



MD/EP 3319963 T2 2020.05.31

REPUBLICA MOLDOVA



(19) Agenția de Stat
pentru Proprietatea Intelectuală

(11) MD/EP 3319963 (13) T2

(51) Int. Cl: C07D 471/04 (2006.01.01)
A61K 31/437 (2006.01.01)
A61P 25/24 (2006.01.01)

(12) BREVET DE INVENȚIE EUROPEAN VALIDAT

(21) Numărul de depozit: e 2018 0505 (22) Data de depozit: 2016.07.07 (96) Numărul cererii și data de depozit a cererii de brevet european: 16741469.7, 2016.07.07 (97) Numărul de publicare și data publicării de către OEB a cererii de brevet european: 3319963, 2020.01.08 (31) Numărul cererii prioritare: 201562190416 P (32) Data de depozit a cererii prioritare: 2015.07.09 (33) Țara cererii prioritare: US	(49) Data publicării traducerii fasciculului de brevet european validat: BOPI nr. 05/2020, 2020.05.31 (80) Data publicării mențiunii eliberării de către OEB: EPB nr. 02/2020, 2020.01.08 (82) Data publicării solicitării de validare a brevetului european: BOPI nr. 06/2018, 2018.06.30
(71) Solicitant: Janssen Pharmaceutica NV, BE (72) Inventatori: CHROVIAN Christa C., US; LETAVIC Michael A., US; RECH Jason C., US; SOYODE-JOHNSON Akinola, US; WALL Jessica L., US (73) Titular: Janssen Pharmaceutica NV, BE (74) Mandatar autorizat: PARASCA Dumitru	

(54) 4-Azaindoli substituiți și utilizarea lor în calitate de modulatori ai receptorului GluN2B

(57) Rezumat:

1
4-azaindoli substituiți ca liganzi receptori NR2B. Astfel de compuși pot fi utilizați în modularea receptorului NR2B și în compoziții și metode pentru tratamentul

2
stărilor de boală, tulburărilor, și afecțiunilor mediate de activitatea receptorului NR2B.
Revendicări: 15

MD/EP 3319963 T2 2020.05.31

(54) Substituted 4-azaindoles and their use as GluN2B receptor modulators**(57) Abstract:**

Substituted 4-azaindoles as NR2B receptor ligands. Such compounds may be used in NR2B receptor modulation and in pharmaceutical compositions and methods for

the treatment of disease states, disorders, and conditions mediated by NR2B receptor activity.

Claims: 15

Descriere:**(Descrierea se publică în redacția solicitantului)****Domeniul invenției**

- 5 Prezentă invenție se referă la compuși având proprietăți de modulare a NR2B, la compoziții farmaceutice care cuprind acești compuși, la procedee chimice pentru prepararea acestor compuși și la utilizarea lor în tratamentul bolilor asociate cu activitatea receptorului NR2B la animale, în special oameni.

Bazele invenției

- 10 Glutamatul este unul dintre neurotransmițătorii excitatori majori care este foarte răspândit în creier. Prima indicație a rolului său de mesager excitator a fost în anii 1950, când s-a observat că administrarea intravenoasă de glutamat induce convulsii. Cu toate acestea, detectarea întregului sistem de neurotransmițători glutamatergici cu diferenții lui receptori nu a avut loc înainte de anii 1970 și 1980 când au fost dezvoltati numeroși antagoniști sau, ca în cazul PCP și ketaminei, au fost identificați ca antagoniști. În final, în anii 90 biologia moleculară a furnizat instrumentele pentru clasificarea receptorilor glutamatergici.

- 15 Receptorii de N-metil-D-aspartat (NMDA) sunt un subtip de receptori ionotropici de glutamat care mediază transmiterea sinaptică excitativă în creier. Receptorii NMDA sunt distribuiți peste tot în creier și joacă un rol cheie în plasticitate sinaptică, sinaptogeneză, excitotoxicitate, achiziție de memorie și învățare. Receptorii NMDA se deosebesc de alte subtipuri majore de receptori ionotropici ai glutamatului (receptori ai AMPA și kainat) prin faptul că sunt blocați de Mg^{2+} la potențialele membranei în repaus, sunt foarte permeabile pentru Ca^{2+} și necesită co-activare de către doi neurotransmițători distincți: glutamat și glicină (sau D-serină) (Traynelis SF et al., Pharmacol Rev. 2010; 62(3):405-96). Influxul de Ca^{2+} prin receptorii NMDA declanșează cascade de semnalizare și reglează expresia genei care este esențială pentru diferite forme de plasticitate sinaptică, inclusiv potențarea pe termen lