한 후, 혼합물을 농축하고 잔류물을 EtOAc(30 mL)에 용해하고, 포화 Na_2CO_3를 첨가하여 pH를 ~ 7.5로 조정했다. 이후 혼합물을 에틸 아세테이트(50 mL × 3)로 추출했다. 조합된 유기상을 염수(25 mL × 2)로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 농축했다. 잔류물을 실리카 겔상의 플래시 크로마토그래피(DCM 중 0-10% MeOH)로 정제하여 표제 화합물(1.4 g, 62%)을 무색 오일로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.16 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 6.69 (d, J = 2.4 Hz, 1 H) , 6.45 (d, J = 6.0, 2.4 Hz, 1 H), 4.05 - 4.22 (m, 2 H), 3.70 - 3.78 (m, 4 H), 3.49 (s, 2 H), 3.09 (d, J = 11.6 Hz, 2 H), 2.58 - 2.73 (m, 6 H), 2.01 - 2.17 (m, 4 H). LCMS (ESI): m/z 313.0 $(M+H)^+$.

[2307] **단계 4: 6-클로로-4-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민**

[2308] 

[2309] DMSO(20 mL) 중 4-브로모-6-클로로-피리다진-3-아민(1.2 g, 5.83 mmol), DIEA(7.81 mL, 44.81 mmol) 및 4-[3-[4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)-2-피리딜]프로프-2-이닐]모르폴린(1.4 g, 4.48 mmol)의 혼합물을 130 ℃에서 N_2 분위기하에 16 시간 동안 교반했다. 이후 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고, EtOAc(50 mL)로 희석하고 염수(25 mL × 3)로 세척했다. 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 농축했다. 잔류물을 실리카 겔상의 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르 중 0 - 100% EtOAc)로 정제하여 표제 화합물(500 mg, 25%)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.22 (d, J = 6.4 Hz, 1 H), 6.57 - 6.86 (m, 3 H), 4.47 (s, 2 H), 3.81 (s, 4 H), 3.65 (s, 2 H), 3.31 (d, J = 11.6 Hz, 2 H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2 H), 2.76 (s, 4 H), 2.10 - 2.27 (m, 4 H). LCMS (ESI): m/z 440.1 $(M+H)^+$.

[2310] **단계 5: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-모르폴리노프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

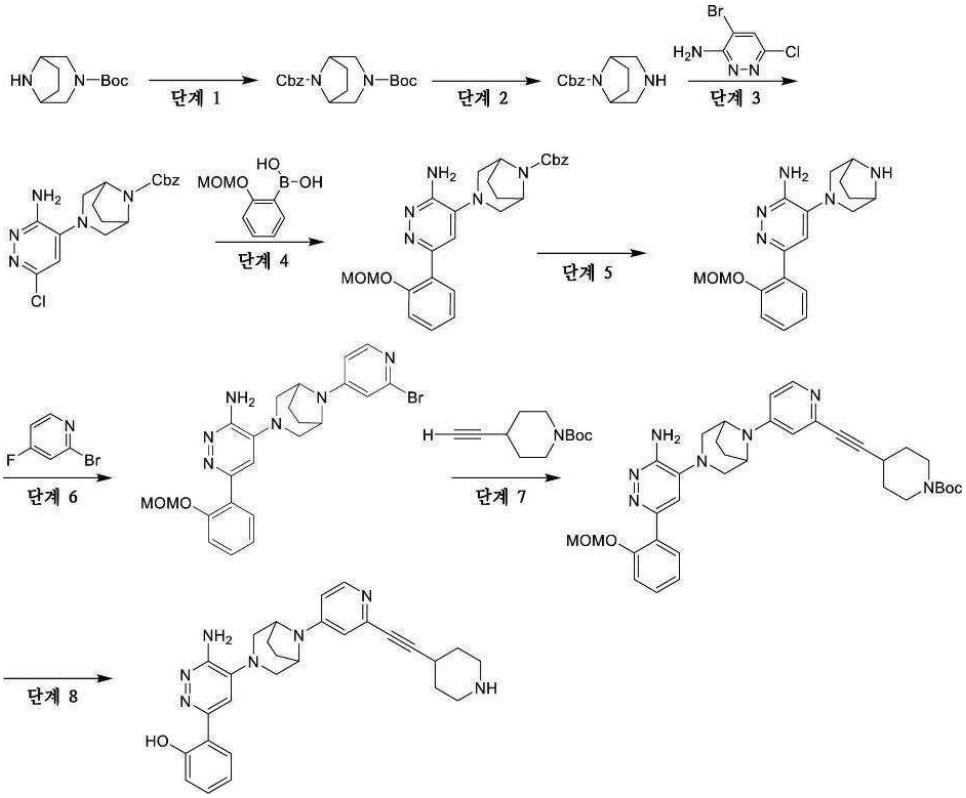


[2311]

[2312] 1,4-디옥산(1 mL) 및 물(0.20 mL) 중 6-클로로-4-[8-[2-(3-모르폴리노프로프-1-이닐)-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-아민(100.0 mg, 0.23 mmol)의 용액에 2-히드록시페닐보론산(156.76 mg, 1.14 mmol), $Pd(PPh_3)_4$(52.53 mg, 0.05 mmol) 및 K_2CO_3(94.25 mg, 0.68 mmol)을 26℃에서 첨가했다. 90 ℃에서 16 시간 동안 교반한 후, 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고, EtOAc(30 mL)로 희석하고 염수(15 mL × 2)로 세척했다. 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Phenomenex Synergi C18 150*30mm*4um, 물(0.05% HCl)-ACN, 10-40%)로 정제하여 표제 화합물(35 mg, 30%)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.33 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 7.49 - 7.61 (m, 3 H), 7.19 - 7.45 (m, 3 H), 6.94 - 7.16 (t, J = 7.2 Hz, 1 H), 4.99 (s, 1 H), 4.93 (s, 1 H), 4.35 (s, 4 H), 3.95 (s, 4 H), 3.62 (s, 2 H), 3.22 (s, 4 H), 2.25 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 2.02 (s, 2 H). LCMS (ESI): m/z 498.3 $(M+H)^+$.

[2313] **실시예 3**

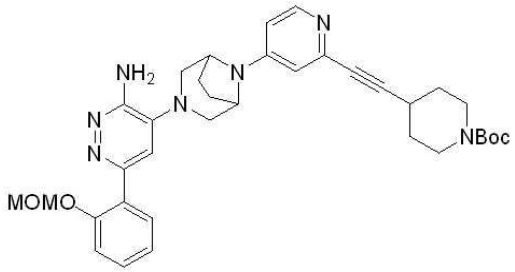
[2314] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-4-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 19)**



[2315]

[2316] **단계 1 내지 6:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 1 및 실시예 1에 기재된 것과 유사한 절차.

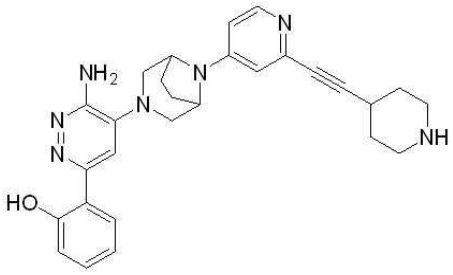
[2317] **단계 7: tert-부틸 4-((4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)에티닐)피페리딘-1-카르복실레이트**



[2318]

[2319] 질소하에, DMF(2 mL) 중 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(100 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq) 및 tert-부틸 4-에티닐피페리딘-1-카르복실레이트(63 mg, 0.300 mmol, 1.5 eq)의 용액에 CuI(1.9 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq), $Pd(PPh_3)_2Cl_2$(7 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq) 및 K_2CO_3(83 mg, 0.600 mmol, 3.0 eq)를 첨가했다. 생성된 용액을 100 ℃에서 16 시간 동안 진탕했다. 반응 혼합물을 스피드백으로 농축하고 잔류물을 prep-TLC로 정제하고 표제 화합물의 정량적 수율을 가정하며 계속했다.

[2320] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(피페리딘-4-일에티닐)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

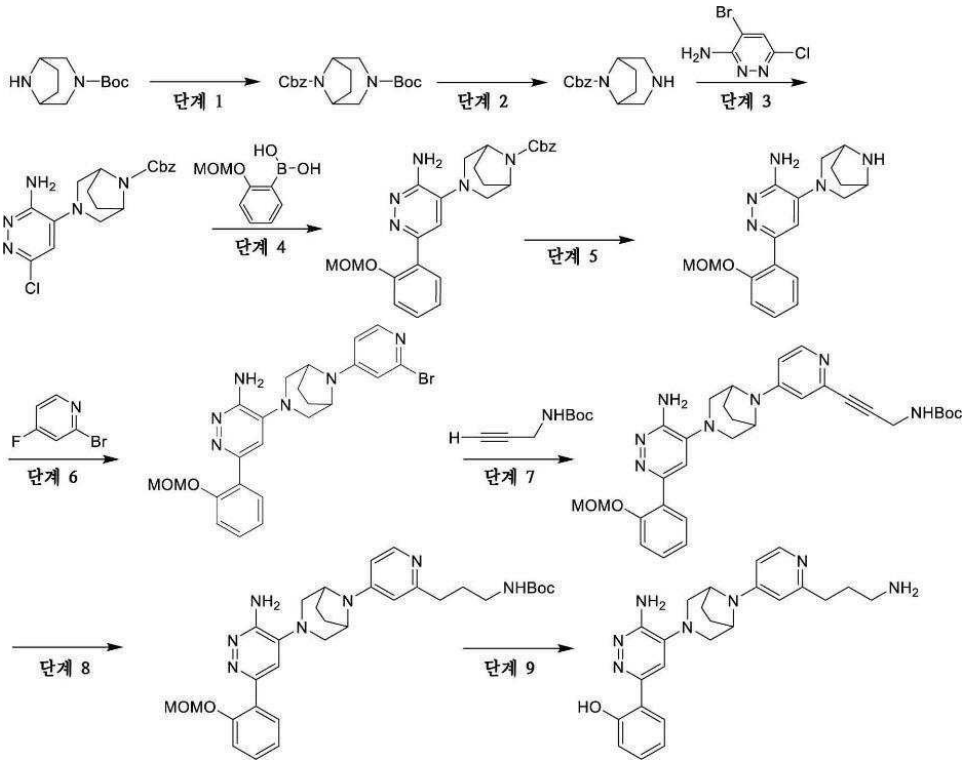


[2321]

[2322] HCl(MeOH 중 4 M, 2 mL) 중 tert-부틸 4-((4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)에티닐)피페리딘-1-카르복실레이트(125 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq.)의 용액을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 혼합물을 증발시키고 1.5 mL의 MeOH로 희석했다. 이후 수성 $NH_3.H_2O$를 사용하여 pH를 7~8로 조정했다. 미정제 생성물을 prep-HPLC(Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(10mM 중탄산암모늄 및 0.05% 수산화암모늄 v/v)-ACN, 42-67%)로 정제하여 표제 화합물(13 mg, 13% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.92 - 6.80 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.26 (dd, J = 11.9, 2.3 Hz, 2H), 3.04 - 2.91 (m, 4H), 2.78 - 2.67 (m, 1H), 2.62 (ddd, J = 12.5, 9.8, 2.9 Hz, 2H), 2.24 - 2.13 (m, 2H), 2.00 - 1.92 (m, 2H), 1.82 (dq, J = 12.4, 3.9 Hz, 2H), 1.60 - 1.46 (m, 2H). LCMS (ESI): *m/z* 482.3 $(M+H)^+$.

[2323] **실시예 4**

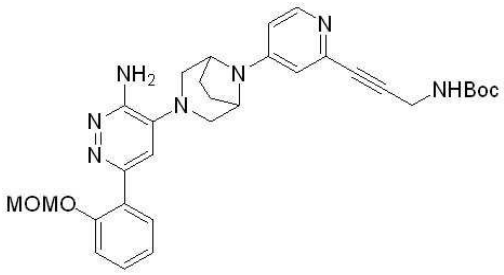
[2324] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로필)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀 (화합물 33)**



[2325]

[2326] **단계 1 내지 6:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 1 및 실시예 1에 기재된 것과 유사한 절차.

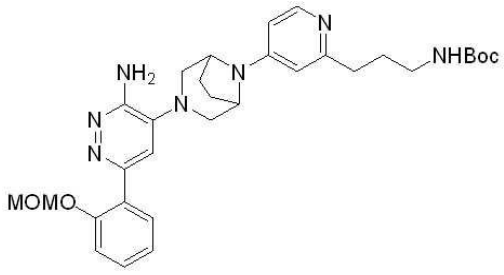
[2327] **단계 7: tert-부틸(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)카르바메이트**



[2328]

[2329] 질소하에, DMF(2 mL) 중 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(100 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq) and tert-부틸 프로프-2-인-1-일카르바메이트(47 mg, 0.300 mmol, 1.5 eq)의 용액에 CuI(1.9 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq), $Pd(PPh_3)_2Cl_2$(7 mg, 0.010 mmol, 0.030 eq) 및 K_2CO_3(83 mg, 0.600 mmol, 3.0 eq)를 첨가했다. 생성된 용액을 100 ℃에서 16 시간 동안 진탕했다. 반응 혼합물을 스피드백으로 농축하고 잔류물을 prep-TLC로 정제하고 표제 화합물의 정량적 수율을 가정하며 계속했다.

[2330] **단계 8: tert-부틸(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로필)카르바메이트**

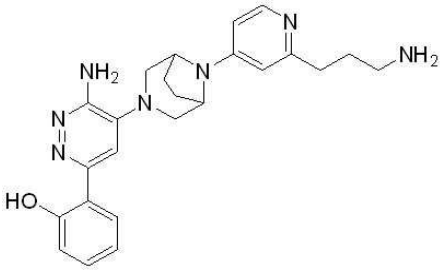


[2331]

[2332] MeOH(2 mL) 중 tert-부틸(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로

[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)카르바메이트(114 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq.)의 용액에 Pd/C(60.0 mg) 및 $SiEt_3H$(0.4 mL)를 첨가했다. 생성된 용액을 50 ℃에서 16 시간 동안 진탕했다. 혼합물을 여과하고 여액을 농축하여 미정제 표제 화합물을 얻었다.

[2333] **단계 9: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-아미노프로필)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

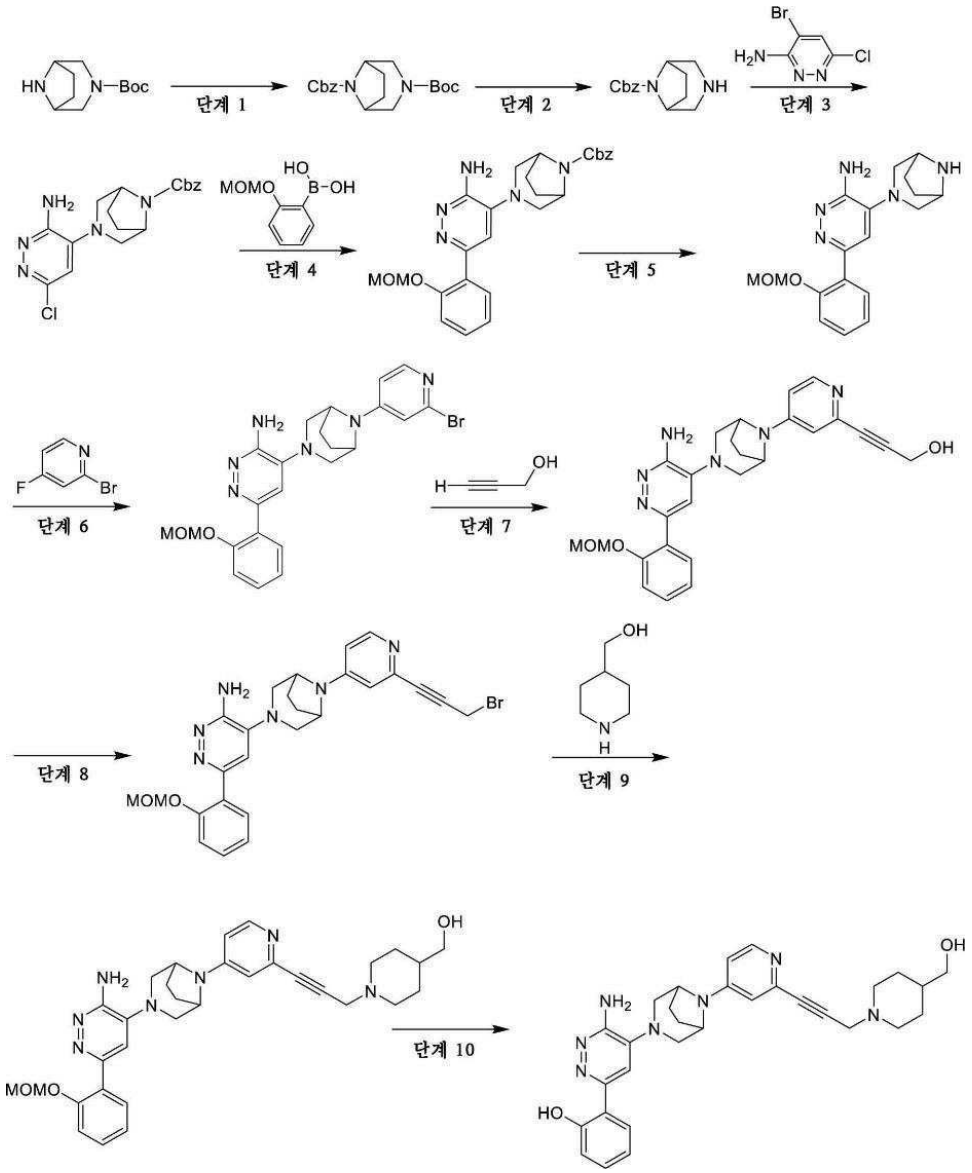


[2334]

[2335] HCl(MeOH 중 4 M, 2 mL) 중 tert-부틸(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로필)카르바메이트(115 mg, 0.200 mmol, 1.0 eq.)의 용액을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 혼합물을 증발시키고 1.5 mL의 MeOH로 희석했다. 이후 수성 $NH_3.H_2O$를 사용하여 pH를 7~8로 조정했다. 미정제 생성물을 prep-HPLC(Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(10mM 중탄산암모늄 및 0.05% 수산화암모늄 v/v)-ACN, 44-69%)로 정제하여 표제 화합물(11.7 mg, 14% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.06 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 6.65 (dd, J = 5.8, 2.4 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.36 - 3.23 (m, 2H), 3.02 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.58 (t, J = 7.6 Hz, 3H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.91 (m, 2H), 1.72 (p, J = 7.2 Hz, 2H). LCMS (ESI): *m/z* 432.3 $(M+H)^+$.

[2336] **실시예 5**

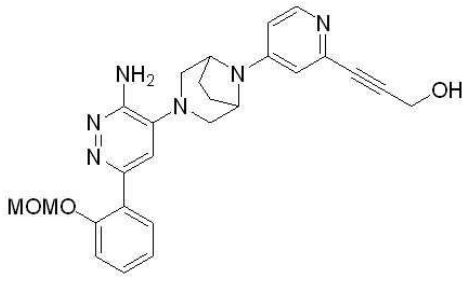
[2337] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(4-(히드록시메틸)피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 45)**



[2338]

[2339] **단계 1 내지 6:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 1 및 실시예 1에 기재된 것과 유사한 절차.

[2340] **단계 7: 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-올**

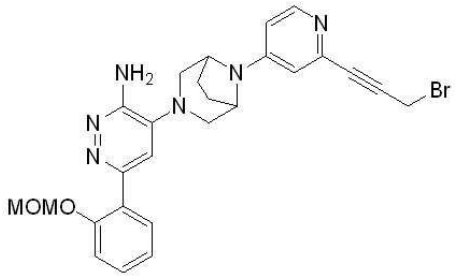


[2341]

[2342] DMF(210 mL) 중 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(30.0 g, 60.3 mmol, 1.00 eq)용액에 $Pd(PPh_3)_4$(2.12 g, 3.02 mmol, 0.05 eq), CuI(574 mg, 3.02 mmol, 0.05 eq), PPh_3(3.16 g, 12.1 mmol, 0.20 eq), Et_3N(18.3 g, 181 mmol, 25.2 mL, 3.00 eq) 및 프로프-2-인-1-올(5.75 g, 102.59 mmol, 6.06 mL, 1.70 eq)을 20 ℃에서 N_2하에 첨가했다. 반응물을 N_2하에 2 시간 동안 80 ℃에서 진탕했다. 혼합물을 물(1.00 L)에 부었다. 수성상을 에틸 아세테이트(500 mL × 3)로 추출했다. 조합된 유기상을 염수(300 mL)로 세척하고, 무수 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 진공하에 농축했다. 잔류물을 컬

럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 100/1 내지 0/1)로 정제하여 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-올(19 g, 39.69 mmol, 65.8% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-*d6*): δ 8.08 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.58 (dd, J = 2.0 Hz, 4.0 Hz 1H), 7.31-7.36 (m, 1H), 7.12-7.16 (m, 2H), 7.06 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.78 (dd, J = 2.4 Hz, 6.0 Hz 1H), 5.71 (s, 2H), 5.34 (t, J = 6.0 Hz, 1H), 5.13 (s, 2H), 4.54 (s, 2H), 4.28 (d, J = 5.6 Hz, 2H), 3.22 (s, 3H), 3.16 (d, J = 10.4 Hz, 2H), 2.84 (d, J = 11.2 Hz, 2H), 2.17-2.22 (m, 2H), 1.95-1.99(m, 2H).

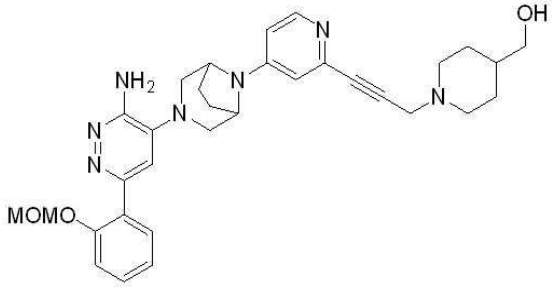
[2343] **단계 8: 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2344]

[2345] DCM(1.50 mL) 중 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-올(70.0 mg, 0.15 mmol, 1.00 eq)의 현탁액에 CBr_4(73.7 mg, 0.225 mmol, 1.50 eq)를 첨가했다. 이후 PS-PPh_3(150 mg)을 N_2하에 첨가했다. 반응물을 2 시간 동안 30 ℃에서 진탕했다. 여과 후, 여액을 다음 단계로 이월했다.

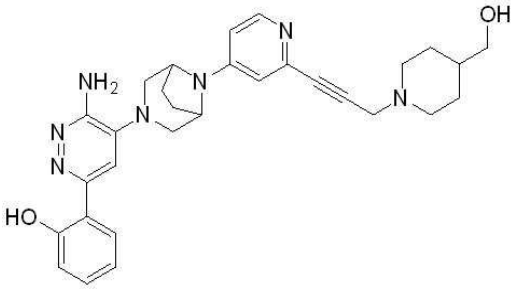
[2346] **단계 9: (1-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)피페리딘-4-일)메탄올**



[2347]

[2348] DCM(0.100 mL) 중 피페리딘-4-일메탄올(57.6 mg, 0.50 mmol, 5.00 eq)의 용액에 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(53.5 mg, 0.10 mmol, 1.00 eq) 및 DIEA(64.6 mg, 0.500 mmol, 5.00 eq)의 용액을 첨가했다. 이후 혼합물을 30 ℃에서 3 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 미정제 잔류물을 다음 단계로 이월했다.

[2349] **단계 10: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(4-(히드록시메틸)피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 45)**

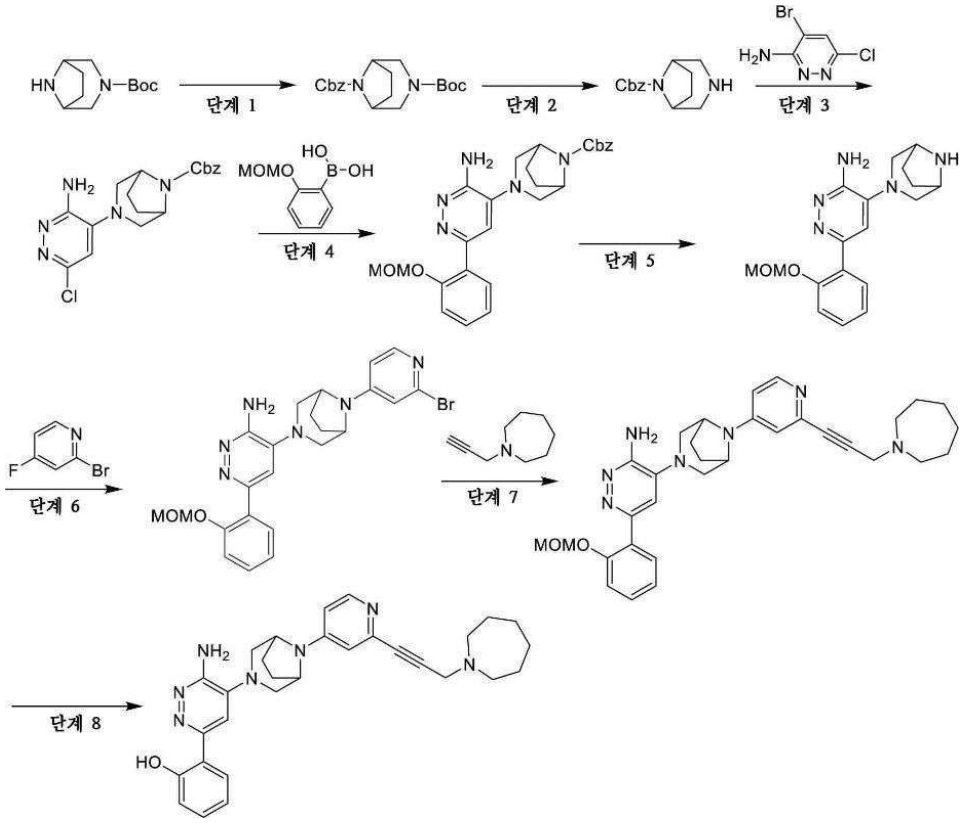


[2350]

[2351] MeOH(0.500 mL) 중 (1-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)피페리딘-4-일)메탄올(57.0 mg, 0.100 mmol, 1.0 eq)의 용액에 HCl-디옥산(0.500 mL, 4M)을 첨가했다. 반응 혼합물을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 잔류물을 분취용 TLC로 정제하여 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(4-(히드록시메틸)피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 45)(2.8 mg, 3.6% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (br s, 1H), 8.09 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.25 Hz, 1H), 6.82-6.89 (m, 2H), 6.80 (dd, J=2.38, 6.00 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (br s, 2H), 4.42 (t, J=5.32 Hz, 1H), 3.46 (s, 2H), 3.27 (br s, 1H), 3.22-3.26 (m, 3H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.86 (br d, J=11.26 Hz, 2H), 2.07-2.23 (m, 4H), 1.90-2.01 (m, 2H), 1.67 (br d, J=11.01 Hz, 2H), 1.26-1.37 (m, 1H), 1.08-1.19 (m, 2H).

[2352] **실시예 6**

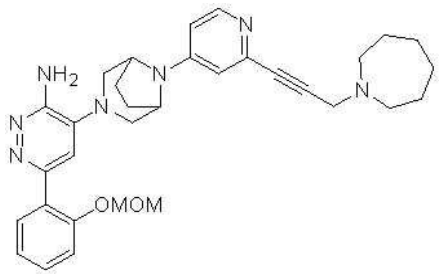
[2353] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 58)**



[2354]

[2355] **단계 1 내지 6:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 1 및 실시예 1에 기재된 것과 유사한 절차.

[2356] **단계 7: 4-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

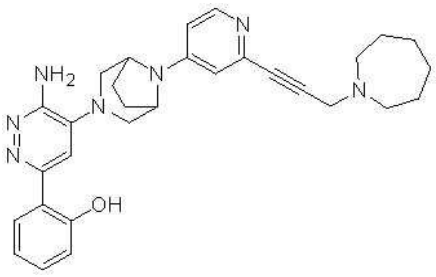


[2357]

[2358] THF(5 mL) 중 4-[8-(2-브로모-4-피리딜)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(300 mg, 0.603 mmol, 1.0 eq) 및 1-프로프-2-이닐아제판(413.83 mg, 3.02 mmol, 5 eq)의 용액에

TEA(305.16 mg, 3.02 mmol, 5 eq) 및 $Pd(dppf)Cl_2$ (44.12 mg, 0.060 mmol, 0.1 eq), CuI(11.49 mg, 0.060 mmol, 0.1 eq)를 첨가했다. 혼합물을 N_2하에 80 ℃에서 10 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 감압하에 농축하여 용매를 제거했다. 잔류물을 H_2O(20 mL)로 희석하고 EtOAc(20 mL × 2)로 추출했다. 조합된 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻어 4-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민을 갈색 고체(500 mg, 미정제)로 얻었다.

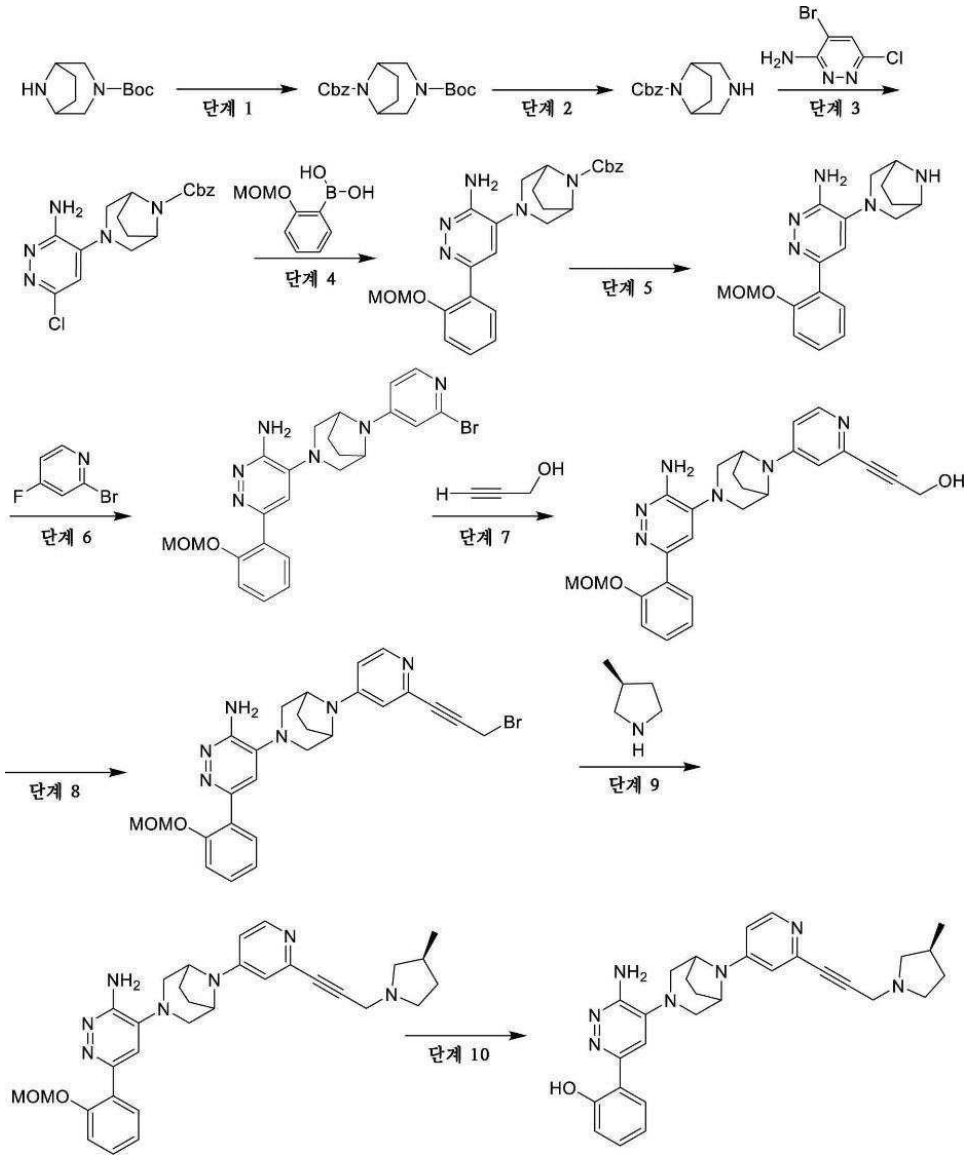
[2359] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 58)**

[2360] 

[2361] DCM(2 mL) 중 4-[8-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(500 mg, 0.903 mmol, 1.00 eq)용액에 HCl/EtOAc(4 M, 30.00 mL, 133 eq)를 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 감압하에 농축했다. 미정제 생성물을 Pre-HPLC(Phenomenex Luna C18 75*30mm*3um, 물(0.225% FA)-ACN, 1-30%)로 정제하여 to afford 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 58)(26 mg, 두 단계에 걸쳐 8.4% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.49 (br s, 1H), 8.11 (br d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.75 (br d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.25 (br t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.98 - 6.83 (m, 3H), 4.70 - 4.57 (m, 2H), 3.94 (s, 2H), 3.41 (br d, J = 11.2 Hz, 2H), 3.19 - 3.04 (m, 6H), 2.37 - 2.07 (m, 4H), 1.85 (br s, 4H), 1.80 - 1.62 (m, 4H).

[2362] **실시예 7**

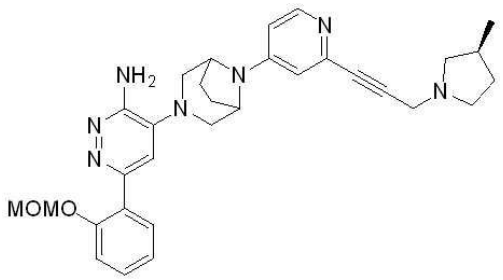
[2363] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((S)-3-메틸피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 75)**



[2364]

[2365] **단계 1 내지 8:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 3 및 실시예 5에 기재된 것과 유사한 절차.

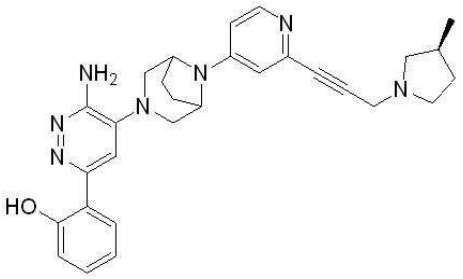
[2366] **단계 9: 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-((S)-3-메틸피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민**



[2367]

[2368] DCM(0.100 mL) 중 (S)-3-메틸피롤리딘(42.6 mg, 0.50 mmol, 5.00 eq)의 용액에 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(53.5 mg, 0.10 mmol, 1.00 eq) 및 DIEA(64.6 mg, 0.500 mmol, 5.00 eq)의 용액을 첨가했다. 이후 혼합물을 30 ℃에서 3시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 미정제 잔류물을 다음 단계로 이월했다.

[2369] **단계 10: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((S)-3-메틸피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 75)**

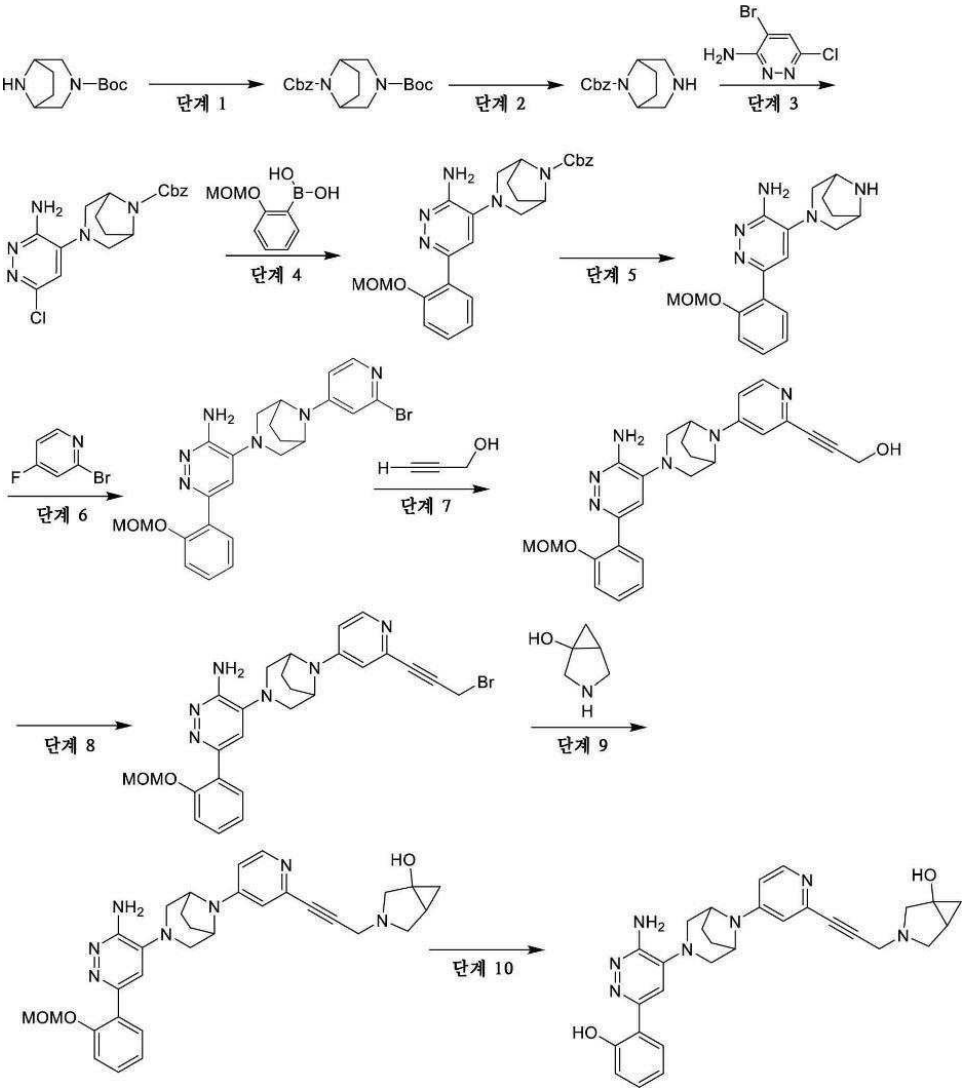


[2370]

[2371] MeOH(0.500 mL) 중 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-((S)-3-메틸피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민(54.0 mg, 0.100 mmol, 1.0 eq)의 용액에 HCl-디옥산(0.500 mL, 4M)을 첨가했다. 반응 혼합물을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Welch Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(0.225% FA)-ACN, 0-30%)로 정제하여 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-((S)-3-메틸피롤리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 75)(5.7 mg, 12% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.09 (d, J=5.77 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.77-6.90 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.50-3.59 (m, 2H), 3.27 (br s, 1H), 3.25 (br s, 1H), 3.00 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.80 (t, J=7.28 Hz, 1H), 2.57-2.68 (m, 2H), 2.12-2.24 (m, 4H), 1.90-2.01 (m, 3H), 1.23-1.33 (m, 1H), 0.99 (d, J=6.53 Hz, 3H).

[2372] **실시예 8**

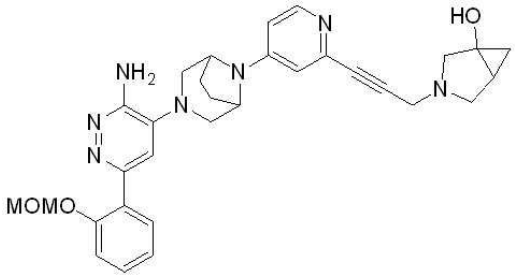
[2373] **3-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올(화합물 105)**



[2374]

[2375] **단계 1 내지 8:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 3 및 실시예 5에 기재된 것과 유사한 절차.

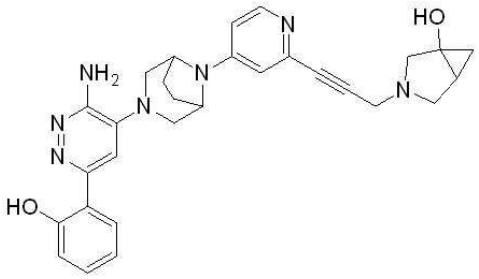
[2376] **단계 9: 3-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올**



[2377]

[2378] DCM(0.100 mL) 중 3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올(49.6 mg, 0.50 mmol, 5.00 eq)의 용액에 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(53.5 mg, 0.10 mmol, 1.00 eq) 및 DIEA(64.6 mg, 0.500 mmol, 5.00 eq)의 용액을 첨가했다. 이후 혼합물을 30 ℃에서 3 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 미정제 잔류물을 다음 단계로 이월했다.

[2379] **단계 10: 3-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올(화합물 105)**

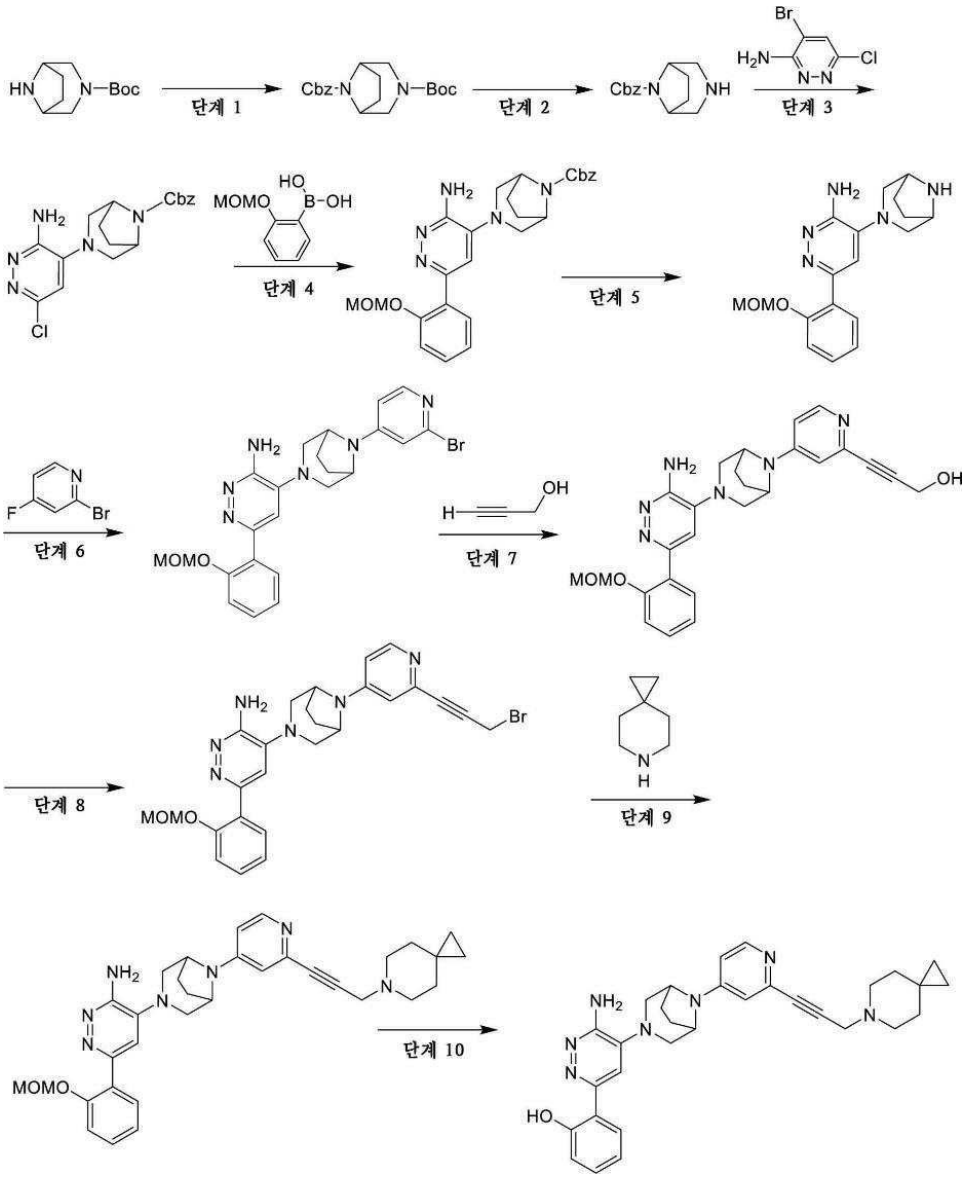


[2380]

[2381] MeOH(0.500 mL) 중 3-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올(55.4 mg, 0.100 mmol, 1.0 eq)용액에 HCl-디옥산(0.500 mL, 4M)을 첨가했다. 반응 혼합물을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Welch Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(0.225% FA)-ACN, 2-27%)로 정제하여
3-(3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-히드록시페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)-3-아자비시클로[3.1.0]헥산-1-올**(화합물 105)** (5.3 mg, 10% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.07 (br s, 1H), 8.10 (d, J=6.02 Hz, 1H), 7.88-7.95 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.25 (m, 1H), 6.96 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.76-6.90 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 5.68 (br s, 1H), 4.58 (br s, 2H), 3.49-3.63 (m, 2H), 3.28 (br s, 1H), 3.25 (br s, 1H), 2.93-3.05 (m, 3H), 2.72-2.77 (m, 2H), 2.65-2.69 (m, 1H), 2.19 (br d, J=7.28 Hz, 2H), 1.93-2.02 (m, 2H), 1.24-1.32 (m, 1H), 0.84 (t, J=4.39 Hz, 1H), 0.69 (dd, J=4.52, 8.78 Hz, 1H).

[2382] **실시예 9**

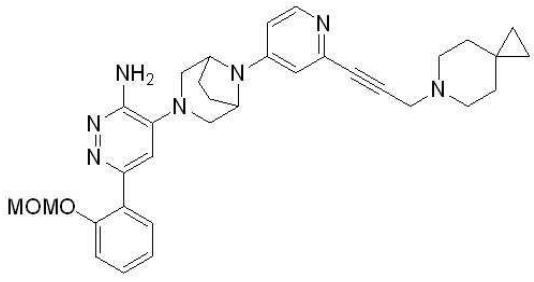
[2383] **2-(5-(8-(2-(3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀(화합물 136)**



[2384]

[2385] **단계 1 내지 8:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 3 및 실시예 5에 기재된 것과 유사한 절차.

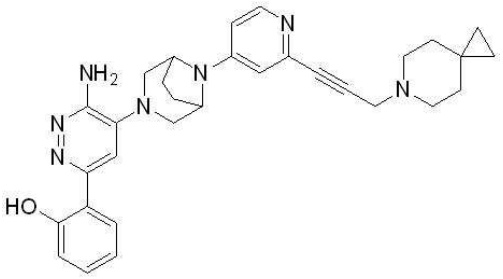
[2386] **단계 9: 4-(8-(2-(3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2387]

[2388] DCM(0.100 mL) 중 6-아자스피로[2.5]옥탄(55.6 mg, 0.50 mmol, 5.00 eq)의 용액에 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(53.5 mg, 0.10 mmol, 1.00 eq) 및 DIEA(64.6 mg, 0.500 mmol, 5.00 eq)의 용액을 첨가했다. 이후 혼합물을 30 ℃에서 3 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 미정제 잔류물을 다음 단계로 이월했다.

[2389] **단계 10: 2-(5-(8-(2-(3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀(화합물 136)**

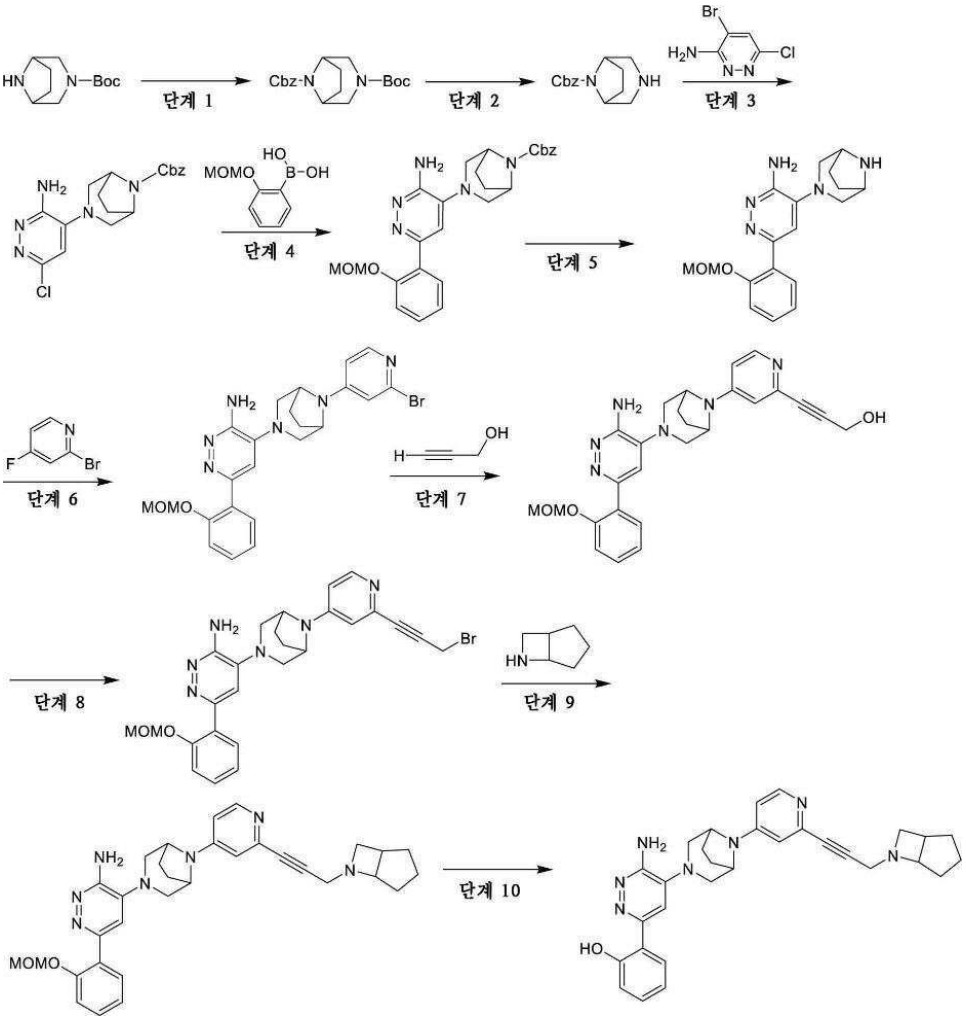


[2390]

[2391] MeOH(0.500 mL) 중 4-(8-(2-(3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(56.6 mg, 0.100 mmol, 1.0 eq)의 용액에 HCl-디옥산(0.500 mL, 4M)을 첨가했다. 반응 혼합물을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Welch Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(0.225% FA)-ACN, 0-24%)로 정제하여 2-(5-(8-(2-(3-(6-아자스피로[2.5]옥탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀**(화합물 136)**(9.6 mg, 18% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.04 (br s, 1H), 8.10 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.91 (d, J=7.25 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (t, J=7.25 Hz, 1H), 6.95 (d, J=1.88 Hz, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.50 (s, 2H), 3.26 (br d, J=11.2 Hz, 2H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.53 (m, 4H), 2.20 (br d, J=7.13 Hz, 2H), 1.86-2.07 (m, 2H), 1.22-1.51 (m, 4H), 0.25 (s, 4H).

[2392] **실시예 10**

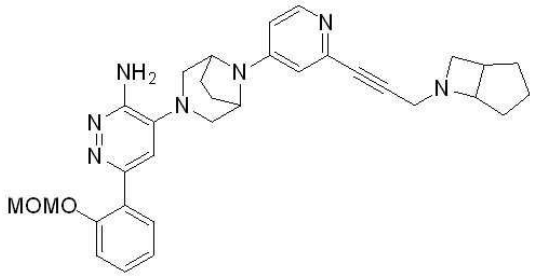
[2393] **2-(5-(8-(2-(3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀(화합물 162)**



[2394]

[2395] **단계 1 내지 8:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 3 및 실시예 5에 기재된 것과 유사한 절차.

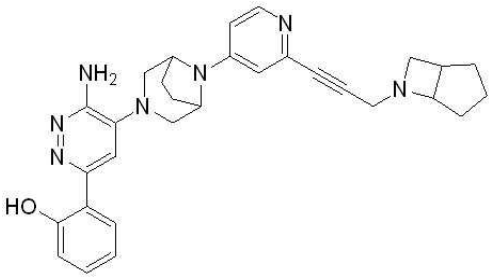
[2396] **단계 9: 4-(8-(2-(3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2397]

[2398] DCM(0.100 mL) 중 6-아자비시클로[3.2.0]헵탄(48.6 mg, 0.50 mmol, 5.00 eq)의 용액에 4-(8-(2-(3-브로모프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(53.5 mg, 0.10 mmol, 1.00 eq) 및 DIEA(64.6 mg, 0.500 mmol, 5.00 eq)의 용액을 첨가했다. 이후 혼합물을 30 ℃에서 3 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 미정제 잔류물을 다음 단계로 이월했다.

[2399] **단계 10: 2-(5-(8-(2-(3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀(화합물 162)**

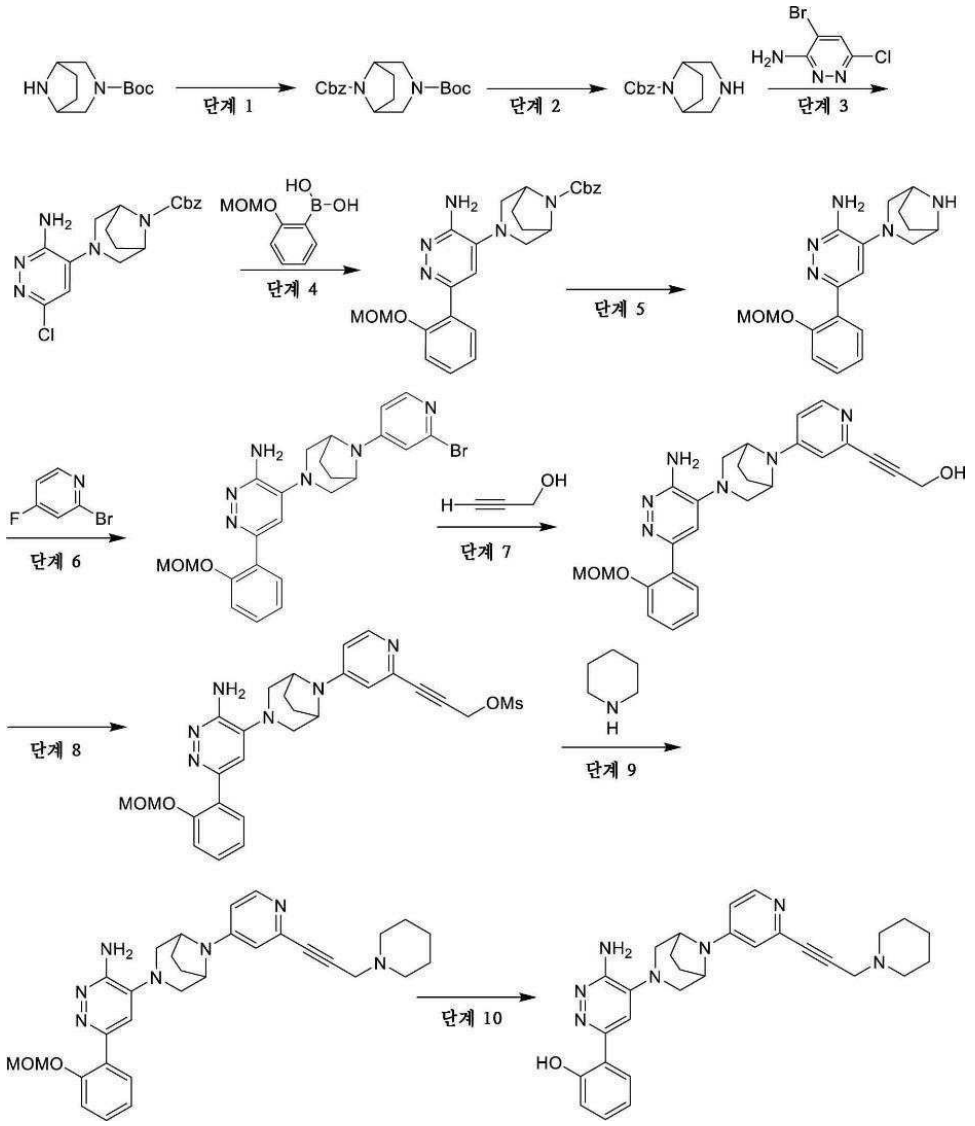


[2400]

[2401] MeOH(0.500 mL) 중 4-(8-(2-(3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(55.2 mg, 0.100 mmol, 1.0 eq)의 용액에 HCl-디옥산(0.500 mL, 4M)을 첨가했다. 반응 혼합물을 30 ℃에서 2 시간 동안 진탕했다. 용매를 스피드백으로 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Welch Xtimate® C18 150*25mm*5μm, 물(0.225% FA)-ACN, 0-22%)로 정제하여 2-(5-(8-(2-(3-(6-아자비시클로[3.2.0]헵탄-6-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-아미노피리다진-3-일)페놀**(화합물 162)**(7.9 mg, 16% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (br s, 1H), 8.10 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.88 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 6.95 (d, J=2.13 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.81-3.88 (m, 1H), 3.42 (s, 2H), 3.26 (br d, J=11.2 Hz, 2H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.92 (dd, J=3.25, 7.63 Hz, 1H), 2.69-2.78 (m, 1H), 2.20 (br d, J=7.13 Hz, 2H), 1.91-2.07 (m, 4H), 1.70-1.79 (m, 1H), 1.61-1.70 (m, 2H), 1.36-1.49 (m, 1H), 1.13-1.25 (m, 1H).

[2402] **실시예 11**

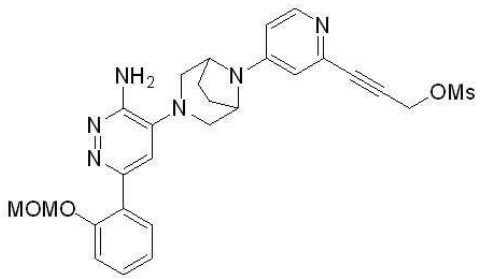
[2403] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 166)**



[2404]

[2405] **단계 1 내지 7:** 본원의 다른 곳, 예를 들어 반응식 3 및 실시예 5에 기재된 것과 유사한 절차.

[2406] **단계 8: 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일 메탄설포네이트**

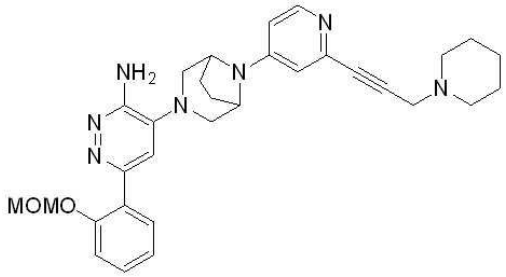


[2407]

[2408] DCM(10.0 mL) 중 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-올(200 mg, 0.424 mmol, 1.00 eq)의 용액에 TEA(85.8 mg, 0.848 mmol, 2.00 eq) 및 MsCl(213 mg, 1.86 mmol, 4.38 eq)을 첨가했다. 이후 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 물(5.00 mL x 2), 염수(10.0 mL)로 세척했다. 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고 진공에서 농축하여 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일 메탄설포네이트(0.700 g, 미정제)를 미정제 갈색 고체로 얻었다.

[2409] 단계 9: 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시

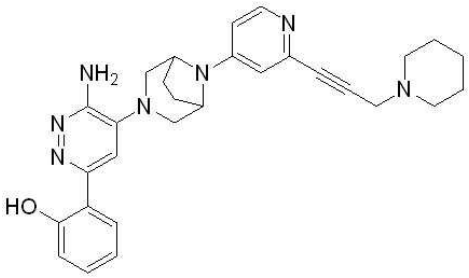
클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민



[2410]

[2411] DCM(5.00 mL) 중 3-(4-(3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일 메탄설포네이트(700 mg, 1.27 mmol, 1.00 eq) 및 피페리딘(162 mg, 1.91 mmol, 1.50 eq)의 용액에 피리딘(201 mg, 2.54 mmol, 2.00 eq)을 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 진공하에 농축했다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(에틸 아세테이트/MeOH = 50/1 내지 0/1)로 정제하여 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민(430 mg, 63% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.21 (d, 1H, *J* = 6.0 Hz), 7.65 (dd, 1H, *J* = 1.8, 7.6 Hz), 7.34 (ddd, 1H, *J* = 1.8, 7.3, 8.3 Hz), 7.21 (s, 1H), 7.2-7.1 (m, 2H), 6.81 (d, 1H, *J* = 2.4 Hz), 6.55 (dd, 1H, *J* = 2.5, 6.0 Hz), 5.30 (br s, 2H), 4.40 (br s, 2H), 3.64 (br s, 2H), 3.34 (s, 3H), 3.19 (br d, 2H, *J* = 11.6 Hz), 3.03 (br d, 3H, *J* = 11.1 Hz), 2.74 (br s, 4H), 2.18-2.13 (m, 4H), 1.77-1.66 (m, 4H), 1.54-1.43 (m, 2H).

[2412] 단계 10: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀(화합물 166)

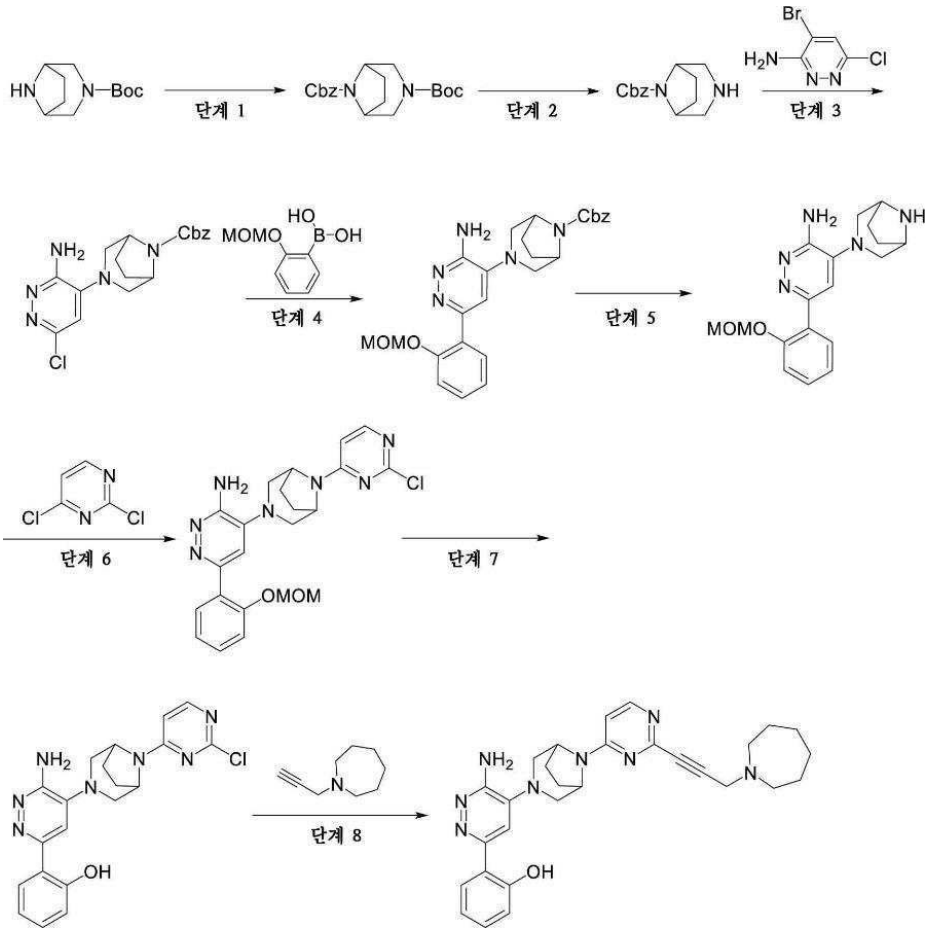


[2413]

[2414] EtOAc(2.00 mL) 중 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-아민(300 mg, 0.555 mmol, 1.00 eq)용액에 HCl/EtOAc(4 M, 10.0 mL)를 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 진공에서 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(Waters Xbridge BEH C18 100*30mm*10μm, 물(10mM 중탄산암모늄 및 0.05% 수산화암모늄 v/v)-ACN, 40%-70%)로 정제하여 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(피페리딘-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**(화합물 166)**(35.0 mg, 13% 수율)을 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.06 (d, *J* = 6.0 Hz, 1H), 7.73 (br d, *J* = 7.2 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.23 (t, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.00 (d, *J* = 2.4 Hz, 1H), 6.89 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 6.81 (dd, *J* = 6.0, 2.4 Hz, 1H), 4.52 (br s, 2H), 3.50 (s, 2H), 3.36 (br d, *J* = 10.0 Hz, 2H), 2.26 - 2.23 (m, 2H), 2.16 - 2.13 (m, 2H), 1.68 - 1.63 (m, 4H), 1.50 - 1.49 (m, 2H).

[2415] **실시예 12 (화합물 245)**

[2416] **2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2417]

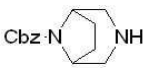
[2418] **단계 1: 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트**



[2419]

[2420] DCM(620 mL) 중 tert-부틸 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트(125 g, 589 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, TEA(179 g, 1.77 mol, 246 mL, 3.00 eq) 및 CbzCl(151 g, 883 mmol, 126 mL, 1.50 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 25℃에서 3 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. TLC(석유 에테르: 에틸 아세테이트 = 3: 1)는 새로운 스팟(R_f = 0.37)이 형성되었음을 보여주었다. 용액을 물 50.0 mL로 세척하고, EtOAc 150×3 mL로 추출하고, 염수 50.0 mL로 세척하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 3: 1)로 정제하여 표제 화합물(89.0 g, 257 mmol, 43.6% 수율)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.38-7.34 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.30 (s, 2H), 3.87-3.70 (m, 2H), 3.03 (d, J = 28.8 Hz, 2H), 1.95 (s, 2H), 1.88 (d, J = 16.8 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H).

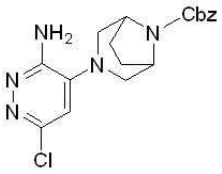
[2421] **단계 2: 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2422]

[2423] EtOAc(150 mL) 중 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트(89.0 g, 257 mmol, 1.00 eq)의 용액에 HCl/EtOAc(4 M, 321 mL, 5.00 eq)를 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. 용액을 감압하에 농축하여 대부분의 용매를 제거하고 여과하여 표제 화합물(59.0 g, 209 mmol, 81.2% 수율)을 미정제 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.32 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.44 (s, 2H), 3.20 (s, 4H), 2.32-2.27 (m, 2H), 2.16-2.00 (m, 2H)

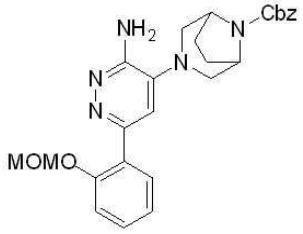
[2424] 단계 3: 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트



[2425]

[2426] DMSO(410 mL) 중 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(59.0 g, 209 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, 4-브로모-6-클로로-피리다진-3-아민(45.7 g, 219 mmol, 1.05 eq), DIPEA(108 g, 835 mmol, 145 mL, 4.00 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 130℃에서 16 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 물 100 mL를 첨가하고, 동일한 생성물의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합하고, EtOAc 150 x 3 mL로 추출한 다음, 염수 20.0 mL로 세척하고, 감압하에 농축하여 표제 화합물(200 g, 미정제)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.27 (m, 5H), 6.70 (s, 1H), 5.17 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 4.46 (s, 2H), 3.25 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 2.89 (d, J = 33.6 Hz, 2H), 2.08-2.05 (m, 2H), 1.95-1.91 (m, 2H)

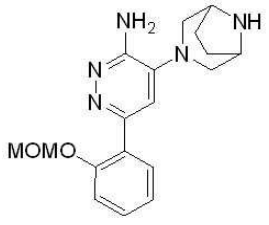
[2427] **단계 4: 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2428]

[2429] 디옥산(800 mL) 및 H_2O(150 mL) 중 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(100 g, 268 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에 (2-(메톡시메톡시)페닐)보론산(73.0 g, 401 mmol, 1.50 eq), $Pd(PPh_3)_4$(30.9 g, 26.8 mmol, 0.100 eq) 및 K_2CO_3(73.9 g, 534 mmol, 2.00 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 100℃에서 2 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 100 mL 물을 첨가하고 동일한 반응의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합했다. 혼합물을 EtOAc 200 mL × 3으로 추출하고, 유기물을 염수 100 mL로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 0: 1)로 정제하여 표제 화합물(182 g, 조합 수율: 71.7%)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.68 (d, J =1.2 Hz, 1H), 7.66-7.25 (m, 6H), 7.17 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.11-7.10 (m, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.39 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.17 (d, J = 10.0 Hz, 2H), 2.83 (d, J = 46.8 Hz, 2H), 1.92-2.15 (m, 4H).

[2430] **단계 5: 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

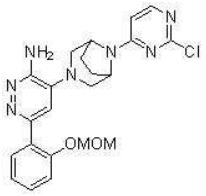


[2431]

[2432] MeOH(1.27 L) 중 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(182 g, 383 mmol, 1.00 eq)의 용액에 $Pd(OH)_2$/C(53.8 g, 38.3 mmol, 10.0% 순도, 0.100 eq)를 N_2 분위기하에 첨가했다. 현탁액을 탈기하고 H_2로 3 회 퍼징했다. 혼합물을 H_2하에 35℃에서 16 시간 동안 교반했다. 용액을 여과하고 여액을 감압하에 농축하여 표제 화합물(100 g, 미정제)을 갈색 고체로 얻었다.

[2433] **단계 6: 4-(8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다**

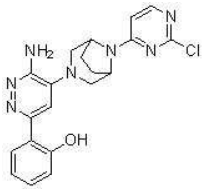
진-3-아민



[2434]

[2435] EtOH(2 mL) 중 2,4-디클로로피리미딘(40.0 mg, 268.5 μmol, 1.0 eq)의 용액에 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(100.8 mg, 295.3 μmol, 1.1 eq) 및 DIEA(93.53 μL, 537.0 μmol, 2.0 eq)을 25 ℃에서 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. TLC(DCM /MeOH = 10/1, R_f = 0.7)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 진공에서 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, DCM/MeOH = 100/1 내지 10/1)로 정제하여 표제 화합물(70 mg, 154.2 μmol, 57.4% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.08 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 7.58 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1 H), 7.38 - 7.31 (m, 1 H), 7.20 (s, 1 H), 7.16 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 7.07 (t, J = 7.6 Hz, 1 H), 6.82 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 5.76 (d, J = 6.4 Hz, 2 H), 5.16 (s, 2 H), 4.96 - 4.45 (m, 2 H), 3.31 - 3.28 (m, 2 H), 3.27 (s, 3 H), 2.91 - 2.72 (m, 2 H), 2.21 (m, 2 H), 1.96 - 1.94 (m, 2 H).

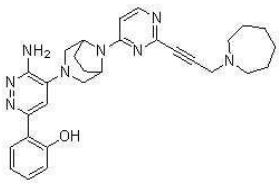
[2436] **단계 7: 2-(6-아미노-5-(8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2437]

[2438] 디옥산(5 mL) 중 4-[8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(70.0 mg, 154.2 μmol, 1.00 eq)의 용액에 디옥산(5 mL) 중 4M HCl(0.4 mL, 1.6 mmol, 10 eq)을 첨가했다. 반응 혼합물을 25 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. TLC(DCM/MeOH = 10/1, R_f = 0.5)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 혼합물을 진공에서 농축하여 표제 화합물(60 mg, 146.4 μmol, 94.9% 수율)을 황색 고체로 얻었다. 미정제 생성물을 추가의 정제 없이 다음 단계에서 직접 사용했다.

[2439] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



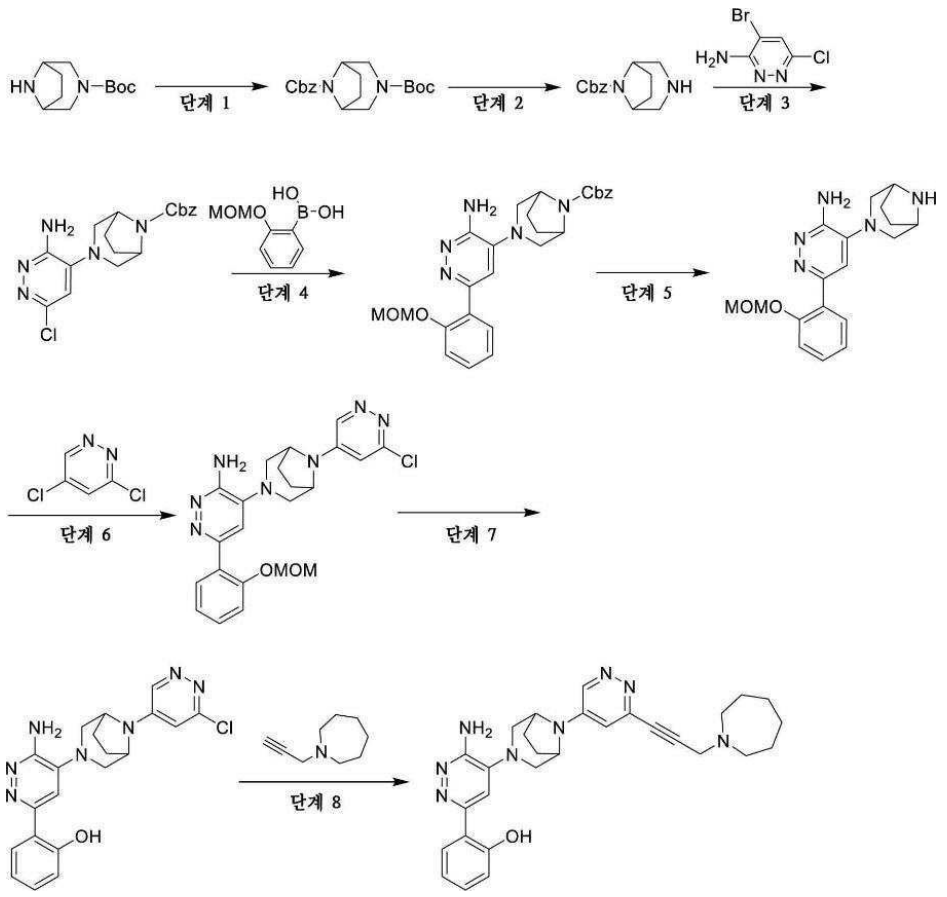
[2440]

[2441] DMF(5 mL) 중 1-프로프-2-이닐아제판(50.2 mg, 366.0 μmol, 5.00 eq) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(ii)디클로라이드(5.1 mg, 7.3 μmol, 0.10 eq)의 용액에 PPh_3(3.8 mg, 14.6 μmol, 0.20 eq), CuI(1.4 mg, 14.6 μmol, 0.10 eq), Et_3N (0.03 mL, 219.6 μmol, 3.00 eq) 및 2-[6-아미노-5-[8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀(30.0 mg, 73.2 μmol, 1.00 eq)을 첨가했다. 이후 반응물을 50 ℃에서 6 시간 동안 교반했다. TLC(DCM /MeOH = 10/1, R_f = 0.3)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 여과하고 여액을 수집했다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼: Welch Xtimate® C18 150*30mm*5μm; 이동상: [물(FA)-ACN])로 정제하여 표제 화합물(9.9 mg, 18.2 μmol, 24.9% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.22 (s, 1 H), 7.55 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.29 - 7.26 (m, 2 H) 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 6.88 (t, J = 7.2 Hz, 1 H), 6.41 (d, J = 5.6 Hz, 1 H), 4.90 - 4.70 (m, 4 H), 3.72 (s, 2 H), 3.37 -

3.41 (m, 2 H), 3.17 - 3.00 (m, 2 H), 2.95 - 2.77 (m, 4 H), 2.26 - 2.00 (m, 4 H), 1.75 - 1.63 (m, 8 H). LCMS (ESI): *m/z* 511.1 $(M+H)^+$.

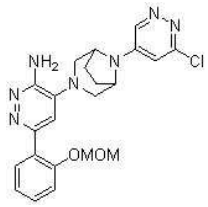
[2442] **실시예 13 (화합물 246)**

[2443] **2-(6-아미노-5-(8-(6-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

[2444] 

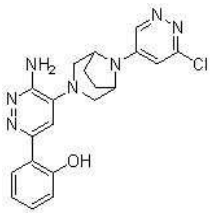
[2445] **단계 1 내지 5:** 본원에, 예를 들어 실시예 12에 기재된 것과 유사한 절차

[2446] **단계 6: 4-(8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

[2447] 

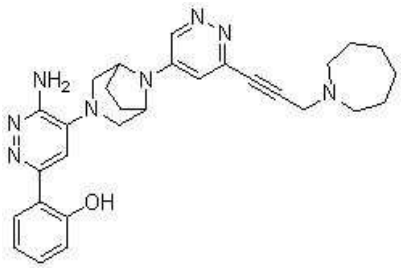
[2448] 에탄올(10 mL) 중 3,5-디클로로피리다진(327 mg, 2.2 mmol, 1.5 eq), 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(500 mg, 1.46 mmol, 1 eq) 및 트리에틸아민(0.82 mL, 5.86 mmol, 5 eq)의 혼합물을 탈기하고 N_2로 3 회 퍼징했다. 이후 혼합물을 90 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. TLC(MeOH/DCM = 1/10, R_f = 0.5)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 생성물을 얻었고, 이를 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, MeOH/DCM = 0 내지 3/100)로 정제하여 표제 화합물(350 mg, 0.77 mmol, 52.6% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

[2449] **단계 7: 2-(6-아미노-5-(8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

[2450] 

[2451] 4-[8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(250.0 mg, 0.55 mmol, 1 eq)을 1,4-디옥산 중 4M HCl(10.0 mL, 40 mmol, 72.6 eq)에 25 ℃에서 용해했다. 반응 혼합물을 25 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 표제 화합물(220 mg, 0.537 mmol, 97.5% 수율)을 황색 고체로 얻었다. 미정제 생성물을 추가의 정제 없이 다음 단계에서 직접 사용했다.

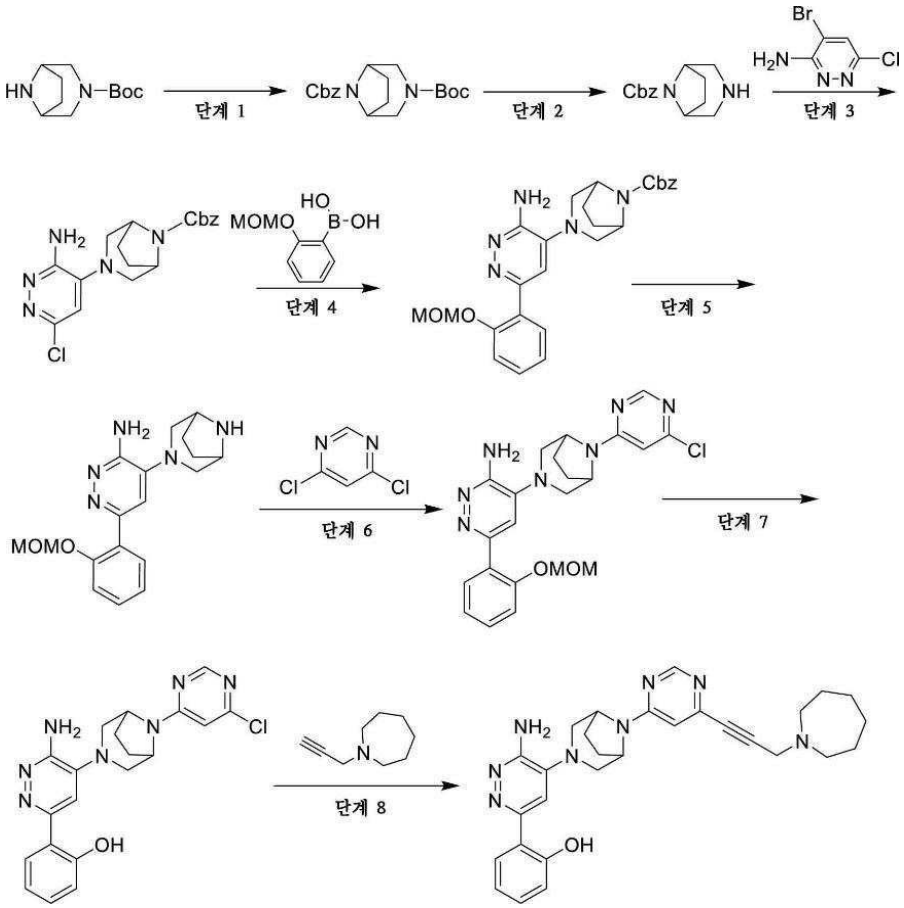
[2452] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(6-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

[2453] 

[2454] DMF(1.5 mL) 중 트리에틸아민(0.34 mL, 2.44 mmol, 10 eq), 2-[6-아미노-5-[8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀(100.0 mg, 0.24 mmol, 1 eq), 트리페닐포스핀(12.8 mg, 0.05 mmol, 0.2 eq), 코퍼(I) 아이오다이드(4.6 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)디클로라이드(17.1 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq) 및 1-프로프-2-이닐아제판(167.4 mg, 1.22 mmol, 5 eq)의 용액을 80 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. LCMS (5-95AB/1.5분): R_t =0.630 분, $[M+H]^+$ 511.1, 20.8%의 원하는 생성물을 나타냈다. 잔류물을 pre-HPLC(컬럼: Welch Xtimate® C18(150*30mm*5μm); 이동상: [물(FA)-ACN]; B%: 3%-33%,7분)로 정제하여 표제 화합물(9.3 mg, 0.018 mmol, 7.2% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.90 (s, 1 H), 7.89 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.54 (s, 1 H), 7.22 (t, J = 7.6 Hz, 1 H), 7.08 (d, J = 2.4 Hz, 1 H), 6.93 - 6.80 (m, 2 H), 6.02 (s, 2 H), 4.72 (s, 2 H), 3.62 (s, 2 H), 3.25 (s, 2 H), 3.02 (d, J = 12.0 Hz, 2 H), 2.70 - 2.66 (m, 4 H), 2.23 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 2.02 - 1.93 (m, 2 H), 1.65 - 1.52 (m, 8 H). LCMS (ESI): m/z 511.1 $(M+H)^+$.

[2455] **실시예 14 화합물 247**

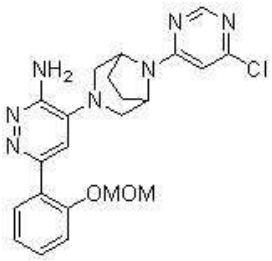
[2456] **2-(6-아미노-5-(8-(6-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2457]

[2458] **단계 1 내지 5:** 본원에, 예를 들어 실시예 12에 기재된 것과 유사한 절차

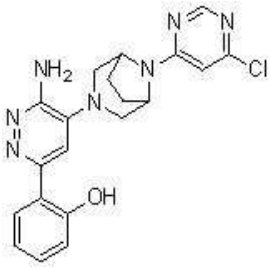
[2459] **단계 6: 4-(8-(6-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2460]

[2461] 에탄올(20 mL) 중 4,6-디클로로피리미딘(1.31 g, 8.79 mmol, 1.5 eq), 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(2.0 g, 5.86 mmol, 1 eq) 및 트리에틸아민(3.27 mL, 23.43 mmol, 4 eq)의 혼합물을 탈기하고 N_2로 3 회 퍼징했다. 이후 혼합물을 90 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. TLC(메틸 알코올 / 디클로로메탄 = 1/10, R_f = 0.5)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 생성물을 얻었고, 이를 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 디클로로메탄/MeOH = 100/0 내지 20/1)로 정제하여 표제 화합물(1.8 g, 3.97 mmol, 67.7% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

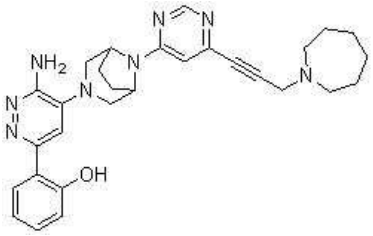
[2462] **단계 7: 2-(6-아미노-5-(8-(6-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2463]

[2464] 1,4-디옥산(15 mL) 중 4-[8-(6-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(1.8 g, 3.97 mmol, 1 eq)의 용액에 1,4-디옥산(15 mL, 60 mmol, 15 eq) 중 4M HCl을 25 ℃에서 첨가했다. 생성된 혼합물을 25 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. LCMS (5-95AB/1.5분): R_t =0.710 분, $[M+H]^+$ 410.0, 60%의 원하는 생성물을 나타냈다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 표제 화합물(1.6 g, 3.90 mmol, 98.4% 수율)을 황색 고체로 얻었다. 미정제 생성물을 추가의 정제 없이 다음 단계에서 직접 사용했다.

[2465] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(6-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

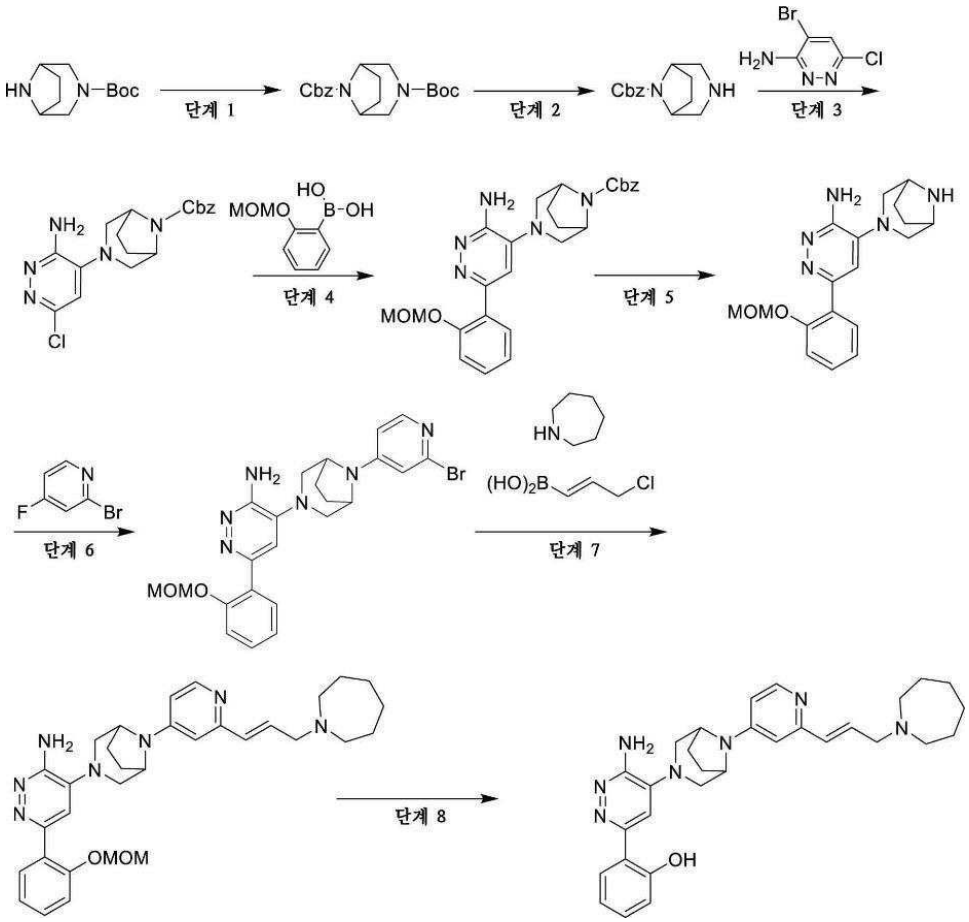


[2466]

[2467] N,N-디메틸포름아미드(3 mL) 중 2-[6-아미노-5-[8-(6-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀(100 mg, 0.24 mmol, 1 eq), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)디클로라이드(17.12 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq), 1-프로프-2-이닐아제판(167 mg, 1.22 mmol, 5 eq), 트리페닐포스핀(12.8 mg, 0.050 mmol, 0.2 eq), 코퍼(I) 아이오다이드(4.6 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq) 및 트리에틸아민(0.17 mL, 1.22 mmol, 5 eq)의 용액을 80 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. LCMS (5-95AB/1.5분): R_t =0.649 분, $[M+H]^+$ 511.2, 30%의 원하는 생성물을 나타냈다. 실온까지 냉각한 후, 혼합물을 여과했다. 여액을 pre-HPLC(컬럼: Welch Xtimate® C18 (150*30mm*5μm); 이동상: [물(FA)-ACN];B%: 3%-33%,7분)로 정제하여 표제 화합물(3.8 mg, 7.2 μmol, 3% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.45 (s, 1 H), 8.16 (s, 1H), 7.92 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.55 (s, 1 H), 7.27 - 7.18 (m, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 6.89 - 6.82 (m, 2 H), 6.03 (s, 2 H), 5.06 - 4.60 (m, 2 H), 3.59 (s, 2 H), 3.27 - 3.26 (m, 2 H), 3.01 - 2.98 (m, 2 H), 2.67 - 2.66 (m, 4 H), 2.24 - 2.20 (m, 2 H), 2.00 - 1.91 (m, 2 H), 1.64 - 1.52 (m, 8 H). LCMS (ESI): m/z 511.1 $(M+H)^+$.

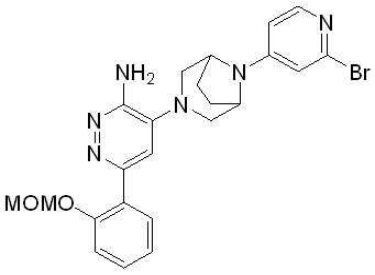
[2468] **실시예 15 화합물 248**

[2469] **(E)-2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-엔-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

[2470] 

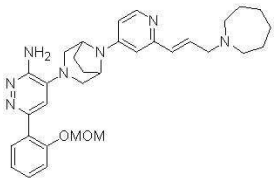
[2471] **단계 1 내지 5:** 본원에, 예를 들어 실시예 12에 기재된 것과 유사한 절차

[2472] **단계 6: 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

[2473] 

[2474] DMSO(96 mL) 중 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(16 g, 46.9 mmol)의 용액에 2-브로모-4-플루오로-피리딘(8.25 g, 46.9 mmol) 및 DIEA(60.6 g, 469 mmol, 81.6 mL)를 첨가한 다음 혼합물을 5 시간 동안 130℃에서 교반했다. 반응 혼합물을 H_2O 100 mL의 첨가에 의해 퀀칭하고, EtOAc 100 mL로 희석하고 EtOAc(100 mL × 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수 100 mL로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 미정제 생성물을 MeOH: DCM = 1: 20로 15℃에서 30 동안 트리터레이션한 다음, 여과하고 감압하에 농축하여 표제 화합물(17 g, 72.49% 수율)을 밝은 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.00 (d, J=5.96 Hz, 1 H), 7.72 (dd, J=7.63, 1.67 Hz, 1 H), 7.22 (s, 1 H) 7.31-7.38 (m, 1 H), 7.15 (d, J=7.89 Hz, 1 H), 7.10 (t, J=7.37 Hz, 1 H), 6.77 (d, J=2.15 Hz, 1 H), 6.54 (dd, J=5.96, 2.27 Hz, 1 H), 5.13 (s, 2 H), 5.10 (s, 2 H), 4.37 (s, 2 H), 3.36 (s, 3 H), 3.23 (d, J=10.13 Hz, 2 H), 3.02 (d, J=11.21 Hz, 2 H), 2.10-2.24 (m, 4 H).

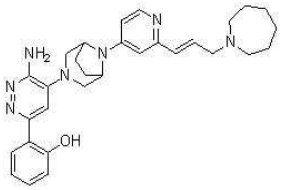
[2475] **단계 7: (E)-4-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-엔-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2476]

[2477] DMSO(4 mL) 중 4-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시) 페닐) 피리다진-3-아민(500 mg, 1.01 mmol, 1.00 eq), (E)-(3-클로로프로프-1-엔-1-일)보론산(242 mg, 2.01 mmol, 2.00 eq), Pd(dppf)Cl_2(141 mg, 0.2 mmol, 0.2 eq) 및 Cs_2CO_3(655 mg, 2.01 mmol, 2.00 eq)의 혼합물에 아제판(0.23 mL, 2.00 eq)을 N_2하에 첨가했다. 생성된 혼합물을 90 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. TLC(MeOH /DCM 중 3% $NH_3 \cdot H_2O$ = 1/10, R_f = 0.45)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 pre-HPLC(컬럼: Xtimate® C18 150*40mm*10 μm; 이동상: [물(FA)-ACN]; B%: 1%-30%,7분)로 정제하여 표제 화합물(190 mg, 0.34 mmol, 34% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

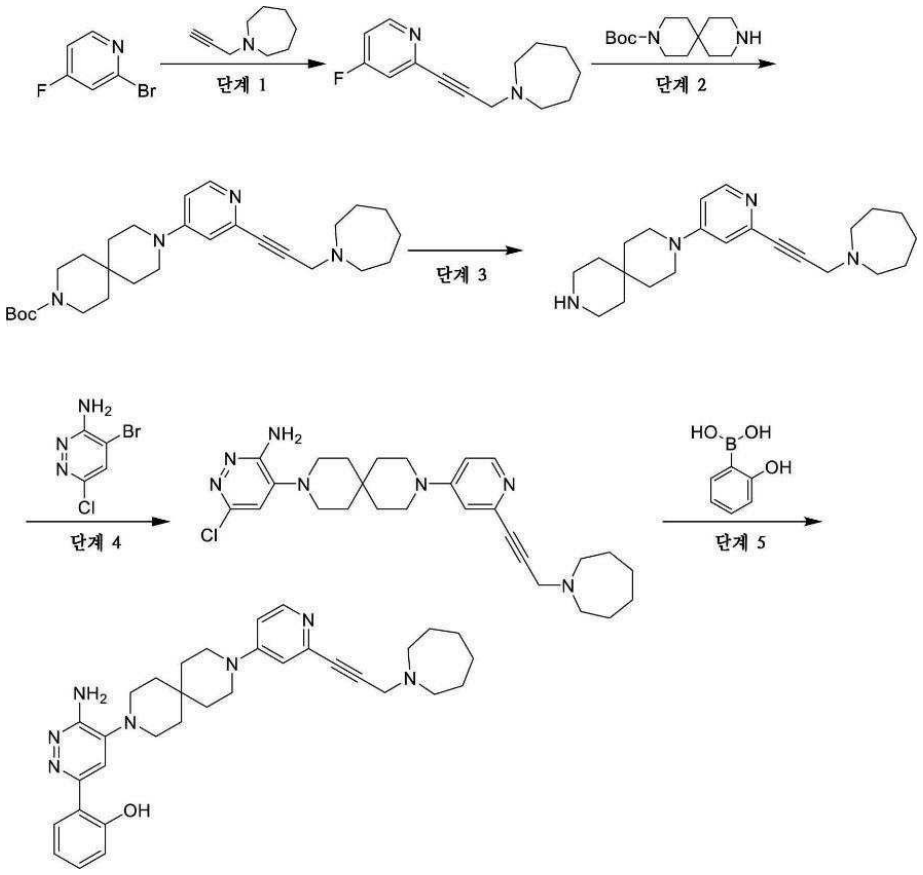
[2478] **단계 8: (E)-2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-엔-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2479]

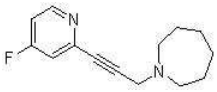
[2480] 디옥산(2 mL) 중 (E)-4-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-엔-1-일)피리딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(50 mg, 0.09 mmol, 1 eq)의 용액에 HCl/디옥산(4 M, 3 mL)을 첨가했다. 이후 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. TLC(MeOH /DCM 중 3% $NH_3 \cdot H_2O$ = 1/10, R_f = 0.3)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 prep-HPLC(컬럼: Boston Green ODS 150*30mm*5 μm; 이동상: [물(FA)-ACN];B%: 5%-35%, 7분)로 정제하여 표제 화합물(19 mg, 0.037 mmol, 41.3% 수율)을 갈색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, MeOD): δ 8.39 (s, 1 H), 8.14 (d, *J* = 6.4 Hz, 1 H), 7.72 (dd, J = 8.0, 1.2 Hz, 1 H), 7.49 (s, 1 H), 7.26 - 7.21 (m, 1 H), 7.04 (d, *J* = 2.4 Hz, 1 H), 6.90 - 6.80 (m, 3 H), 6.75 - 6.69 (m, 1 H), 4.70 (s, 2 H), 3.92 (d, *J* = 6.8 Hz, 2 H), 3.44 (d, *J* = 10.8 Hz, 2 H), 3.30 - 3.29 (m, 4 H), 3.11 (d, *J* = 11.6 Hz, 2 H), 2.36 - 2.29 (m, 2 H), 2.19 - 2.17 (m, 2 H), 1.94 - 1.88 (m, 4 H), 1.76 - 1.75 (m, 4 H). LCMS (ESI): *m/z* 512.1 $(M+H)^+$.

[2481] **실시예 16 화합물 249**



[2482]

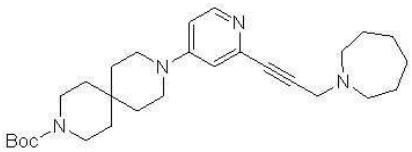
[2483] **단계 1: 1-(3-(4-플루오로피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)아제판**



[2484]

[2485] THF(35.0 mL) 중 2-브로모-4-플루오로피리딘(5.00 g, 28.4 mmol)의 용액에 1-(프로프-2-인-1-일)아제판(5.07 g, 36.9 mmol, 1.30 eq), CuI(541 mg, 2.84 mmol, 0.10 eq), TEA(4.31 g, 42.6 mmol, 5.93 mL, 1.50 eq) 및 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$(598 mg, 852 μmol, 0.03 eq)를 25 ℃에서 교반하면서 첨가했다. 혼합물을 N_2하에 70 ℃에서 5 시간 동안 환류시켰다. TLC(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 3/1, 생성물: R_f = 0.08)는 2-브로모-4-플루오로피리딘이 완전히 소비되었음을 나타냈다. 반응 혼합물을 물(30.0 mL)로 희석하고 EtOAc(30.0 mL x 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 석유 에테르 : 에틸 아세테이트 = 10 : 1 내지 0 : 1)로 정제하여 표제 화합물(3.80 g, 57.6% 수율)을 흑색 오일로 얻었다.

[2486] **단계 2: tert-부틸 9-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-카르복실레이트**

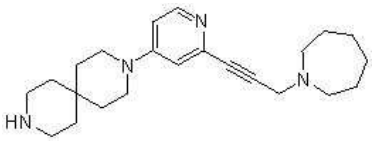


[2487]

[2488] DMF(15.0 mL) 중 1-(3-(4-플루오로피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)아제판(2.00 g, 8.61 mmol)의 용액에 tert-부틸 3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-카르복실레이트(2.19 g, 8.61 mmol) 및 Cs_2CO_3(8.42 g, 25.8 mmol)를 25 ℃에서 교반하면서 첨가했다. 혼합물을 100 ℃에서 12 시간 동안 환류시켰다. TLC(디클로로메탄 : 메탄올 = 10 : 1, R_f = 0.30)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 물(30.0 mL)로 희석하고 EtOAc(30.0 mL x 3)

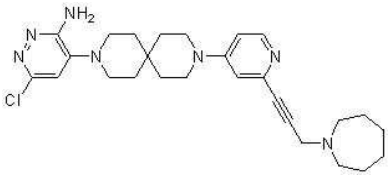
로 추출했다. 조합된 유기층을 염수로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 디클로로메탄 : 메탄올 = 10 : 1 내지 0 : 1)로 정제하여 표제 화합물(3.15 g, 78.4% 수율)을 흑색 오일로 얻었다. ^{1}H NMR: (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8.17 (br d, *J* = 1.10 Hz, 1 H) 6.80 (d, *J* = 0.66 Hz, 1 H) 6.55 (br d, *J* = 3.29 Hz, 1 H) 3.59 (s, 2 H) 3.44 - 3.33 (m, 4 H) 3.33 - 3.23 (m, 4 H) 2.81 - 2.71 (m, 4 H) 1.75 - 1.63 (m, 5 H) 1.63 - 1.52 (m, 10 H) 1.52 - 1.26 (m, 10 H).

[2489] **단계 3: 3-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸**

[2490] 

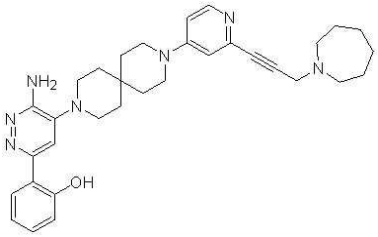
[2491] HCl/EtOAc(4 M, 25.0 mL) 및 EtOAc(10.0 mL) 중 tert-부틸 9-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-카르복실레이트(2.79 g, 5.98 mmol)의 혼합물을 4 시간 동안 25 ℃에서 교반했다. TLC(디클로로메탄:메탄올 = 10 : 1, R_f = 0.09)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 감압하에 농축하여 용매를 제거했다. 표제 화합물(2.69 g, 미정제)을 다음 단계에서 추가의 정제 없이 사용했다.

[2492] **단계 4: 4-(9-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일)-6-클로로피리다진-3-아민**

[2493] 

[2494] DMSO(20.0 mL) 중 3-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸 (0.930 g, 2.30 mmol)의 용액에 4-브로모-6-클로로피리다진-3-아민(479 mg, 2.30 mmol), CsF(1.05 g, 6.89 mmol) 및 DIEA(890 mg, 6.89 mmol)를 25 ℃에서 교반하며 첨가했다. 혼합물을 120 ℃에서 4 시간 동안 환류시켰다. TLC (디클로로메탄: 메탄올 = 10/1, R_f = 0.40)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 물(30.0 mL)로 희석하고 EtOAc(30.0 mL x 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 디클로로메탄: 메탄올 = 10 : 1 내지 0 : 1)로 정제하여 표제 화합물(0.260 g, 22.9% 수율)을 흑색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR: (400 MHz, $CDCl_3$) δ ppm 8.13 (d, *J* = 6.02 Hz, 1 H) 6.78 (d, *J* = 2.51 Hz, 1 H) 6.70 (s, 1 H) 6.53 (dd, *J* = 6.02, 2.64 Hz, 1 H) 4.75 (br s, 2 H) 3.32 - 3.24 (m, 4 H) 3.02 - 2.93 (m, 4 H) 2.79 - 2.69 (m, 4 H) 1.75 - 1.52 (m, 16 H).

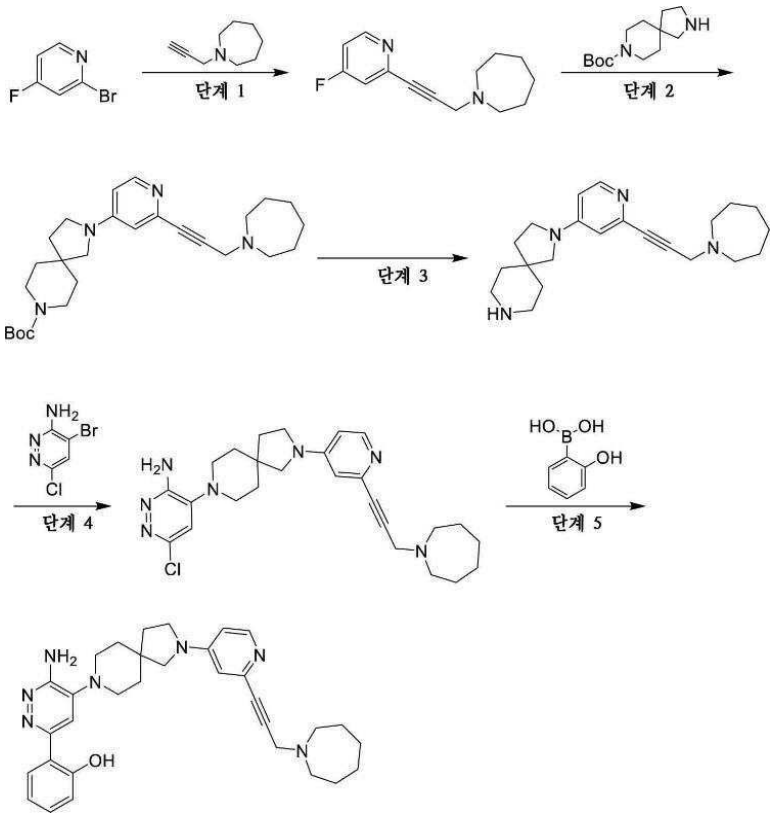
[2495] **단계 5: 2-(6-아미노-5-(9-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일)피리다진-3-일)페놀**

[2496] 

[2497] 디옥산(5.00 mL) 및 H_2O(1.00 mL) 중 4-(9-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-3,9-디아자스피로[5.5]운데칸-3-일)-6-클로로피리다진-3-아민(120 mg, 243 μmol)의 용액에 (2-히드록시페닐)보론산(50.3 mg, 364 μmol), $NaHCO_3$(61.2 mg, 729 μmol) 및 [2-(2-아미노페닐) 페닐]-클로로-팔라듐; 비스(1-아다만틸)-부틸-포스판(16.2 mg, 24.3 μmol)을 첨가했다. 혼합물을 100 ℃에서 3 시간 동안 환류시켰다. LCMS는 원하는 질량이 검출되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 감압하에 농축하여 용매를 제거했다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼:

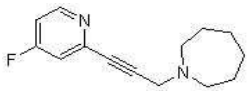
Phenomenex Luna C18 200*40mm*10μm; 이동상: [물(FA)-ACN];B%: 1%-25%,8분)로 정제했다. 표제 화합물(18.1 mg, 13.5% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR: (400 MHz, MeOD) δ 8.48 - 8.41 (m, 1 H) 8.10 - 8.05 (m, 1 H) 7.83 - 7.78 (m, 1 H) 7.57 (s, 1 H) 7.30 - 7.25 (m, 1 H) 7.09 - 7.06 (m, 1 H) 6.96 (s, 2 H) 6.92 - 6.88 (m, 1 H) 3.93 (s, 2 H) 3.58 - 3.50 (m, 4 H) 3.24 - 3.18 (m, 4 H) 3.15 - 3.09 (m, 4 H) 1.90 - 1.81 (m, 8 H) 1.79 - 1.70 (m, 8 H). LCMS (ESI): *m/z* 552.2 $(M+H)^+$.

[2498] **실시예 17 화합물 250**



[2499]

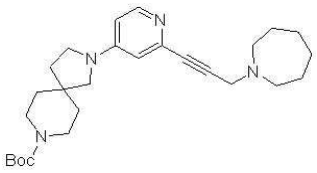
[2500] **단계 1: 1-(3-(4-플루오로피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)아제판**



[2501]

[2502] THF(35.0 mL) 중 2-브로모-4-플루오로피리딘(5.00 g, 28.4 mmol, 1.00 eq) and 1-(프로프-2-인-1-일)아제판(5.07 g, 36.9 mmol, 1.30 eq)의 용액에 $Pd(PPh_3)_2Cl_2$(598 mg, 852 μmol, 0.03 eq) 및 CuI(541 mg, 2.84 mmol, 0.10 eq) 및 TEA(4.31 g, 42.6 mmol, 5.93 mL, 1.50 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 80 ℃에서 6 시간 동안 N_2하에 교반했다. TLC(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 3/1, 생성물: R_f = 0.08)는 2-브로모-4-플루오로피리딘이 완전히 소비되었음을 나타냈다. 반응 혼합물을 25℃에서 H_2O 40 mL의 첨가에 의해 퀀칭한 다음, EtOAc(50 mL × 2)로 추출했다. 조합된 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 석유 에테르/에틸 아세테이트 = 10/1 to 1/1)로 정제하여 표제 화합물(2.00 g, 8.61 mmol, 30.3% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

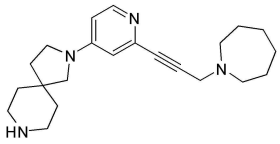
[2503] **단계 2: tert-부틸 2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-카르복실레이트**



[2504]

[2505] DMF(20 mL) 중 1-(3-(4-플루오로피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일)아제판(1.88 g, 8.09 mmol, 1.00 eq), tert-부틸 2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-카르복실레이트(2.14 g, 8.90 mmol, 1.10 eq) 및 Cs_2CO_3(7.91 g, 24.3 mmol, 3.00 eq)의 혼합물을 100 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄/ 메탄올 = 10/1, 생성물: R_f = 0.24)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 물 20mL로 희석하고 EtOAc(20mL × 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO2, 석유 에테르/에틸 아세테이트 = 20/1 내지 2/1)로 정제하여 표제 화합물(2.73 g, 6.03 mmol, 74.5% 수율)을 갈색 액체로 얻었다. ^{1}H NMR: ($CDCl_3$, 400 MHz) δ 8.16-8.15 (d, 1 H), 6.54-6.54 (d, 1 H), 6.30-6.29 (m, 1 H), 3.60 (s, 2 H), 3.51-3.46 (m, 2 H), 3.41-3.35 (m, 4 H), 3.17 (s, 2 H), 3.88-3.81 (m, 4 H), 1.93-1.90 (t, 2 H), 1.72-1.70 (m, 4 H), 1.63-1.61 (m, 4 H), 1.58-1.55 (m, 4 H), 1.46 (s, 9 H)

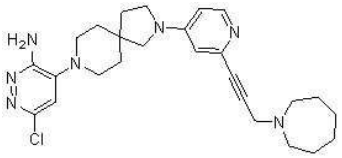
[2506] **단계 3: 2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸**



[2507]

[2508] EtOAc(19.1 mL) 중 tert-부틸 2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-카르복실레이트(2.73 g, 6.03 mmol, 1.00 eq)의 용액에 HCl/EtOAc(4 M, 13.6 mL, 9.05 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄/ 메탄올 = 10/1, 생성물: R_f = 0.10)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 여과하여 침전물을 수집한 다음, 침전물을 물에 용해하고 동결 건조하여 잔류물을 얻었다. 표제 화합물(1.96 g, 5.04 mmol, 83.6% 수율, HCl)을 갈색 고체로 얻었다.

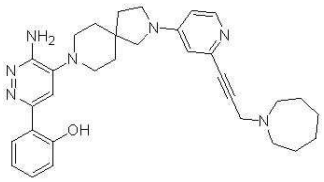
[2509] **단계 4: 4-(2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일)-6-클로로피리다진-3-아민**



[2510]

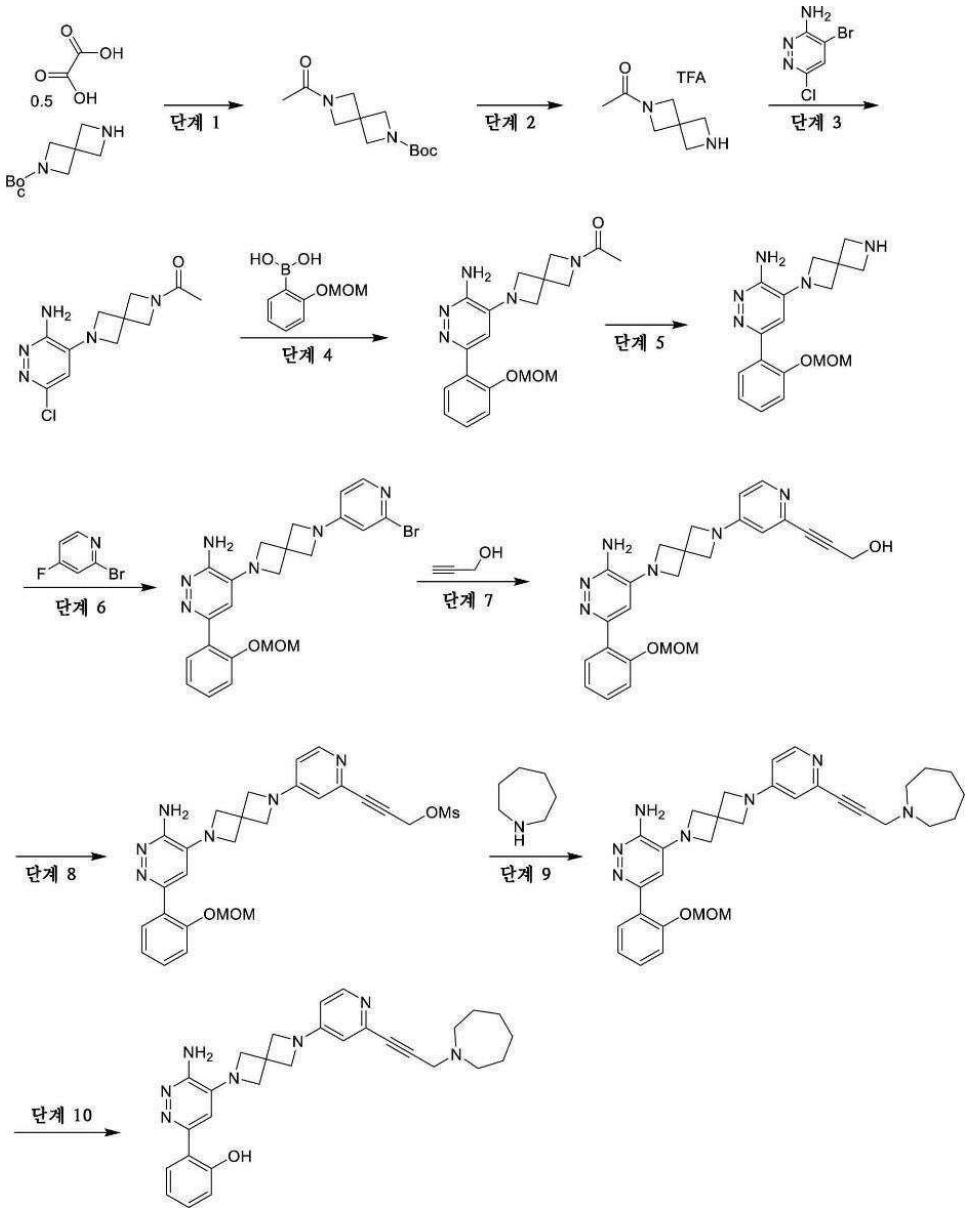
[2511] DMSO(10 mL) 중 2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸 (740 mg, 1.90 mmol, 1.00 eq, HCl) 및 4-브로모-6-클로로피리다진-3-아민(396 mg, 1.90 mmol, 1.00 eq)의 용액에 DIEA(983 mg, 7.61 mmol, 1.33 mL, 4.00 eq) 및 CsF(866 mg, 5.71 mmol, 210 μL, 3.00 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 120 ℃에서 1.5 시간 동안 교반했다. LCMS는 반응이 완료되었음을 나타냈다. 반응 혼합물을 여과하여 여액을 수집한 다음, 여액을 H_2O 100 mL로 희석하고 EtOAc(50 mL × 6)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수(100 mL)로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 석유 에테르/에틸 아세테이트 = 20/1 내지 2/1)로 정제하여 표제 화합물(402 mg, 837 μmol, 44.0% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR: ($CDCl_3$, 400 MHz) δ 8.18-8.16 (d, 1 H), 6.77 (s, 1 H), 6.57-6.56 (d, 1 H), 6.33-6.30 (m, 1 H), 5.06 (s, 2 H), 3.65 (s, 2 H), 3.46-3.43 (m, 2 H), 3.24 (m, 2 H), 3.14-3.10 (m, 2 H), 3.05-3.00 (m, 2 H), 2.85-2.823 (m, 4 H), 2.01-1.97 (m, 2 H), 1.82-1.80 (m, 4 H), 1.73-1.71 (m, 4 H), 1.64-1.61(m, 4 H).

[2512] **단계 5: 2-(6-아미노-5-(2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일)피리다진-3-일)페놀**

[2513] 

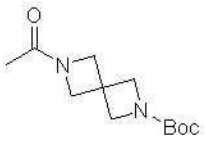
[2514] 디옥산(4 mL) 중 4-(2-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,8-디아자스피로[4.5]데칸-8-일)-6-클로로피리다진-3-아민(100 mg, 208 μmol, 1.00 eq), (2-히드록시페닐)보론산(43.1 mg, 312 μmol, 1.50 eq)의 용액에 H_2O(0.80 mL) 중 Na_2CO_3(66.2 mg, 624 μmol, 3.00 eq)의 용액을 첨가한 다음, [2-(2-아미노페닐)페닐]-클로로-팔라듐;비스(1-아다만틸)-부틸-포스판 (1375477-29-4)(13.9 mg, 20.8 μmol, 0.10 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 탈기하고 N_2로 3 회 퍼징한 다음, 혼합물을 100 ℃에서 4 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. LCMS는 반응이 완료되었음을 나타냈다. 반응 혼합물을 여과하여 여액을 수집한 다음, 여액을 EtOAc(50 mL)로 희석하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼: Phenomenex Luna C18 200*40mm*10μm; 이동상: [물(FA)-ACN];B%: 1%-25%,8분)로 정제했다. 표제 화합물(13.5 mg, 25.1 μmol, 12.0% 수율)을 밝은 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR: ($CDCl_3$, 400 MHz) δ 8.20-8.18 (d, 1 H), 7.62-7.60 (d, 1 H), 7.38 (s, 1 H), 7.32-7.30 (m, 1 H), 7.08-7.06 (d, 1 H), 6.93-6.89 (t, 1 H), 6.60 (s, 1 H), 6.36-6.35 (m, 1 H), 4.86 (s, 2 H), 3.65 (s, 2 H), 3.40-3.37 (t, 2 H), 3.21 (s, 2 H), 3.16-3.13 (m, 2 H), 3.05-3.02 (m, 2 H), 2.86-2.84 (m, 4 H), 1.98-1.94 (t, 2 H), 1.82-1.76 (m, 4 H), 1.75-1.66 (m, 4 H), 1.63-1.52 (m, 4 H). LCMS (ESI): m/z 538.4 $(M+H)^+$.

[2515] **실시예 18 화합물 251**



[2516]

[2517] **단계 1: tert-부틸 6-아세틸-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-카르복실레이트**

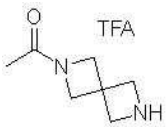


[2518]

[2519] DCM(350 mL) 중 tert-부틸 2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-카르복실레이트(53.8 g, 22 mmol, 0.5OXALIC ACID)의 용액에 Ac_2O(56.4 g, 553 mmol, 51.8 mL) 및 NMM(111 g, 1.11 mol, 121 mL)을 0℃에서 첨가했다. 이후 혼합물을 40 ℃에서 12 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄 / 메탄올 = 10/1, 생성물 R_f = 0.2)는 반응물 1이 완전히 소비되었고 새로운 스팟이 검출되었음을 보여주었다. LCMS(ET43580-132-P1A1, 생성물 RT = 0.595 분)는 반응물 1이 완전히 소비되었고 원하는 MS를 갖는 새로운 피크가 검출되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 교반하며 얼음물(250 mL)로 세척한 다음, DCM(150 mL x 5)으로 추출했다. 조합된 유기상을 염수(100 mL)로 세척하고 Na_2SO_4로 건조했다. 여과하고 여액을 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 디클로로메탄 / 메탄올(100/1에서 5/1)로 용리하는 실리카 겔상의 플래시 크로마토그래피로 정제했다. 표제 화합물(51.0 g, 212 mmol, 95.8% 수율)을 황색 오일로 얻었다. ^{1}H NMR: ($CDCl_3$, 400 MHz) δ4.04-4.21 (m, 8 H), 1.84 (s, 3

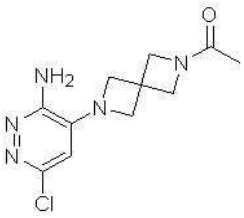
H), 1.41 (s, 9 H).

[2520] **단계 2: 1-(2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온**

[2521] 

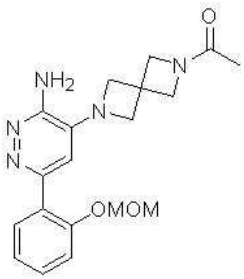
[2522] DCM(350 mL) 중 tert-부틸 6-아세틸-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-카르복실레이트(70.0 g, 291 mmol)의 용액에 TFA(323 g, 2.84 mol, 210 mL)를 첨가했다. 이후 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 다음 단계에서 정제 없이 직접 사용할 것이었다. 표제 화합물(74.0 g, 미정제, TFA)을 황색 오일로 얻었다.

[2523] **단계 3: 1-(6-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온**

[2524] 

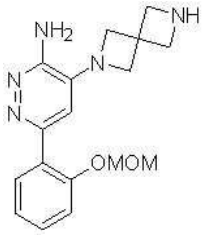
[2525] DMSO(222 mL) 중 1-(2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온(37.0 g, 145 mmol, TFA)의 용액에 CSF(66.3 g, 436 mmol, 16.1 mL), DIEA(56.4 g, 436 mmol, 76.0 mL) 및 4-브로모-6-클로로-피리다진-3-아민(24.2 g, 116 mmol)을 25℃에서 첨가했다. 이후 혼합물을 80 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 여과하고 필터 케이크를 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 다음 단계에서 정제 없이 직접 사용할 것이었다. 표제 화합물(72.0 g, 268 mmol, 92.3% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

[2526] **단계 4: 1-(6-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온**

[2527] 

[2528] 디옥산(300 mL) 및 H_2O(60.0 g, 3.33 mol, 60.0 mL) 중 1-(6-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온(50.0 g, 186 mmol) 및 2-(메톡시메톡시)페닐]보론산(50.9 g, 280 mmol)의 용액에 K_2CO_3(51.6 g, 373 mmol)에 이어서 $Pd(PPh_3)_4$(4.32 g, 3.74 mmol)를 25℃에서 N_2하에 첨가했다. 이후 혼합물을 N_2로 3 회 탈기하고, 90℃로 가열하고 16 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 교반하며 생성물에 물(300 mL)을 첨가한 다음, DCM(300 mL x 4, 100 mL x 2)으로 추출했다. 조합된 유기상을 염수(150 mL)로 세척하고 Na_2SO_4로 건조했다. 여과하고 여액을 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 MTBE(300 mL)로 25℃에서 30 분 동안 트리터레이션했다. 표제 화합물(48.0 g, 129 mmol, 69.5% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

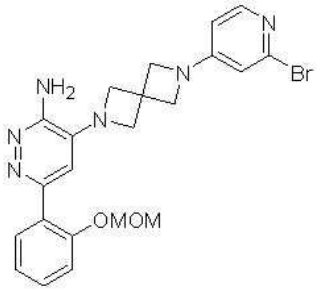
[2529] **단계 5: 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)피리다진-3-아민**



[2530]

[2531] MeOH(250 mL) 중 1-(6-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)에탄-1-온(48.0 g, 129 mmol)의 용액에 NaOH(4 M, 150 mL)를 첨가했다. 이후 혼합물을 50 ℃에서 4 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 25℃로 냉각하고 포화 시트르산 수용액을 첨가하여 pH = 7로 만든다. 미정제 생성물을 역상 HPLC(0.1% NH_4HCO_3 조건)로 정제했다. 표제 화합물(41.0 g, 125 mmol, 96.3% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

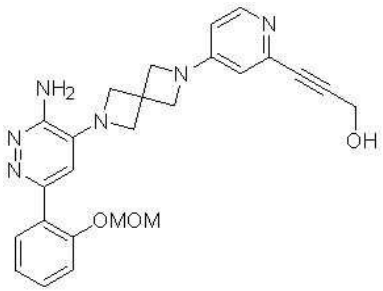
[2532] **단계 6: 4-(6-(2-브로모피리딘-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2533]

[2534] DMSO(240 mL) 중 6-(2-(메톡시메톡시)페닐)-4-(2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)피리다진-3-아민(41.0 g, 125 mmol)의 용액에 DIEA(48.5 g, 375 mmol, 65.4 mL), 2-브로모-4-플루오로-피리딘(24.2 g, 137 mmol)을 25℃에서 첨가하고, 혼합물을 130℃로 가온했다. 이후 혼합물을 130 ℃에서 4 시간 동안 교반했다. TLC(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 0/1, 생성물 Rf = 0.4)는 반응물 1이 완전히 소비되었고 새로운 스팟이 검출되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 교반하면서 얼음물(1.00 L)에 부은 다음 여과하고 필터 케이크를 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 MTBE(250 mL)로 25℃에서 30 분 동안 트리터레이션했다. 표제 화합물(50.0 g, 103 mmol, 82.6% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

[2535] **단계 7: 3-(4-(6-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-올**

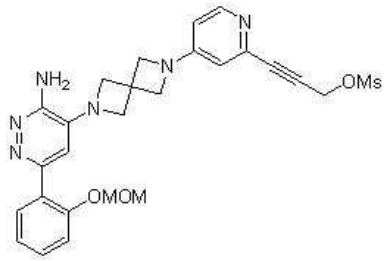


[2536]

[2537] DMF(300 mL) 중 4-(6-(2-브로모피리딘-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민(50.0 g, 103 mmol)의 용액에 Et_3N(31.4 g, 310 mmol, 43.1 mL), CuI(985 mg, 5.17 mmol), PPh_3(5.43 g, 20.6 mmol), $Pd(PPh_3)_4$(5.98 g, 5.17 mmol) 및 프로프-2-인-1-올(33.8 g, 604 mmol, 35.7 mL)을 N_2하에 20℃에서 첨가한 다음, 혼합물을 50℃에서 2 시간 동안 교반했다. 잔류물을 물(1.50 L)에 부었다. 수성상을 DCM(800 mL × 5, 300 mL × 3)으로 추출했다. 조합된 유기상을 염수(300 mL x 3)로 세척하고, 무수 Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 진공에서 농축했다. 미정제 생성물을 디클로로메탄 / 메탄올(100/1에서 5/1)로 용리하는 실리카 겔상의 플래시 크로마토그래피로 정제했다. 표제 화합물(15.0 g, 32.3 mmol, 31.3% 수율, 98.9%

순도)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.07 (d, *J* = 5.6 Hz, 1 H), 7.60 (d, *J* = 7.6 Hz, 1 H), 7.18-7.33 (m, 1 H), 7.18 (s, 1 H), 7.16-7.18 (m, 1 H), 6.69 (s, 1 H), 6.47 (s, 1 H), 6.33-6.35 (m, 1 H), 5.65 (s, 2 H), 5.36-5.39 (m, 1 H), 5.20 (s, 2 H), 4.28 (d, *J* = 5.6 Hz, 2 H), 4.18 (s, 4 H), 4.09 (s, 4 H), 3.35 (s, 3 H).

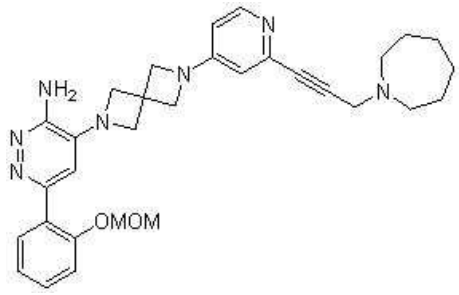
[2538] **단계 8: 3-(4-(6-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)피리딘-2-일)프로프-2-인-1-일 메탄설포네이트**



[2539]

[2540] DCM(3.00 mL) 중 3-[4-[2-[3-아미노-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-4-일]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-6-일]-2-피리딜]프로프-2-인-1-올(200 mg, 436 μmol, 1.00 eq)의 용액에 TEA(88.2 mg, 872 μmol, 121 μL, 2.00 eq) 및 MsCl(0.143 g, 1.25 mmol, 96.6 μL, 2.86 eq)을 0℃에서 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄 : 메탄올 = 10/1, R_f = 0.21)는 대부분의 반응물이 소비되었고 TLC에 따라 하나의 새로운 점이 검출되었음을 나타냈다. 반응 혼합물을 25 ℃에서 H_2O(20 mL)를 첨가하여 퀀칭한 다음, 여과하고, 여액을 DCM(20mL × 2)으로 추출했다. 조합된 유기층을 H_2O(20 mL × 2)로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 여과하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 표제 화합물(400 mg, 745 μmol, 56.9% 수율)을 갈색 고체로 얻었다.

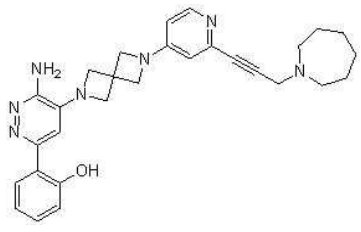
[2541] **단계 9: 4-(6-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2542]

[2543] MeCN(10.0 mL) 중 3-[4-[2-[3-아미노-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-4-일]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-6-일]-2-피리딜]프로프-2-이닐 메탄설포네이트(400 mg, 745 μmol, 1.00 eq)용액에 K_2CO_3(206 mg, 1.49 mmol, 2.00 eq) 및 아제판(0.48 g, 4.84 mmol, 545 μL, 6.49 eq)을 첨가했다. 혼합물을 80 ℃에서 6 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 여과하고 여액을 농축했다. 표제 화합물(160 mg, 미정제)을 갈색 검으로 얻었다.

[2544] **단계 10: 2-(6-아미노-5-(6-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일)피리다진-3-일)페놀**

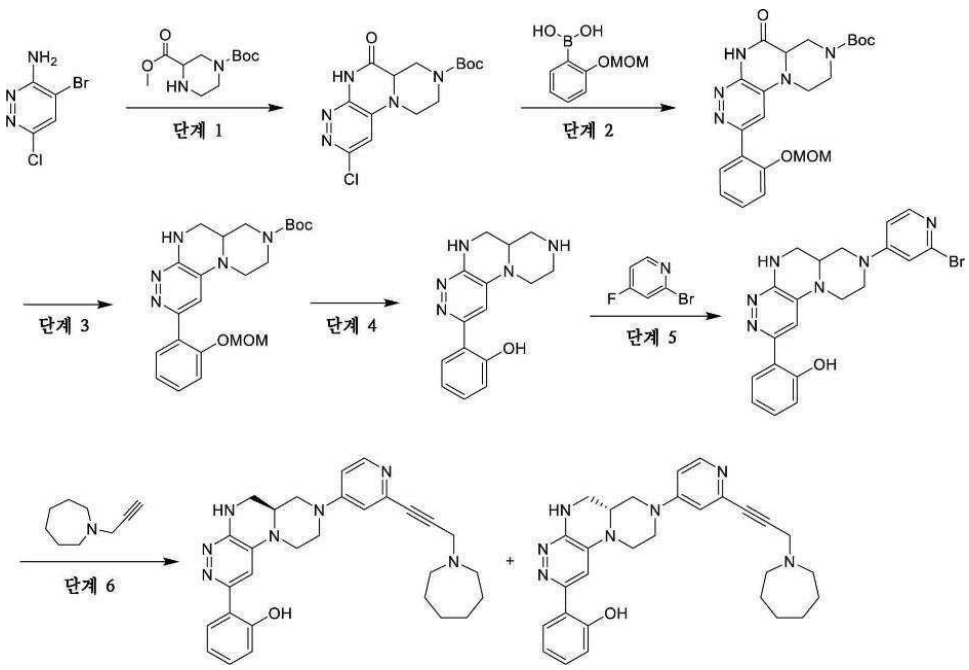


[2545]

[2546] MeCN(3.00 mL) 중 4-[6-[2-[3-(아제판-1-일)프로프-1-이닐]-4-피리딜]-2,6-디아자스피로[3.3]헵탄-2-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(140 mg, 259 μmol, 1.00 eq)의 용액에 스칸듐(3+);트리플루오로메탄설포

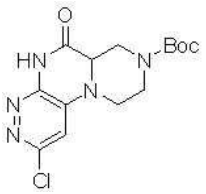
네이트(127 mg, 259 μmol, 1.00 eq) 및 EtOH(956 mg, 20.7 mmol, 80 eq)를 첨가했다.혼합물을 MW에서 120 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. 몇 가지의 새로운 피크가 LC-MS에 나타났고 원하는 화합물이 검출되었다. 반응 혼합물을 여과했다. 여액을 Pre-HPLC로 정제했다. 컬럼: Phenomenex Luna C18 75*30mm*3um;이동상: [물(FA)-ACN];B%:1%-20%,8분. 표제 화합물(6.00 mg, 11.9 μmol, 4.62% 수율, 99% 순도)을 갈색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, MeOD): δ 8.10 - 8.08 (d, 1H, *J* = 8.0 Hz), 7.73-7.71 (d, 1H, *J* = 8.0 Hz), 7.31-7.29 (t, 1H, *J* = 8.0 Hz), 6.96-6.92 (m, 3H), 6.66- 6.65 (d, 1H, *J* = 4.0 Hz), 6.50-6.48 (m, 1H),4.51 (s, 4H), 4.31 (s, 4H), 4.04 (s, 2H), 3.21-3.18 (m, 4H,), 1.86 (m, 4H), 1.74 (m, 4H). LCMS (ESI): *m/z* 496.1 $(M+H)^+$.

[2547] **실시예 19 및 20 화합물 252 및 253**



[2548]

[2549] 단계 1: tert-부틸 2-클로로-6-옥소-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트



[2550]

[2551] 디옥산(140 mL) 중 4-브로모-6-클로로피리다진-3-아민(25.0 g, 119 mmol, 1.00 eq) 및 1-(tert-부틸) 3-메틸 피페라진-1,3-디카르복실레이트(35.1 g, 143 mmol, 1.20 eq)의 혼합물에 N_2하에 t-BuOLi(1.00 M, 239 mL, 2.00 eq), XPhos(5.72 g, 11.9 mmol, 0.10 eq), RuPhos Pd G3(10.0 g, 11.9 mmol, 0.10 eq)을 첨가했다. 혼합물을 100 ℃에서 10 시간 동안 교반했다. TLC(에틸 아세테이트/석유 에테르 = 2/1, R_f = 0.39)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 진공에서 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, 에틸 아세테이트/MeOH = 100/1 내지 0/1)로 정제하여 표제 화합물(12.0 g, 35.3 mmol, 14.7% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 11.7 (s, 1H), 7.03 (s, 1H), 4.30 (br d, 1H, *J* = 11.0 Hz), 4.06 (dd, 1H, *J* = 3.6, 11.2 Hz), 4.00 - 3.80 (m, 2H), 3.10 - 2.80 (m, 3H), 1.50 - 1.30 (m, 9H)

[2552] **단계 2: tert-부틸 2-(2-(메톡시메톡시)페닐)-6-옥소-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트**



[2553]

[2554] 디옥산(20.0 mL) 및 H_2O(2.00 mL) 중 tert-부틸 2-클로로-6-옥소-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트(5.00 g, 14.7 mmol, 1.00 eq) 및 (2-(메톡시메톡시)페닐)보론산(3.21 g, 17.6 mmol, 1.20 eq)의 용액에. 이후 K_2CO_3(6.10 g, 44.5 mmol, 3.00 eq) 및 RuPhos Pd G3(1.23 g, 1.47 mmol, 0.10 eq)을 혼합물에 첨가했다. 반응 혼합물을 100 ℃에서 10 시간 동안 교반했다. TLC(에틸 아세테이트/석유 에테르 = 1/0, R_f = 0.48)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물에 물(10 mL)을 첨가했다. 수성상을 EtOAc(10.0 mL x 2)로 추출했다. 조합된 유기층을 염수(30.0 mL)로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 진공에서 농축했다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, EtOAc/MeOH = 80/1 내지 0/1)로 정제하여 표제 화합물(2.50 g, 5.66 mmol, 38.4% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

[2555] **단계 3: tert-부틸 2-(2-(메톡시메톡시)페닐)-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트**



[2556]

[2557] THF(15.0 mL) 중 tert-부틸 2-(2-(메톡시메톡시)페닐)-6-옥소-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트(1.50 g, 3.40 mmol, 1.00 eq)의 용액에 BH_3-Me_2S(10.0 M, 1.70 mL, 5.00 eq)를 0 ℃에서 첨가했다. 이후 혼합물을 55 ℃에서 10 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄 /메탄올 = 10/1, R_f = 0.48)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 MeOH(25.0 mL)로 퀀칭하고 진공에서 농축하여 미정제 생성물을 얻었다. 미정제 생성물을 석유 에테르(10.0 mL)로 20 ℃에서 1 시간 동안 트리터레이션하여 표제 화합물(1.20 g, 미정제)을 회색 고체로 얻었다.

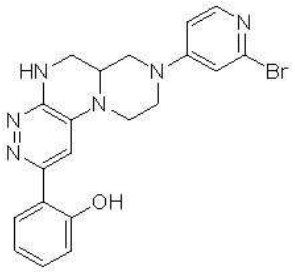
[2558] **단계 4: 2-(6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀**



[2559]

[2560] EtOAc(2.00 mL) 중 tert-부틸 2-(2-(메톡시메톡시)페닐)-5,6,6a,7,9,10-헥사히드로-8H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-8-카르복실레이트(900 mg, 2.11 mmol, 1 eq)의 용액에 HCl/EtOAc(4 M, 1 mL)를 첨가했다. 이후 혼합물을 25 ℃에서 1 시간 동안 교반했다. TLC(디클로로메탄 /메탄올 = 10/1, R_f = 0.01)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 여과하고 필터 케이크를 정제하지 않고 진공에서 농축하여 표제 화합물(300 mg, 미정제, HCl)을 회색 고체로 얻었다.

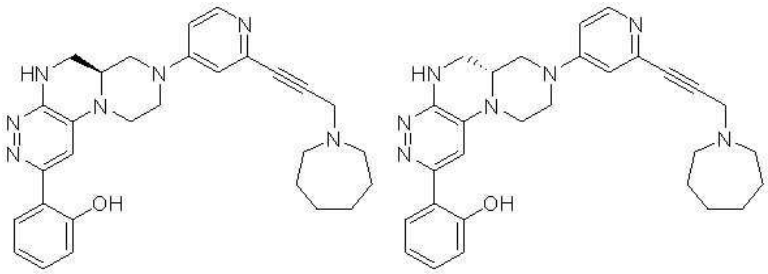
[2561] **단계 5: 2-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀**



[2562]

[2563] DMSO(10.0 mL) 중 2-(6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀(1.05 g, 3.28 mmol, 1.00 eq, HCl)의 용액에 DIEA(2.12 g, 16.4 mmol, 2.86 mL, 5.00 eq) 및 2-브로모-4-플루오로-피리딘(577 mg, 3.28 mmol, 1.00 eq)을 첨가했다. 이후 혼합물을 60 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 여과하고 여액을 수집했다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼: Welch Xtimate® C18 250*70mm*10 μm;이동상: [물(NH_4HCO_3)-ACN];B%: 30%-60%, 20분)로 정제하여 표제 화합물(300 mg, 682.89 μmol, 20.80% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 14.7 (br s, 1H), 8.00 - 7.90 (m, 2H), 7.39 (d, 1H, J = 3.1 Hz), 7.32 (s, 1H), 7.24-7.21 (m, 1H), 7.12 (s, 1H), 6.99 (dd, 1H, J = 2.3, 6.1 Hz), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 4.20 - 4.10 (m, 3H), 3.61 (td, 1H, J = 3.6, 11.7 Hz), 3.41 (br d, 1H, J = 2.9 Hz), 3.30 - 3.00 (m, 3H), 2.80 - 2.70 (m, 1H).

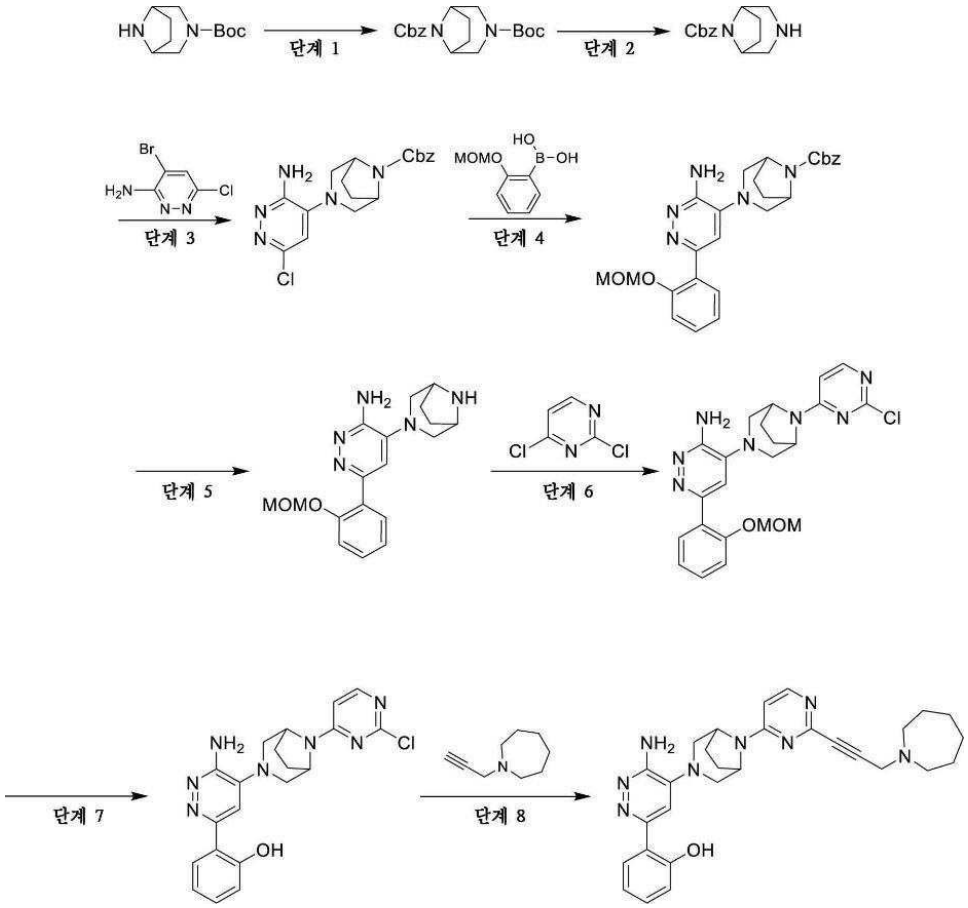
[2564] **단계 6: (*S*)-2-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀 및 (*R*)-2-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리딘-4-일)-6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀**



[2565]

[2566] DMF(2.00 mL) 중 2-(8-(2-브로모피리딘-4-일)-6,6a,7,8,9,10-헥사히드로-5H-피라지노[1',2':4,5]피라지노[2,3-c]피리다진-2-일)페놀(20.0 mg, 45.5 μmol, 1.00 eq)의 용액에 TEA(13.8 mg, 136 μmol, 19.0 μL, 3.00 eq), CuI(433 μg, 2.28 μmol, 0.05 eq), PPh_3(2.39 mg, 9.11 μmol, 0.20 eq), $Pd(PPh_3)_4$(2.63 mg, 2.28 μmol, 0.05 eq)를 N_2하에 첨가했다. 이후 1-프로프-2-이닐아제판(12.5 mg, 91.0 μmol, 2.00 eq)을 N_2하에 혼합물에 첨가했다. 반응 혼합물을 80 ℃에서 10 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 여과하고 여액을 진공에서 농축했다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼: Phenomenex luna C18 (250*70mm*15 μm);이동상: [물(HCl)-ACN];B%: 1%-22%,16분)로 정제하여 표제 화합물(50.0 mg, 93.9 μmol, 41.3% 수율, HCl)을 황색 고체로 얻었다. 거울상이성질체 혼합물을 prep-HPLC(컬럼: ChiralPak IH, 250*30mm, 10 μm; 이동상: [0.1%NH_3H_2O EtOH];B%:55%-55%,20분)로 정제하여 순수한 거울상이성질체를 얻었다. 피크 1 화합물 252: (10.8 mg, 21.7 μmol, 54.0% 수율) 회백색 고체. 피크 2 화합물 253: (4.61 mg, 9.30 μmol, 23.0% 수율) 회백색 고체. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 14.7 (s, 1H), 8.14 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.94 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.38 (d, J = 3.2 Hz, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.92 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 6.88-6.86 (m, 2H), 4.14 (q, J = 11.6 Hz, 3H), 3.63-3.60 (m, 1H), 3.56 (s, 2H), 3.40-3.19 (m, 2H), 3.10-3.04 (m, 2H), 2.69-2.60 (m, 5H), 1.70-1.50 (m, 8H). LCMS (ESI): m/z 496.2 $(M+H)^+$.

[2567] **실시예 21 화합물 245**



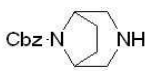
[2568]

[2569] **단계 1: 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트**

[2570] 

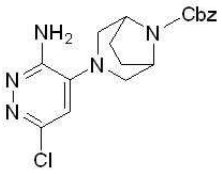
[2571] DCM(620 mL) 중 tert-부틸 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-카르복실레이트(125 g, 589 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, TEA(179 g, 1.77 mol, 246 mL, 3.00 eq) 및 CbzCl(151 g, 883 mmol, 126 mL, 1.50 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 25℃에서 3 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. TLC(석유 에테르: 에틸 아세테이트 = 3: 1)는 새로운 스팟(R_f = 0.37)이 형성되었음을 보여주었다. 용액을 물 50.0 mL로 세척하고, EtOAc 150×3 mL로 추출하고, 염수 50.0 mL로 세척하고 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 3: 1)로 정제하여 표제 화합물(89.0 g, 257 mmol, 43.6% 수율)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.38-7.34 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.30 (s, 2H), 3.87-3.70 (m, 2H), 3.03 (d, J = 28.8 Hz, 2H), 1.95 (s, 2H), 1.88 (d, J = 16.8 Hz, 2H), 1.45 (s, 9H).

[2572] **단계 2: 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**

[2573] 

[2574] EtOAc(150 mL) 중 8-벤질 3-(tert-부틸) 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3,8-디카르복실레이트(89.0 g, 257 mmol, 1.00 eq)의 용액에 HCl/EtOAc(4 M, 321 mL, 5.00 eq)를 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 3 시간 동안 교반했다. 용액을 감압하에 농축하여 대부분의 용매를 제거하고 여과하여 표제 화합물(59.0 g, 209 mmol, 81.2% 수율)을 미정제 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.32 (m, 5H), 5.15 (s, 2H), 4.44 (s, 2H), 3.20 (s, 4H), 2.32-2.27 (m, 2H), 2.16-2.00 (m, 2H).

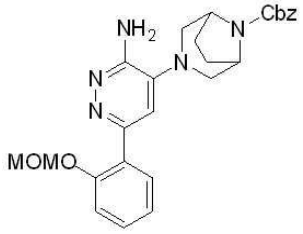
[2575] **단계 3: 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2576]

[2577] DMSO(410 mL) 중 벤질 3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(59.0 g, 209 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에, 4-브로모-6-클로로-피리다진-3-아민(45.7 g, 219 mmol, 1.05 eq), DIPEA(108 g, 835 mmol, 145 mL, 4.00 eq)을 첨가한 다음, 혼합물을 130℃에서 16 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 물 100 mL를 첨가하고, 동일한 생성물의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합하고, EtOAc 150 x 3 mL로 추출한 다음, 염수 20.0 mL로 세척하고, 감압하에 농축하여 표제 화합물(200 g, 미정제)을 백색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.39-7.27 (m, 5H), 6.70 (s, 1H), 5.17 (s, 2H), 5.10 (s, 2H), 4.46 (s, 2H), 3.25 (d, J = 9.6 Hz, 2H), 2.89 (d, J = 33.6 Hz, 2H), 2.08-2.05 (m, 2H), 1.95-1.91 (m, 2H).

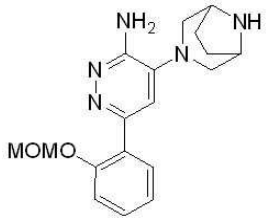
[2578] **단계 4: 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트**



[2579]

[2580] 디옥산(800 mL) 및 H_2O(150 mL) 중 벤질 3-(3-아미노-6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(100 g, 268 mmol, 1.00 eq)의 혼합물에 (2-(메톡시메톡시)페닐)보론산(73.0 g, 401 mmol, 1.50 eq), $Pd(PPh_3)_4$(30.9 g, 26.8 mmol, 0.100 eq) 및 K_2CO_3(73.9 g, 534 mmol, 2.00 eq)를 첨가한 다음, 혼합물을 100℃에서 2 시간 동안 N_2 분위기하에 교반했다. 용액에 100 mL 물을 첨가하고 동일한 반응의 또 다른 미정제 반응 혼합물과 조합했다. 혼합물을 EtOAc 200 mL × 3으로 추출하고, 유기물을 염수 100 mL로 세척하고, Na_2SO_4로 건조하고, 감압하에 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(석유 에테르/에틸 아세테이트 = 0: 1)로 정제하여 표제 화합물(182 g, 조합 수율: 71.7%)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 7.68 (d, J =1.2 Hz, 1H), 7.66-7.25 (m, 6H), 7.17 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.11-7.10 (m, 1H), 7.04 (s, 1H), 5.08 (s, 2H), 5.06 (s, 2H), 4.92 (s, 2H), 4.39 (s, 2H), 3.32 (s, 3H), 3.17 (d, J = 10.0 Hz, 2H), 2.83 (d, J = 46.8 Hz, 2H), 1.92-2.15 (m, 4H).

[2581] **단계 5: 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**

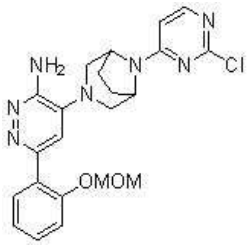


[2582]

[2583] MeOH(1.27 L) 중 벤질 3-(3-아미노-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-8-카르복실레이트(182 g, 383 mmol, 1.00 eq)의 용액에 $Pd(OH)_2$/C(53.8 g, 38.3 mmol, 10.0% 순도, 0.100 eq)를 N_2 분위기하에 첨가했다. 현탁액을 탈기하고 H_2로 3 회 퍼징했다. 혼합물을 H_2하에 35℃에서 16 시간 동안 교반했다. 용액을 여과하고 여액을 감압하에 농축하여 표제 화합물(100 g, 미정제)을 갈색 고체로 얻었다.

[2584] 단계 6: 4-(8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2- (메톡시메톡시)페닐)피리다

진-3-아민



[2585]

[2586] EtOH(2 mL) 중 2,4-디클로로피리미딘(40.0 mg, 268.5 μmol, 1.0 eq)의 용액에 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(100.8 mg, 295.3 μmol, 1.1 eq) 및 DIEA(93.53 uL, 537.0 μmol, 2.0 eq)을 25 ℃에서 첨가했다. 혼합물을 25 ℃에서 2 시간 동안 교반했다. TLC(DCM /MeOH = 10/1, R_f = 0.7)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 진공에서 농축하여 잔류물을 얻었다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, DCM/MeOH = 100/1 내지 10/1)로 정제하여 표제 화합물(70 mg, 154.2 μmol, 57.4% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.08 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 7.58 (dd, J = 7.6, 1.6 Hz, 1 H), 7.38 - 7.31 (m, 1 H), 7.20 (s, 1 H), 7.16 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 7.07 (t, J = 7.6 Hz, 1 H), 6.82 (d, J = 6.0 Hz, 1 H), 5.76 (d, J = 6.4 Hz, 2 H), 5.16 (s, 2 H), 4.96 - 4.45 (m, 2 H), 3.31 - 3.28 (m, 2 H), 3.27 (s, 3 H), 2.91 - 2.72 (m, 2 H), 2.21 (m, 2 H), 1.96 - 1.94 (m, 2 H).

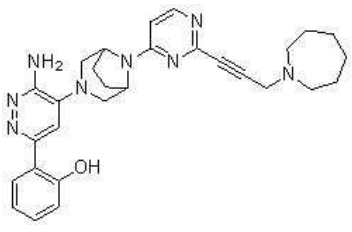
[2587] **단계 7: 2-(6-아미노-5-(8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2588]

[2589] 디옥산(5 mL) 중 4-[8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(70.0 mg, 154.2 μmol, 1.00 eq)의 용액에 디옥산(5 mL) 중 4M HCl(0.4 mL, 1.6 mmol, 10 eq)을 첨가했다. 반응 혼합물을 25 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. TLC(DCM/MeOH = 10/1, R_f = 0.5)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 혼합물을 진공에서 농축하여 표제 화합물(60 mg, 146.4 μmol, 94.9% 수율)을 황색 고체로 얻었다. 미정제 생성물을 추가의 정제 없이 다음 단계에서 직접 사용했다.

[2590] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(2-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**

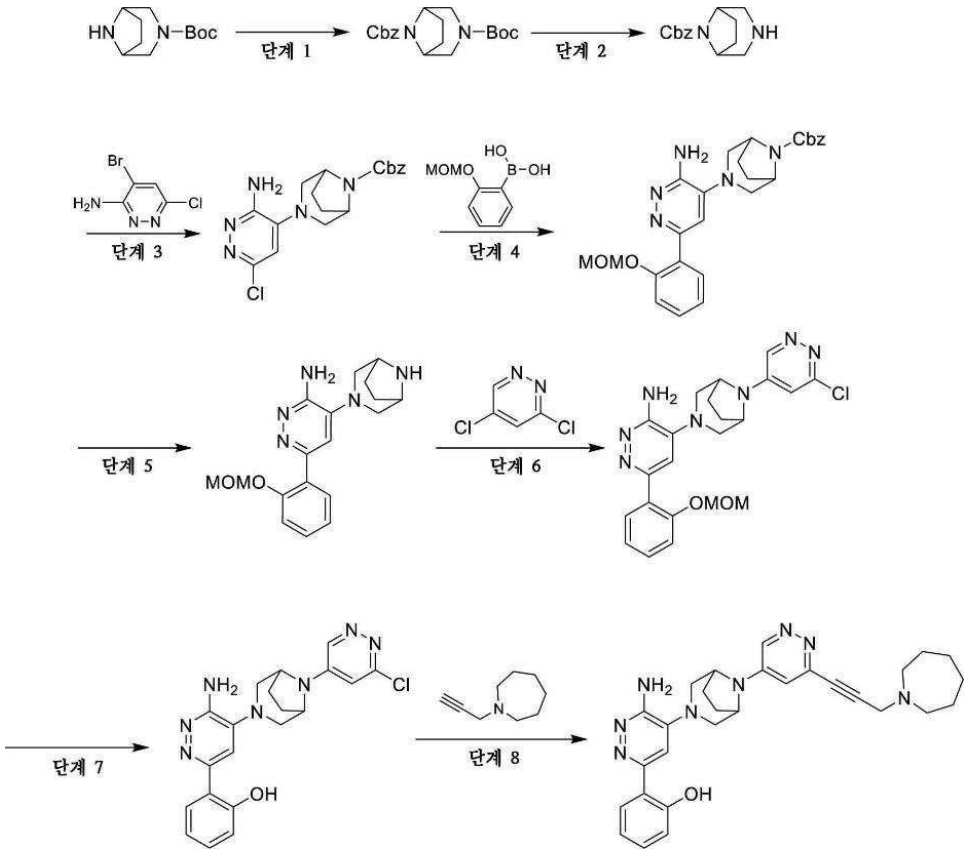


[2591]

[2592] DMF(5 mL) 중 1-프로프-2-이닐아제판(50.2 mg, 366.0 μmol, 5.00 eq) 및 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(ii)디클로라이드(5.1 mg, 7.3 μmol, 0.10 eq)의 용액에 PPh_3(3.8 mg, 14.6 μmol, 0.20 eq), CuI(1.4 mg, 14.6 μmol, 0.10 eq), Et_3N (0.03 mL, 219.6 μmol, 3.00 eq) 및 2-[6-아미노-5-[8-(2-클로로피리미딘-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀(30.0 mg, 73.2 μmol, 1.00 eq)을 첨가했다. 이후 반응물을 50 ℃에서 6 시간 동안 교반했다. TLC(DCM /MeOH = 10/1, R_f = 0.3)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 여과하고 여액을 수집했다. 잔류물을 prep-HPLC(컬럼: WelchXtimate C18 150*30mm*5um; 이동상: [물

(FA)-ACN])로 정제하여 표제 화합물(9.9 mg, 18.2 μmol, 24.9% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.22 (s, 1 H), 7.55 (d, *J* = 8.0 Hz, 1 H), 7.29 - 7.26 (m, 2 H) 7.03 (d, *J* = 8.4 Hz, 1 H), 6.88 (t, *J* = 7.2 Hz, 1 H), 6.41 (d, *J* = 5.6 Hz, 1 H), 4.90 - 4.70 (m, 4 H), 3.72 (s, 2 H), 3.37 - 3.41 (m, 2 H), 3.17 - 3.00 (m, 2 H), 2.95 - 2.77 (m, 4 H), 2.26 - 2.00 (m, 4 H), 1.75 - 1.63 (m, 8 H). LCMS (ESI): *m/z* 511.1 $(M+H)^+$.

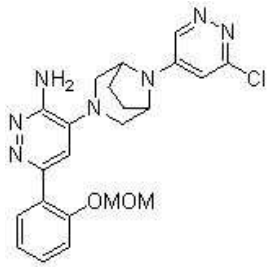
[2593] **실시예 22 화합물 246**



[2594]

[2595] **단계 1 내지 5:** 실시예 21에 기재된 것과 유사한 절차

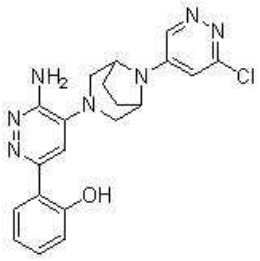
[2596] **단계 6: 4-(8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-(2-(메톡시메톡시)페닐)피리다진-3-아민**



[2597]

[2598] 에탄올(10 mL) 중 3,5-디클로로피리다진(327 mg, 2.2 mmol, 1.5 eq), 4-(3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(500 mg, 1.46 mmol, 1 eq) 및 트리에틸아민(0.82 mL, 5.86 mmol, 5 eq)의 혼합물을 탈기하고 N_2로 3 회 퍼징했다. 이후 혼합물을 90 ℃에서 5 시간 동안 교반했다. TLC(MeOH/DCM = 1/10, R_f = 0.5)는 반응이 완료되었음을 보여주었다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 생성물을 얻었고, 이를 컬럼 크로마토그래피(SiO_2, MeOH/DCM = 0 내지 3/100)로 정제하여 표제 화합물(350 mg, 0.77 mmol, 52.6% 수율)을 황색 고체로 얻었다.

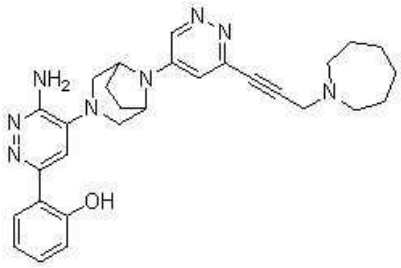
[2599] **단계 7: 2-(6-아미노-5-(8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2600]

[2601] 4-[8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]-6-[2-(메톡시메톡시)페닐]피리다진-3-아민(250.0 mg, 0.55 mmol, 1 eq)을 1,4-디옥산 중 4M HCl(10.0 mL, 40 mmol, 72.6 eq)에 25 ℃에서 용해했다. 반응 혼합물을 25 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. 반응 혼합물을 농축하여 미정제 표제 화합물(220 mg, 0.537 mmol, 97.5% 수율)을 황색 고체로 얻었다. 미정제 생성물을 추가의 정제 없이 다음 단계에서 직접 사용했다.

[2602] **단계 8: 2-(6-아미노-5-(8-(6-(3-(아제판-1-일)프로프-1-인-1-일)피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일)피리다진-3-일)페놀**



[2603]

[2604] DMF(1.5 mL) 중 트리에틸아민(0.34 mL, 2.44 mmol, 10 eq), 2-[6-아미노-5-[8-(6-클로로피리다진-4-일)-3,8-디아자비시클로[3.2.1]옥탄-3-일]피리다진-3-일]페놀(100.0 mg, 0.24 mmol, 1 eq), 트리페닐포스핀(12.8 mg, 0.05 mmol, 0.2 eq), 코퍼(I) 아이오다이드(4.6 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq), 비스(트리페닐포스핀)팔라듐(II)디클로라이드(17.1 mg, 0.020 mmol, 0.1 eq) 및 1-프로프-2-이닐아제판(167.4 mg, 1.22 mmol, 5 eq)의 용액을 80 ℃에서 16 시간 동안 교반했다. LCMS (5-95AB/1.5분): R_t =0.630 분, $[M+H]^+$ 511.1, 20.8%의 원하는 생성물을 나타냈다. 잔류물을 pre-HPLC(컬럼: Welch Xtimate C18 (150*30mm*5um); 이동상: [물(FA)-ACN]; B%: 3%-33%,7분)로 정제하여 표제 화합물(9.3 mg, 0.018 mmol, 7.2% 수율)을 황색 고체로 얻었다. ^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.90 (s, 1 H), 7.89 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.54 (s, 1 H), 7.22 (t, J = 7.6 Hz, 1 H), 7.08 (d, J = 2.4 Hz, 1 H), 6.93 - 6.80 (m, 2 H), 6.02 (s, 2 H), 4.72 (s, 2 H), 3.62 (s, 2 H), 3.25 (s, 2 H), 3.02 (d, J = 12.0 Hz, 2 H), 2.70 - 2.66 (m, 4 H), 2.23 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 2.02 - 1.93 (m, 2 H), 1.65 - 1.52 (m, 8 H). LCMS (ESI): m/z 511.1 $(M+H)^+$.

[2605] 아래 표 2는 일반적 합성 절차 A, 또는 B(반응식 2), 또는 C(반응식 3)에 따라 제조된 추가의 화합물을 보여준다. 표 2는 각 화합물을 제조하는 데 사용되는 경로의 목록을 제공한다.

[2606] 표 2

화합물 번호	일반적 합성 절차
1	A
2	실시예 1 참조
3	A
4	A
5	A
6	A
7	A
8	A
9	실시예 2 참조
10	A
11	A
12	A
13	A
14	A
15	A
16	A
17	A
18	A
19	실시예 3 참조
20	B
21	A
22	A
23	A
24	A
25	A
26	A
27	A
28	A
29	A
30	A
31	A
32	B
33	실시예 4 참조
34	A
35	A
36	A

[2607]

[2608]

화합물 번호	일반적 합성 절차
37	C
38	C
39	C
40	C
41	C
42	C
43	C
44	C
45	실시예 5 참조
46	C
47	C
48	C
49	C
50	C
51	C
52	C
53	C
54	C
55	C
56	C
57	C
58	실시예 6 참조
59	C
60	C
61	C
62	C
63	C
64	C
65	C
66	C
67	C
68	C
69	C
70	C
71	C
72	C
73	C

[2609]

화합물 번호	일반적 합성 절차
74	C
75	실시예 7 참조
76	C
77	C
78	C
79	C
80	C
81	C
82	C
83	C
84	C
85	C
86	C
87	C
88	C
89	C
90	C
91	C
92	C
93	C
94	C
95	C
96	C
97	C
98	C
99	C
100	C
101	C
102	C
103	C
104	C
105	실시예 8 참조
106	C
107	C
108	C
109	C
110	C

[2610]

화합물 번호	일반적 합성 절차
111	C
112	C
113	C
114	C
115	C
116	C
117	C
118	C
119	C
120	C
121	C
122	C
123	C
124	C
125	C
126	C
127	C
128	C
129	C
130	C
131	C
132	C
133	C
134	C
135	C
136	실시예 9 참조
137	C
138	C
139	C
140	C
141	C
142	C
143	C
144	C
145	C
146	C
147	C

[2611]

화합물 번호	일반적 합성 절차
148	C
149	C
150	C
151	C
152	C
153	C
154	C
155	C
156	C
157	C
158	C
159	C
160	C
161	C
162	실시예 10 참조
163	C
164	C
165	C
166	실시예 11 참조
167	C
168	C
169	C
170	C
171	C
172	C
173	C
174	C
175	C
176	C
177	C
178	C
179	C
180	C
181	C
182	A
183	C
184	C

[2612]

화합물 번호	일반적 합성 절차
185	C
186	C
187	C
188	C
189	C
190	C
191	C
192	C
193	C
194	C
195	C
196	C
197	C
198	C
199	C
200	C
201	C
202	C
203	C
204	C
205	C
206	C
207	C
208	C
209	C
210	C
211	C
212	C
213	C
214	C
215	C
216	C
217	C
218	C
219	C
220	C
221	C

화합물 번호	일반적 합성 절차
222	A
223	C
224	C
225	C
226	C
227	C
228	C
229	C
230	C
231	C
232	C
233	C
234	C
235	C
236	C
237	C
238	C
239	C
240	C
241	C
242	C
243	C
244	C
245	실시예 21 참조
246	실시예 22 참조
247	실시예 14 참조
248	실시예 15 참조
249	실시예 16 참조
250	실시예 17 참조
251	실시예 18 참조
252	실시예 19 참조
253	실시예 20 참조

[2613]

[2614] 아래 표 3은 본원에 개시된 화합물의 ^{1}H NMR 및 LCMS 특징분석과 관련된 데이터를 보여준다. 표 3에서, "화합물 번호"는 표 1에서 사용된 것과 일치함에 유념하라; "N/A"는 데이터가 이용 불가함을 나타낸다.

[2615] 표 3

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
1	N/A	511.4
2	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.95 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 - 6.82 (m, 2H), 6.80 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (t, J = 3.4 Hz, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.26 (dd, J = 12.0, 2.3 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.62 (d, J = 6.0 Hz, 4H), 2.20 (q, J = 6.2, 5.7 Hz, 2H), 1.97 (dd, J = 8.0, 4.0 Hz, 2H), 1.79 - 1.68 (m, 4H).	482.3
3	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.94 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 - 6.82 (m, 2H), 6.80 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.43 (t, J = 5.4 Hz, 1H), 3.53 (s, 2H), 3.50 (q, J = 6.0 Hz, 2H), 3.27 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.55 - 2.50 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.19 (q, J = 6.1, 5.7 Hz, 2H), 1.97 (dd, J = 8.3, 4.0 Hz, 2H).	486.2
4	N/A	473.2
5	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (s, 1H), 8.09 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.3 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.25 - 7.20 (m, 1H), 6.94 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.89 - 6.78 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.62 (s, 2H), 3.27 (br d, J = 11.1 Hz, 2H), 3.01 (br d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.56 (q, J = 6.6 Hz, 4H), 2.23 - 2.16 (m, 2H), 2.00 - 1.93 (m, 2H), 1.0 (t, J = 7.2 Hz, 6H).	484.3
6	N/A	454.3
7	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.11 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 1H), 6.98 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.89 - 6.79 (m, 3H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.42 (dd, J = 8.2, 2.9 Hz, 1H), 3.78 (dt, J = 11.3, 3.4 Hz, 1H), 3.48 (ddd, J = 11.6, 6.9, 5.0 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 3.04 - 2.94 (m, 3H), 2.80 - 2.63 (m, 3H), 2.20 (q, J = 6.2, 5.8 Hz, 2H), 1.97 (dd, J = 8.1, 4.0 Hz, 2H).	484.3
8	N/A	482.3

[2616]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
9	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.33 (d, J = 7.2 Hz, 1 H), 7.49 - 7.61 (m, 3 H), 7.19 - 7.45 (m, 3 H), 6.94 - 7.16 (t, J = 7.2 Hz, 1 H), 4.99 (s, 1 H), 4.93 (s, 1 H), 4.35 (s, 4 H), 3.95 (s, 4 H), 3.62 (s, 2 H), 3.22 (s, 4 H), 2.25 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 2.02 (s, 2 H).	498.3
10	1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.98 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.89 - 6.84 (m, 2H), 6.81 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 4.42 (s, 2H), 3.38 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 3.30 - 3.22 (m, 4H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.93 (t, J = 5.5 Hz, 2H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.93 (m, 2H).	511.3
11	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.91 - 6.80 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 3.30 - 3.22 (m, 2H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.62 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.41 (t, J = 7.0 Hz, 2H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 1.96 (dd, J = 8.1, 4.1 Hz, 2H), 1.60 - 1.48 (m, 2H), 1.48 - 1.37 (m, 4H), 1.36 - 1.26 (m, 2H).	498.3
12	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.11 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.2, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.98 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.90 - 6.78 (m, 3H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 4.40 (s, 2H), 3.47 - 3.40 (m, 1H), 3.30 - 3.22 (m, 2H), 3.01 (d, J = 11.7 Hz, 2H), 2.72 (dt, J = 12.7, 4.1 Hz, 1H), 2.43 - 2.38 (m, 1H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.93 (m, 4H), 1.71 - 1.55 (m, 2H), 1.38 - 1.27 (m, 2H).	512.3
13	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.92 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (d, J = 4.4 Hz, 2H), 3.26 (dd, J = 11.8, 2.3 Hz, 2H), 2.98 (dd, J = 15.5, 10.7 Hz, 3H), 2.71 - 2.52 (m, 2H), 2.43 (dd, J = 8.2, 6.4 Hz, 2H), 2.18 (t, J = 6.5 Hz, 2H), 2.01 - 1.93 (m, 2H), 1.81 - 1.70 (m, 2H), 1.50 (s, 1H), 1.38 - 1.21 (m, 2H), 1.16 - 1.04 (m, 1H).	496.4

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
14	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.26 - 7.18 (m, 1H), 6.93 - 6.81 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 3.93 (dd, J = 7.5, 5.5 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 12.4 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 2.95 - 2.87 (m, 1H), 2.83 - 2.72 (m, 1H), 2.24 - 2.16 (m, 2H), 2.09 - 1.89 (m, 4H), 1.84 - 1.60 (m, 2H).	468.3
15	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.10 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.48 (d, J = 13.4 Hz, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.94 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.89 - 6.77 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.61 (s, 2H), 3.27 (d, J = 11.7 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.87 - 2.72 (m, 1H), 2.63 - 2.52 (m, 1H), 2.30 - 2.10 (m, 3H), 2.06 - 1.93 (m, 2H), 1.84 - 1.72 (m, 1H), 1.66 - 1.55 (m, 1H).	497.4
16	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.94 - 6.81 (m, 3H), 6.78 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 3.49 - 3.41 (m, 1H), 3.26 (d, J = 12.8 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.97 - 2.89 (m, 1H), 2.88 - 2.78 (m, 1H), 2.56 - 2.51 (m, 1H), 2.19 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.00 - 1.85 (m, 3H), 1.84 - 1.60 (m, 2H), 1.53 - 1.40 (m, 1H), 1.05 (t, J = 7.0 Hz, 1H).	482.3
17	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (s, 1H), 8.10 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.90 - 7.86 (m, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.21 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 6.98 - 6.74 (m, 4H), 5.98 (s, 2H), 4.61 - 4.45 (m, 2H), 3.53 - 3.42 (m, 1H), 3.30 - 3.22 (m, 2H), 3.01 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 2.43 - 2.30 (m, 1H), 2.18 (s, 2H), 2.00 - 1.94 (m, 4H).	454.3
18	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 13.95 (s, 1H), 8.18 (d, J = 6.8 Hz, 1H), 7.85 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.54 (s, 1H), 7.29 - 7.21 (m, 0H), 7.08 - 7.01 (m, 1H), 6.96 - 6.81 (m, 3H), 6.13 (s, 2H), 4.80 (s, 2H), 3.79 (s, 2H), 3.54 - 3.47 (m, 4H), 3.17 (t, J = 5.2 Hz, 4H), 3.04 (d, J = 8.0 Hz, 6H), 2.30 - 2.21 (m, 2H), 2.05 - 1.93 (m, 2H).	546.2

[2617]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
19	1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.92 - 6.80 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.26 (dd, J = 11.9, 2.3 Hz, 2H), 3.04 - 2.91 (m, 4H), 2.78 - 2.67 (m, 1H), 2.62 (ddd, J = 12.5, 9.8, 2.9 Hz, 2H), 2.24 - 2.13 (m, 2H), 2.00 - 1.92 (m, 2H), 1.82 (dq, J = 12.4, 3.9 Hz, 2H), 1.60 - 1.46 (m, 2H).	482.3
20	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.27 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.89 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.5, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.91 - 6.80 (m, 2H), 6.71 - 6.63 (m, 2H), 5.98 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.28 (dd, J = 12.0, 2.4 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.78 - 2.69 (m, 2H), 2.57 (dd, J = 8.8, 6.6 Hz, 2H), 2.24 - 2.11 (m, 2H), 1.96 (dd, J = 8.2, 4.0 Hz, 2H), 1.64 (p, J = 7.4, 6.7 Hz, 2H), 1.50 (q, J = 7.3 Hz, 2H), 1.37 - 1.27 (m, 4H).	543.4 (M+Na)
21	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.12 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 8.09 (s, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.5, 7.2, 1.5 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 - 6.77 (m, 3H), 5.98 (s, 2H), 4.59 (s, 2H), 3.87 (s, 3H), 3.28 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 3.03 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.25 - 2.15 (m, 2H), 2.02 - 1.95 (m, 2H).	479.3
22	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.91 (s, 1H), 6.89 - 6.81 (m, 2H), 6.78 (dd, J = 6.1, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.81 (dt, J = 11.5, 4.2 Hz, 2H), 3.44 (ddd, J = 11.8, 9.4, 2.7 Hz, 2H), 3.26 (d, J = 11.4 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.88 (tt, J = 9.1, 4.0 Hz, 1H), 2.19 (q, J = 6.2, 5.7 Hz, 2H), 2.00 - 1.93 (m, 2H), 1.88 - 1.79 (m, 2H), 1.60 (ddt, J = 13.9, 9.4, 4.7 Hz, 2H).	483.2
23	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.09 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.91 - 6.81 (m, 3H), 6.78 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.55 (s, 2H), 3.85 (q, J = 6.8 Hz, 1H), 3.26 (d, J = 12.4 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.19 (q, J = 6.1, 5.7 Hz, 2H), 2.01 - 1.91 (m, 2H), 1.31 (d, J = 6.7 Hz, 3H).	442.2

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
24	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.10 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 7.8, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.93 - 6.77 (m, 3H), 5.98 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 3.54 (s, 2H), 3.26 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.2 Hz, 2H), 2.25 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.94 (m, 2H).	428.2
25	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.02 (s, 1H), 9.68 (s, 1H), 7.87 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.53 (s, 1H), 7.23 (d, J = 7.7 Hz, 0H), 6.92 - 6.82 (m, 4H), 6.08 (s, 2H), 4.73 (s, 2H), 3.50 (s, 3H), 3.28 - 3.17 (m, 4H), 3.01 (d, J = 11.7 Hz, 2H), 2.27 - 2.21 (m, 2H), 2.01 - 1.97 (m, 4H).	468.2
26	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (s, 1H), 8.08 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.90 - 6.81 (m, 2H), 6.78 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.90 (t, J = 5.5 Hz, 1H), 4.57 (t, J = 3.7 Hz, 2H), 3.58 (td, J = 6.8, 5.5 Hz, 2H), 3.26 (dd, J = 12.0, 2.4 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.55 (t, J = 6.8 Hz, 2H), 2.24 - 2.11 (m, 2H), 1.96 (dd, J = 8.3, 4.1 Hz, 2H).	443.3
27	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.7 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.4, 7.1, 1.5 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 2.5 Hz, 1H), 6.90 - 6.82 (m, 2H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 4.42 (t, J = 5.2 Hz, 1H), 3.43 (q, J = 5.8 Hz, 2H), 3.26 (d, J = 10.7 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.46 - 2.38 (m, 2H), 2.24 - 2.13 (m, 2H), 2.00 - 1.93 (m, 2H), 1.63 - 1.52 (m, 4H).	471.2
28	N/A	497.3
29	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.90 - 6.81 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.55 (s, 2H), 3.26 (dd, J = 11.9, 2.3 Hz, 2H), 3.03 - 2.86 (m, 3H), 2.48 - 2.43 (m, 1H), 2.24 - 2.14 (m, 2H), 1.97 (dt, J = 22.0, 14.1 Hz, 6H), 1.46 (q, J = 12.4 Hz, 2H), 1.39 - 1.23 (m, 2H).	496.3

[2618]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
30	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.50 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.93 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.86 (dd, J = 8.3, 4.1 Hz, 2H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.56 (s, 2H), 3.26 (d, J = 12.0 Hz, 2H), 3.00 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.76 (s, 2H), 2.50 - 2.44 (m, 2H), 2.19 (q, J = 6.1 Hz, 2H), 1.96 (dd, J = 8.2, 4.1 Hz, 2H).	442.2
31	N/A	511.4
32	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (s, 1H), 8.07 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.94 - 7.84 (m, 2H), 7.50 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.5, 7.1, 1.6 Hz, 1H), 6.90 - 6.79 (m, 2H), 6.70 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.65 (dd, J = 5.8, 2.4 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.27 (d, J = 11.4 Hz, 3H), 3.17 - 3.07 (m, 4H), 3.03 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.58 (t, J = 7.5 Hz, 2H), 2.24 - 2.11 (m, 2H), 1.97 (dd, J = 8.0, 3.9 Hz, 2H), 1.79 (p, J = 7.2 Hz, 2H).	489.3
33	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.06 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.22 (ddd, J = 8.6, 7.2, 1.6 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 6.69 (s, 1H), 6.65 (dd, J = 5.8, 2.4 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.53 (s, 2H), 3.36 - 3.23 (m, 2H), 3.02 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 2.58 (t, J = 7.6 Hz, 3H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.91 (m, 2H), 1.72 (p, J = 7.2 Hz, 2H).	432.3
34	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.14 (s, 1H), 8.08 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.94 - 6.80 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.27 (d, J = 11.5 Hz, 2H), 3.07 - 2.96 (m, 3H), 2.91 (ddd, J = 10.8, 8.2, 5.3 Hz, 1H), 2.81 (dt, J = 10.8, 7.4 Hz, 1H), 2.59 (dd, J = 11.0, 6.3 Hz, 1H), 2.55 - 2.51 (m, 1H), 2.50 - 2.43 (m, 2H), 2.32 - 2.24 (m, 1H), 2.22 - 2.15 (m, 2H), 2.04 - 1.84 (m, 3H), 1.47 (ddd, J = 15.0, 12.8, 6.9 Hz, 1H).	482.3
35	N/A	539.4
36	N/A	456.3
37	N/A	526.2
38	N/A	537.3
39	N/A	536.3
40	N/A	511.3
41	N/A	540.3

[2619]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
42	N/A	526.3
43	N/A	518.3
44	N/A	538.3
45	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (br s, 1H), 8.09 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.25 Hz, 1H), 6.82-6.89 (m, 2H), 6.80 (dd, J=2.38, 6.00 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (br s, 2H), 4.42 (t, J=5.32 Hz, 1H), 3.46 (s, 2H), 3.27 (br s, 1H), 3.22-3.26 (m, 3H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.86 (br d, J=11.26 Hz, 2H), 2.07-2.23 (m, 4H), 1.90-2.01 (m, 2H), 1.67 (br d, J=11.01 Hz, 2H), 1.26-1.37 (m, 1H), 1.08-1.19 (m, 2H)	526.4
46	N/A	512.3
47	N/A	525.3
48	N/A	526.3
49	N/A	538.3
50	N/A	512.3
51	N/A	560.3
52	N/A	498.3
53	N/A	534.3
54	N/A	523.3
55	N/A	526.3
56	N/A	531.3
57	N/A	512.2
58	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.49 (br s, 1H), 8.11 (br d, J = 6.1 Hz, 1H), 7.75 (br d, J = 7.8 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.25 (br t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10 (s, 1H), 6.98 - 6.83 (m, 3H), 4.70 - 4.57 (m, 2H), 3.94 (s, 2H), 3.41 (br d, J = 11.2 Hz, 2H), 3.19 - 3.04 (m, 6H), 2.37 - 2.07 (m, 4H), 1.85 (br s, 4H), 1.80 - 1.62 (m, 4H)	510.2
59	N/A	526.3
60	N/A	536.3
61	N/A	510.3
62	N/A	512.3
63	N/A	522.2
64	N/A	526.3
65	N/A	512.3
66	N/A	538.4
67	N/A	537.3

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
68	N/A	494.3
69	N/A	524.3
70	N/A	512.3
71	N/A	512.3
72	N/A	534.3
73	N/A	524.3
74	N/A	510.3
75	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 8.09 (d, J=5.77 Hz, 1H), 7.88-7.94 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.77-6.90 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.50-3.59 (m, 2H), 3.27 (br s, 1H), 3.25 (br s, 1H), 3.00 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.80 (t, J=7.28 Hz, 1H), 2.57-2.68 (m, 2H), 2.12-2.24 (m, 4H), 1.90-2.01 (m, 3H), 1.23-1.33 (m, 1H), 0.99 (d, J=6.53 Hz, 3H)	496.3
76	N/A	524.3
77	N/A	538.3
78	N/A	538.4
79	N/A	526.3
80	N/A	567.3
81	N/A	524.3
82	N/A	538.3
83	N/A	554.3
84	N/A	544.3
85	N/A	569.4
86	N/A	494.3
87	N/A	494.3
88	N/A	538.3
89	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (br s, 1H), 8.10 (d, J=6.02 Hz, 1H), 7.89-7.95 (m, 2H), 7.52 (s, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 6.97 (d, J=2.01 Hz, 1H), 6.79-6.88 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.58 (br s, 2H), 3.73-3.85 (m, 2H), 3.47-3.63 (m, 3H), 3.27 (br d, J=11.80 Hz, 3H), 3.12 (dd, J=3.26, 10.04 Hz, 1H), 3.01 (br d, J=12.30 Hz, 2H), 2.82 (br d, J=11.54 Hz, 1H), 2.60 (d, J=4.77 Hz, 4H), 2.20 (br d, J=7.28 Hz, 2H), 1.93-2.01 (m, 2H)	555.3
90	N/A	538.4
91	N/A	508.3
92	N/A	538.4

[2620]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
93	N/A	522.4
94	N/A	522.4
95	N/A	518.3
96	N/A	553.4
97	N/A	526.3
98	N/A	524.3
99	N/A	522.4
100	N/A	538.3
101	N/A	538.4
102	N/A	522.4
103	N/A	538.4
104	N/A	524.4
105	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.07 (br s, 1H), 8.10 (d, J=6.02 Hz, 1H), 7.88-7.95 (m, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.25 (m, 1H), 6.96 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.76-6.90 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 5.68 (br s, 1H), 4.58 (br s, 2H), 3.49-3.63 (m, 2H), 3.28 (br s, 1H), 3.25 (br s, 1H), 2.93-3.05 (m, 3H), 2.72-2.77 (m, 2H), 2.65-2.69 (m, 1H), 2.19 (br d, J=7.28 Hz, 2H), 1.93-2.02 (m, 2H), 1.24-1.32 (m, 1H), 0.84 (t, J=4.39 Hz, 1H), 0.69 (dd, J=4.52, 8.78 Hz, 1H)	510.3
106	N/A	522.4
107	N/A	533.3
108	N/A	537.4
109	N/A	524.3
110	N/A	538.4
111	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (br s, 1H), 8.09 (d, J=6.02 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.78 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.01 Hz, 1H), 6.82-6.89 (m, 2H), 6.79 (dd, J=2.38, 5.90 Hz, 1H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.69-3.87 (m, 6H), 3.27 (br s, 1H), 3.24 (br s, 1H), 3.00 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.77 (br s, 2H), 2.28-2.36 (m, 1H), 2.19 (br d, J=7.03 Hz, 2H), 1.91-2.04 (m, 4H), 1.41-1.59 (m, 3H)	538.2
112	N/A	534.2
113	N/A	524.3
114	N/A	530.3
115	N/A	508.3

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
116	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (br s, 1H), 8.09 (d, J=6.02 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.78 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 6.93 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.57 (d, J=8.78 Hz, 4H), 3.26 (br d, J=11.04 Hz, 2H), 3.01 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.84 (s, 2H), 2.20 (br d, J=7.28 Hz, 2H), 1.81-2.03 (m, 3H), 1.58 (br s, 2H), 1.37-1.46 (m, 2H)	524.3
117	N/A	524.3
118	N/A	524.3
119	N/A	526.4
120	N/A	521.3
121	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.18 (br s, 1H), 8.09 (d, J=5.77 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.78 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.26 (m, 1H), 6.94 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.60 (s, 2H), 3.51 (br t, J=4.52 Hz, 2H), 3.35 (br s, 2H), 3.27 (br s, 1H), 3.25 (br s, 1H), 3.01 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.19 (br d, J=7.03 Hz, 2H), 1.93-2.02 (m, 2H), 1.54-1.77 (m, 4H), 1.25-1.37 (m, 4H)	538.4
122	N/A	539.4
123	N/A	520.2
124	N/A	524.3
125	N/A	522.4
126	N/A	524.4
127	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.11 (br s, 1H), 8.09 (d, J=5.60 Hz, 1H), 7.90 (d, J=6.80 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (t, J=6.8 Hz, 1H), 6.94 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 4.29 (s, 1H), 3.54 (s, 2H), 3.15-3.28 (m, 2H), 2.94-3.04 (m, 2H), 2.66 (t, J=7.03 Hz, 2H), 2.19 (br d, J=7.03 Hz, 2H), 1.92-2.01 (m, 2H), 1.65 (t, J=7.03 Hz, 2H), 1.46-1.61 (m, 10H)	536.4
128	N/A	512.4
129	N/A	522.4
130	N/A	524.3
131	N/A	514.3

[2621]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
132	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.21 (s, 1H), 8.09 (d, J=5.77 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.78 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 6.95 (d, J=2.26 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 4.37 (s, 1H), 3.82 (d, J=7.53 Hz, 1H), 3.53-3.64 (m, 3H), 3.52 (br d, J=1.76 Hz, 1H), 3.27 (br s, 1H), 3.24 (br s, 1H), 3.00 (br d, J=11.54 Hz, 2H), 2.80 (dd, J=1.38, 9.91 Hz, 1H), 2.53-2.58 (m, 1H), 2.19 (br d, J=7.28 Hz, 2H), 1.93-2.01 (m, 2H), 1.84 (br d, J=9.79 Hz, 1H), 1.58 (br d, J=9.79 Hz, 1H)	510.3
133	N/A	500.3
134	N/A	526.3
135	N/A	496.3
136	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.04 (br s, 1H), 8.10 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.91 (d, J=7.25 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (t, J=7.25 Hz, 1H), 6.95 (d, J=1.88 Hz, 1H), 6.77-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.50 (s, 2H), 3.26 (br d, J=11.2 Hz, 2H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.53 (m, 4H), 2.20 (br d, J=7.13 Hz, 2H), 1.86-2.07 (m, 2H), 1.22-1.51 (m, 4H), 0.25 (s, 4H)	522.4
137	N/A	524.4
138	N/A	510.4
139	N/A	521.3
140	N/A	538.3
141	N/A	508.3
142	N/A	584.3
143	N/A	544.3
144	N/A	556.3
145	N/A	538.3
146	N/A	523.3
147	N/A	553.4
148	N/A	551.3
149	N/A	520.3
150	N/A	508.4
151	N/A	530.3
152	N/A	507.3
153	N/A	522.3
154	N/A	524.4
155	N/A	522.4

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
156	N/A	537.4
157	N/A	538.3
158	N/A	532.4
159	N/A	538.3
160	N/A	540.4
161	N/A	510.3
162	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.12 (br s, 1H), 8.10 (d, J=5.88 Hz, 1H), 7.91 (d, J=6.88 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.19-7.25 (m, 1H), 6.95 (d, J=2.13 Hz, 1H), 6.78-6.89 (m, 3H), 5.99 (s, 2H), 4.57 (br s, 2H), 3.81-3.88 (m, 1H), 3.42 (s, 2H), 3.26 (br d, J=11.2 Hz, 2H), 3.01 (br d, J=11.51 Hz, 2H), 2.92 (dd, J=3.25, 7.63 Hz, 1H), 2.69-2.78 (m, 1H), 2.20 (br d, J=7.13 Hz, 2H), 1.91-2.07 (m, 4H), 1.70-1.79 (m, 1H), 1.61-1.70 (m, 2H), 1.36-1.49 (m, 1H), 1.13-1.25 (m, 1H)	508.4
163	N/A	539.4
164	N/A	523.3
165	N/A	537.4
166	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.06 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.73 (br d, J = 7.2 Hz, 1H), 7.48 (s, 1H), 7.23 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.89 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 6.81 (dd, J = 6.0, 2.4 Hz, 1H), 4.52 (br s, 2H), 3.50 (s, 2H), 3.36 (br d, J = 10.0 Hz, 2H), 2.26 - 2.23 (m, 2H), 2.16 - 2.13 (m, 2H), 1.68 - 1.63 (m, 4H), 1.50 - 1.49 (m, 2H)	496.2
167		524.4
168		484.3
169		512.4
170		512.5
171		516.3
172		482.4
173		500.4
174		498.4
175		538.3
176		526.2
177		604.2
178		524.2
179		574.5
180		496.5
181		546.4

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
182	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.11 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.54 - 7.60 (m, 2H), 7.50 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 7.41 - 7.47 (m, 1H), 7.15 (dd, J = 2.4, 7.2 Hz, 1H), 7.01 - 7.07 (m, 2H), 3.89 (d, J = 12.4 Hz, 2H), 3.62 (br s, 2H), 3.46 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 3.16 (t, J = 7.0 Hz, 3H), 3.05 (br s, 2H), 2.17 - 2.36 (m, 5H), 1.95 (br s, 5H), 1.85 (br s, 1H), 1.55 (br s, 1H)	510.3
183		630.2
184		482.3
185		524.2
186	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.07 (s, 1H), 8.11 (d, J = 5.8 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.28 - 7.18 (m, 1H), 6.97 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.92 - 6.77 (m, 3H), 5.98 (s, 2H), 4.58 (s, 2H), 3.54 - 3.37 (m, 3H), 3.28 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 3.25 (s, 7H), 3.21 - 3.06 (m, 1H), 3.02 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.04 - 1.89 (m, 3H), 1.88 - 1.77 (m, 1H)	512.4
187		496.3
188		553.2
189		546.3
190	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.10 (s, 1H), 8.09 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.91 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.27 - 7.18 (m, 1H), 6.93 (d, J = 2.4 Hz, 1H), 6.90 - 6.80 (m, 2H), 6.79 (dd, J = 6.0, 2.5 Hz, 1H), 5.98 (s, 2H), 4.57 (s, 2H), 3.67 (s, 1H), 3.55 (s, 2H), 3.26 (d, J = 11.8 Hz, 2H), 3.01 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.82 - 2.72 (m, 2H), 2.66 - 2.52 (m, 2H), 2.24 - 2.15 (m, 2H), 2.01 - 1.93 (m, 2H), 1.85 - 1.60 (m, 3H), 1.39 (ddt, J = 14.3, 7.0, 3.7 Hz, 1H), 0.99 - 0.87 (m, 4H).	540.3
191		526.3
192		524.3
193		528.3
194		528.2
195		538.3
196		540.5
197		554.3
198		538.3
199		564.3

[2622]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
200	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.07 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.23 (t, J = 7.6 Hz, 1H), 7.01 (d, J = 2.4, Hz, 1H), 6.92 - 6.84 (m, 2H), 6.82 (d, J = 4.0 Hz), 4.59 (br s, 2H), 3.66 (s, 2H), 3.37 (d, J = 10.4 Hz, 2H), 3.09 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.90 - 2.78 (m, 4H), 2.28 - 2.24 (m, 1H), 2.17 - 2.08 (m, 2H), 1.86 - 1.63 (m, 5H), 1.55 - 1.42 (m, 1H), 1.35 - 1.26 (m, 2H), 0.95 (d, J = 6.4 Hz, 3H).	524.4
201		524.3
202	1H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.04 (s, 1H), 8.05 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.1, 1.6 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.27 - 7.16 (m, 1H), 7.15 - 7.05 (m, 4H), 6.93 - 6.80 (m, 3H), 6.77 (dd, J = 6.0, 2.4 Hz, 1H), 5.97 (s, 2H), 4.54 (s, 2H), 3.64 (s, 2H), 3.24 (d, J = 11.9 Hz, 2H), 2.98 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.88 (dd, J = 6.6, 3.6 Hz, 4H), 2.67 (t, J = 4.4 Hz, 4H), 2.23 - 2.13 (m, 2H), 1.95 (dd, J = 8.0, 3.9 Hz, 2H).	558.5
203		548.3
204		588.3
205	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.06 (d, J = 6.0 Hz, 1H), 7.74 (d, J = 7.6 Hz, 1H), 7.49 (s, 1H), 7.24 (t, J = 6.3 Hz, 1H), 7.00 (d, J = 2.4, Hz, 1H), 6.91 - 6.85 (m, 2H), 6.81 (d, J= 4.0 Hz), 4.62 - 4.46 (m, 2H), 3.58 (s, 2H), 3.36 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 3.09 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.79 (t, J = 5.4 Hz, 2H), 2.73 (t, J = 5.2 Hz, 2H), 2.27 - 2.24 (m, 2H), 2.17 - 2.11 (m, 2H), 1.68 - 1.58 (m, 4H), 1.52 - 1.45 (m, 2H), 0.94 (s, 6H).	538.3
206		585.3
207		570.3
208		572.3
209		578.2
210		570.3
211		554.3
212		560.4
213		554.3
214		540.3
215		540.4
216		540.4
217		538.3

[2623]

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
218		536.3
219		540.3
220		534.2
221		522.2
222	^{1}H NMR (400 MHz, 메탄올-d_4) δ 8.11 (br s, 1H), 7.76 (d, J = 7.9 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.25 (t, J = 7.3 Hz, 1H), 7.03 (s, 1H), 6.97 - 6.80 (m, 3H), 4.62 (s, 2H), 3.43 - 3.37 (m, 2H), 3.31 - 3.25 (m, 4H), 3.14 - 3.07 (m, 2H), 2.93 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 2.30 (br d, J = 7.0 Hz, 2H), 2.25 - 2.11 (m, 2H), 1.91 (br s, 5H), 1.74 (br s, 5H)	524.3
223		504.4
224		512.4
225		526.4
226	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.07 (s, 1H), 8.10 (d, J = 5.9 Hz, 1H), 7.90 (dd, J = 8.0, 1.6 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.28 - 7.20 (m, 3H), 6.98 - 6.90 (m, 2H), 6.89 - 6.78 (m, 5H), 5.98 (s, 2H), 4.79 (p, J = 5.6 Hz, 1H), 4.56 (s, 2H), 3.76 (td, J = 6.1, 1.9 Hz, 2H), 3.56 (s, 2H), 3.30 - 3.21 (m, 4H), 3.01 (d, J = 11.6 Hz, 2H), 2.20 (q, J = 6.1, 5.6 Hz, 2H), 1.97 (dd, J = 8.1, 3.6 Hz, 2H)	560.4
227	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.05 (br s, 1H), 8.13 (d, J=6.0, 1H), 7.90 (dd, J=1.1, 8.0 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.22 (t, J=6.8 Hz, 1H), 7.05-7.16 (m, 1H), 6.80-6.93 (m, 3H), 6.03 (s, 2H), 4.63 (br s, 2H), 3.98-4.21 (m, 2H), 3.58 (dd, J=1.9, 7.2 Hz, 3H), 3.51-3.55 (m, 2H), 3.26-3.33 (m, 2H), 3.07 (s, 1H), 2.91-3.05 (m, 4H), 2.17-2.24 (m, 2H), 1.93-2.06 (m, 2H)	546.3
228		586.4
229		553.5
230		536.5
231		546.4
232	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.05 (br s, 1H), 8.15 (d, J=6.3 Hz, 1H), 7.89 (dd, J=1.2, 7.9 Hz, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.18-7.29 (m, 1H), 7.09 (s, 1H), 6.78-6.99 (m, 3H), 6.05 (s, 2H), 4.67 (s, 2H), 3.45-3.60 (m, 4H), 3.35-3.38 (m, 3H), 3.30 (br s, 2H), 3.02 (d, J=11.5 Hz, 2H), 2.23 (br d, J=7.3 Hz, 2H), 1.93-2.03 (m, 2H)	536.3
233		494.4
234		544.4

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
235		508.4
236		601.5
237		569.4
238		526.4
239	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6) δ 14.13 (br s, 1H), 8.12 (d, J=6.0 Hz, 1H), 7.90 (dd, J=1.3, 8.0 Hz, 1H), 7.51 (s, 1H), 7.18-7.27 (m, 1H), 7.00 (s, 1H), 6.80-6.92 (m, 3H), 6.01 (s, 2H), 4.59 (s, 2H), 3.59-4.32 (m, 3H), 3.27 (d, J=11.5 Hz, 3H), 3.15 (br s, 1H), 3.00 (d, J=11.8 Hz, 3H), 2.21 (br d, J=7.3 Hz, 2H), 1.93-2.05 (m, 2H), 1.71-1.92 (m, 3H), 1.47-1.59 (m, 1H), 1.39 (br s, 1H), 1.06-1.15 (m, 3H), 0.88 (d, J=6.8 Hz, 3H)	554.5
240		540.4
241		558.4
242		526.4
243		542.4
244		540.4
245	^{1}H NMR (400 MHz, $CDCl_3$): δ 8.22 (s, 1 H), 7.55 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.29 - 7.26 (m, 2 H) 7.03 (d, J = 8.4 Hz, 1 H), 6.88 (t, J = 7.2 Hz, 1 H), 6.41 (d, J = 5.6 Hz, 1 H), 4.90 - 4.70 (m, 4 H), 3.72 (s, 2 H), 3.37 - 3.41 (m, 2 H), 3.17 - 3.00 (m, 2 H), 2.95 - 2.77 (m, 4 H), 2.26 - 2.00 (m, 4 H), 1.75 - 1.63 (m, 8 H)	511.1
246	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.90 (s, 1 H), 7.89 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.54 (s, 1 H), 7.22 (t, J = 7.6 Hz, 1 H), 7.08 (d, J = 2.4 Hz, 1 H), 6.93 - 6.80 (m, 2 H), 6.02 (s, 2 H), 4.72 (s, 2 H), 3.62 (s, 2 H), 3.25 (s, 2 H), 3.02 (d, J = 12.0 Hz, 2 H), 2.70 - 2.66 (m, 4 H), 2.23 (d, J = 7.2 Hz, 2 H), 2.02 - 1.93 (m, 2 H), 1.65 - 1.52 (m, 8 H)	511.1
247	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): δ 8.45 (s, 1 H), 8.16 (s, 1H), 7.92 (d, J = 8.0 Hz, 1 H), 7.55 (s, 1 H), 7.27 - 7.18 (m, 1 H), 6.95 (s, 1 H), 6.89 - 6.82 (m, 2 H), 6.03 (s, 2 H), 5.06 - 4.60 (m, 2 H), 3.59 (s, 2 H), 3.27 - 3.26 (m, 2 H), 3.01 - 2.98 (m, 2 H), 2.67 - 2.66 (m, 4 H), 2.24 - 2.20 (m, 2 H), 2.00 - 1.91 (m, 2 H), 1.64 - 1.52 (m, 8 H)	511.1

화합물 번호	^{1}H NMR	LCMS (M+H, 달리 지시되지 않는 한)
248	^{1}H NMR (400 MHz, MeOD): δ 8.39 (s, 1 H), 8.14 (d, *J* = 6.4 Hz, 1 H), 7.72 (dd, J = 8.0, 1.2 Hz, 1 H), 7.49 (s, 1 H), 7.26 - 7.21 (m, 1 H), 7.04 (d, *J* = 2.4 Hz, 1 H), 6.90 - 6.80 (m, 3 H), 6.75 - 6.69 (m, 1 H), 4.70 (s, 2 H), 3.92 (d, *J* = 6.8 Hz, 2 H), 3.44 (d, *J* = 10.8 Hz, 2 H), 3.30 - 3.29 (m, 4 H), 3.11 (d, *J* = 11.6 Hz, 2 H), 2.36 - 2.29 (m, 2 H), 2.19 - 2.17 (m, 2 H), 1.94 - 1.88 (m, 4 H), 1.76 - 1.75 (m, 4 H)	512.1
249	^{1}H NMR (400 MHz, MeOD): δ 8.48 - 8.41 (m, 1 H) 8.10 - 8.05 (m, 1 H) 7.83 - 7.78 (m, 1 H) 7.57 (s, 1 H) 7.30 - 7.25 (m, 1 H) 7.09 - 7.06 (m, 1 H) 6.96 (s, 2 H) 6.92 - 6.88 (m, 1 H) 3.93 (s, 2 H) 3.58 - 3.50 (m, 4 H) 3.24 - 3.18 (m, 4 H) 3.15 - 3.09 (m, 4 H) 1.90 - 1.81 (m, 8 H) 1.79 - 1.70 (m, 8 H). LCMS (ESI)	552.2
250	^{1}H NMR ($CDCl_3$, 400 MHz): *δ* 8.20-8.18 (d, 1 H), 7.62-7.60 (d, 1 H), 7.38 (s, 1 H), 7.32-7.30 (m, 1 H), 7.08-7.06 (d, 1 H), 6.93-6.89 (t, 1 H), 6.60 (s, 1 H), 6.36-6.35 (m, 1 H), 4.86 (s, 2 H), 3.65 (s, 2 H), 3.40-3.37 (t, 2 H), 3.21 (s, 2 H), 3.16-3.13 (m, 2 H), 3.05-3.02 (m, 2 H), 2.86-2.84 (m, 4 H), 1.98-1.94 (t, 2 H), 1.82-1.76 (m, 4 H), 1.75-1.66 (m, 4 H), 1.63-1.52 (m, 4 H)	538.4
251	^{1}H NMR (400 MHz, MeOD): δ 8.10 - 8.08 (d, 1H, *J* = 8.0 Hz), 7.73-7.71 (d, 1H, *J* = 8.0 Hz), 7.31-7.29 (t, 1H, *J* = 8.0 Hz), 6.96-6.92 (m, 3H), 6.66- 6.65 (d, 1H, *J* = 4.0 Hz), 6.50-6.48 (m, 1H),4.51 (s, 4H), 4.31 (s, 4H), 4.04 (s, 2H), 3.21-3.18 (m, 4H,), 1.86 (m, 4H), 1.74 (m, 4H)	496.1
252	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): *δ* 14.7 (s, 1H), 8.14 (d, *J* = 6.0 Hz, 1H), 7.94 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.38 (d, *J* = 3.2 Hz, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.92 (d, *J* = 6.0 Hz, 1H), 6.88-6.86 (m, 2H), 4.14 (q, J = 11.6 Hz, 3H), 3.63-3.60 (m, 1H), 3.56 (s, 2H), 3.40-3.19 (m, 2H), 3.10-3.04 (m, 2H), 2.69-2.60 (m, 5H), 1.70-1.50 (m, 8H)	496.2
253	^{1}H NMR (400 MHz, DMSO-d_6): *δ* 14.7 (s, 1H), 8.14 (d, *J* = 6.0 Hz, 1H), 7.94 (d, *J* = 7.6 Hz, 1H), 7.38 (d, *J* = 3.2 Hz, 1H), 7.31 (s, 1H), 7.21 (t, 1H), 7.04 (s, 1H), 6.92 (d, *J* = 6.0 Hz, 1H), 6.88-6.86 (m, 2H), 4.14 (q, J = 11.6 Hz, 3H), 3.63-3.60 (m, 1H), 3.56 (s, 2H), 3.40-3.19 (m, 2H), 3.10-3.04 (m, 2H), 2.69-2.60 (m, 5H), 1.70-1.50 (m, 8H)	496.2

[2624]

[2625] 생물학적 검정

[2626] **실시예 B-1: BRM 분해제에 대한 HiBIT 나노루시퍼레이스 보완 스크린**

[2627] BRM 분해를 평가하기 위해, Promega에서 개발한 HiBIT 나노루시퍼레이스 보완 전략을 사용하여 BRM 수준의 효과에 대해 화합물을 스크리닝했다. 간단히 말해서, CRISPR/CAS9를 통해 유전적으로 변형된 HELA 세포주를 사용하여 HiBIT 서열을 BRM(BRM-HiBIT KI Hela)의 3' 말단에 융합했다. 이후 Nano-Glo HiBIT 용해 검출 시약(Promega)을 사용하여 BRM 단백질 수준을 검출했다.

[2628] 스크리닝된 화합물을 Echo 디스펜서(Labcyte)를 사용하여 25nL DMSO 중 10μM 및 1μM로 백색 384-웰 플레이트에 플레이팅했다. BRM-HiBIT KI Hela 세포를 DMEM 성장 배지(10% FBS, 1% Glutamax(GIBCO cat # 31053-028), 1x 페니실린-스트렙토마이신(ROCHE, cat# 1107444001), 4.5g/L D-글루코스 함유, 페놀 레드 없음) 중 25μl로 웰당 5000 세포로 화합물 플레이트에 시딩했다. 화합물과 함께 18 시간 동안 37 ℃에서 인큐베이션한 후, 5μl Cell Titer-Fluor 시약(Promega)을 첨가하여 세포 생존률을 평가했다. 오비탈 진탕기에서 30 초 혼합하고, 37℃에서 30 분 인큐베이션한 후, INFINITE F500(Tecan)(380-400nM 여기, 505nM 방출)을 사용하여 형광을 측정했다. 다음으로, BRM HiBIT 수준을 평가하기 위해, 용해 완충액 ml당 1:50 Nano-Glo HiBIT 용해 기질 및

1:100 LgBIT 단백질을 함유하는 30μl의 Nano-Glo HiBIT 용해 검출 시약(Promega)을 첨가했다. 오비탈 진탕기에서 350 rpm에서 10 분 동안 진탕한 후, INFINITE F500(Tecan)에서 발광을 측정했다. 화합물 효과를 평가하기 위해, DMSO만으로 처리된 웰의 평균을 0%로 설정하고 세포를 포함하지 않는 웰의 평균을 -100%로 설정하여 발광 신호를 정규화했다. 본원에 개시된 화합물에 대한 데이터가 아래 표 4에 나타난다. 표 4에서, "화합물 번호"는 표 1에서 사용된 것과 일치함에 유념하라.

[2629] 표 4

화합물 번호	중앙값 HiBiT 활성 1 μM	중앙값 HiBiT 활성 10 μM
1	-87.0122	-81.2914
2	-73.6048	-28.0898
3	-68.4262	-39.6172
4	-65.5436	-51.5968
5	-63.6385	-31.0597
6	-61.1458	-67.7912
7	-56.5569	-25.5864
8	-51.6794	-23.8415
9	-50.6553	-33.5251
10	-50.554	-56.7556
11	-46.2503	-53.1423
12	-45.7932	-34.0604
13	-44.9864	-32.1865
14	-42.9269	-50.5501
15	-41.5313	-55.0083
16	-38.7074	-29.4258
17	-37.0864	-51.9890
18	-37.0807	-56.4043
19	-36.9943	-56.3342
20	-33.3403	-8.90957
21	-32.7297	-42.1813
22	-30.6701	-33.6373
23	-29.3818	-58.9213
24	-27.1137	-43.5174
25	-26.7344	-55.1975
26	-25.9348	-28.4202
27	-23.7734	-28.4819
28	-23.3156	-44.9026
29	-22.4859	-33.4085
30	-18.8155	-47.5549
31	-16.7799	-47.9900
32	-16.4623	-30.3732
33	-14.8996	-55.0132
34	-7.21674	-29.4355

[2630]

[2631] 실시예 B-2: BRM 및 BRG1 분해제에 대한 면역형광 검정

[2632] SW1573 세포를 384 웰 플레이트에서 3000 세포/웰로 시딩했다. 다음 날, Echo 디스펜서를 사용하여 화합물을 첨가했다. 화합물과 함께 20 시간 인큐베이션한 후, 세포를 4% 포름알데히드로 고정한 다음 0.2% Triton X-100으로 투과화하고 10% FCS로 차단했다. 고정되고 투과화된 세포를 밤새 4℃에서 BRM 1차 항체(Cell signaling Cat# 11966) 또는 BRG 1차 항체(Abcam, ab110641)로 처리했다. 마지막으로, 세포를 1 시간 동안 형광 표지된 2차 항체(Donkey anti-Rabbit IgG AF488, Life Technologies, A21206)로 처리하고 Hoechst 핵 염색(#H3569)을 30 분 동안 첨가했다. 각 단계 사이와 Opera Phenix 현미경(Perkin Elmer)에서 영상화하기 전에 세포를 PBS로 세척했다. Harmony 소프트웨어(Perking Elmer)를 사용하여 각 웰에서 세포당 BRM 또는 BRG 신호의 평균 핵 신호 강도를 정량화했다. 용량 반응은 알려진 분해제 제어로 정규화된 데이터를 사용하여 평균 핵 신호 강도의 농도 의존

성 반응으로부터 결정되었다. D_{max}의 계산을 할 수 있도록 용량 반응 곡선을 부동 최댓값에 피팅했다.

[2633] 본원에 개시된 화합물에 대한 데이터가 아래 표 5에 나타난다. 표 5에서, "화합물 번호"는 표 1에서 사용된 것과 일치함에 유념하라. 표 5에서, BRM 및 BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)에 대해: A는 < 0.010 μM을 나타내고, B는 0.010 - 0.10 μM을 나타내고, C는 > 0.10 μM을 나타내고; BRM 및 BRG1 IF 분해 S_{inf} %에 대해 D는 0 - -30%를 나타내고, E는 -30% - -70%를 나타내고, F는 -71% - -120%를 나타내고 ND는 값이 결정되지 않았음을 나타낸다.

[2634] 표 5

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
1	B	F	C	F
2	A	E	A	E
3	B	E	B	E
4	B	E	B	D
5	A	E	A	E
6	B	E	C	D
7	A	E	C	ND
8	B	E	C	ND
9	B	E	A	D
10	B	E	C	ND
11	B	F	B	E
12	B	E	B	D
13	B	E	B	D
14	A	E	B	D
15	C	E	C	D
16	B	E	B	D
17	B	E	B	D
18	C	E	C	ND
19	B	E	C	E
20	B	F	B	F
21	C	ND	B	D
22	C	ND	C	D
23	A	E	B	E
24	B	E	C	ND
25	C	E	C	ND
26	C	ND	C	ND
27	C	D	C	ND
28	C	E	C	ND
29	C	ND	C	ND
30	C	E	C	D
31	C	ND	C	ND
32	B	E	B	D
33	C	E	C	E
34	C	ND	ND	ND
35	C	E	C	ND

[2635]

[2636]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
36	B	E	B	E
37	B	E	A	E
38	B	E	C	ND
39	A	F	A	E
40	C	E	C	ND
41	B	E	B	E
42	B	E	B	E
43	B	E	A	D
44	A	E	B	E
45	B	E	B	E
46	A	E	B	E
47	C	E	C	D
48	B	E	B	D
49	A	F	A	E
50	B	E	C	E
51	C	E	C	E
52	B	E	B	E
53	B	E	B	D
54	C	F	C	E
55	B	E	B	E
56	B	E	C	D
57	B	E	C	ND
58	A	F	A	E
59	B	E	A	D
60	A	E	A	E
61	A	E	A	E
62	A	E	A	E
63	A	F	A	E
64	B	E	B	D
65	A	E	B	D
66	A	F	B	E
67	B	E	A	D
68	A	F	A	E
69	A	F	A	E
70	A	E	A	E
71	B	E	A	E

[2637]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
72	B	E	C	ND
73	C	E	C	ND
74	B	E	C	ND
75	A	E	A	E
76	A	E	A	D
77	B	E	C	ND
78	A	E	C	ND
79	B	E	C	ND
80	B	E	A	D
81	A	E	A	E
82	A	E	A	E
83	C	E	B	E
84	A	E	C	ND
85	C	E	C	ND
86	A	E	A	E
87	A	E	A	E
88	A	E	A	D
89	B	E	C	ND
90	B	E	B	D
91	A	E	A	E
92	A	F	A	E
93	A	E	C	ND
94	A	E	A	E
95	A	E	A	E
96	C	E	B	D
97	A	F	A	E
98	B	E	C	ND
99	A	E	A	E
100	A	E	A	E
101	B	E	C	ND
102	A	E	A	E
103	A	E	C	E
104	A	E	A	D
105	B	E	B	D
106	A	E	A	E
107	B	E	B	D

[2638]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
108	C	E	C	ND
109	A	E	A	E
110	A	E	C	ND
111	A	E	A	D
112	A	E	B	D
113	B	E	A	D
114	B	E	C	ND
115	A	E	A	E
116	B	E	A	D
117	B	E	B	D
118	B	E	A	E
119	C	E	C	ND
120	B	E	B	E
121	A	E	C	E
122	B	F	B	E
123	A	E	A	E
124	A	E	C	ND
125	A	E	A	E
126	A	E	A	D
127	A	E	A	E
128	B	F	A	E
129	A	E	A	E
130	A	E	B	E
131	A	E	A	D
132	A	E	A	E
133	A	E	A	D
134	B	E	B	E
135	A	E	A	E
136	A	E	A	E
137	A	E	A	E
138	B	E	A	E
139	A	E	B	D
140	A	F	A	E
141	A	E	A	E
142	B	E	B	E
143	A	E	A	D

[2639]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
144	C	E	B	D
145	A	E	A	D
146	C	E	C	E
147	C	E	C	E
148	B	E	C	E
149	B	E	B	D
150	A	F	A	E
151	A	E	A	D
152	A	E	A	E
153	A	E	A	D
154	A	F	A	E
155	A	E	A	E
156	C	E	C	E
157	B	E	B	E
158	A	F	A	E
159	A	E	A	E
160	B	E	B	D
161	A	E	B	E
162	A	F	A	E
163	B	E	C	E
164	B	E	C	D
165	C	E	C	ND
166	A	E	C	ND
167	A	F	A	F
168	B	F	B	E
169	A	E	B	E
170	B	E	C	E
171	C	E	C	ND
172	A	E	B	F
173	B	F	B	E
174	B	F	B	E
175	A	E	A	E
176	B	E	C	ND
177	B	E	B	E
178	B	F	A	E
179	B	F	B	E

[2640]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
180	A	E	A	E
181	B	F	B	E
182	C	F	ND	ND
183	C	E	C	ND
184	A	E	A	E
185	C	F	B	E
186	A	E	B	E
187	A	E	A	E
188	C	E	C	ND
189	A	F	A	E
190	A	F	A	E
191	A	F	A	F
192	A	F	A	F
193	A	F	A	F
194	A	F	A	E
195	A	F	A	E
196	A	F	A	F
197	A	F	A	E
198	A	E	ND	ND
199	A	F	B	E
200	A	F	A	F
201	A	F	A	E
202	B	E	B	E
203	B	E	C	ND
204	B	E	ND	ND
205	A	F	A	E
206	B	E	C	ND
207	B	E	C	F
208	A	E	A	E
209	A	F	A	E
210	C	E	C	ND
211	B	E	B	E
212	A	F	A	F
213	B	E	ND	ND
214	A	F	A	E
215	A	F	B	F

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
216	A	F	A	F
217	B	E	B	E
218	A	F	A	E
219	A	F	A	F
220	C	E	ND	ND
221	A	E	A	E
222	A	F	A	F
223	B	E	A	E
224	A	E	A	E
225	B	E	A	D
226	B	E	A	E
227	C	E	C	ND
228	A	E	A	D
229	B	F	B	E
230	B	E	B	E
231	A	E	A	E
232	B	E	A	E
233	A	E	A	E
234	B	E	B	F
235	B	F	A	E
236	C	F	B	D
237	B	E	B	E
238	B	E	A	E
239	A	E	A	E
240	B	F	B	E
241	B	E	A	D
242	A	F	A	E
243	B	F	A	E
244	B	E	A	E
245	A	F	A	E
246	B	F	A	F
247	A	F	A	F
248	A	E	ND	ND
249	A	E	C	ND
250	A	E	B	E
251	A	E	B	E

[2641]

화합물 번호	BRM IF 분해 IC_{50} (μM)	BRM IF 분해 S_{inf} (%)	BRG1 IF 분해 IC_{50} (μM)	BRG1 IF 분해 S_{inf} (%)
252	A	F	A	F
253	A	F	A	F

[2642]

[2643] 본 서면 명세서는 최적 방식을 포함하여 본원 발명을 개시하고, 또한 임의의 장치 또는 시스템을 만들고 이용하며 임의의 통합된 방법을 수행하는 것을 포함하여 당업자가 본원 발명을 실시할 수 있도록 하기 위해 실시예를 이용한다. 본 발명의 특허 가능한 범위는 청구범위에 의해 정의되며, 당업자에게 예상되는 다른 실시예를 포함할 수 있다. 이러한 다른 실시예는 청구범위의 문자 그대로의 언어와 다르지 않은 구조 요소를 갖고 있거나 청구범위의 문자 그대로의 언어와 실질적으로 다르지 않은 균등한 구조 요소를 포함하는 경우 청구범위에 속하는 것으로 의도된다.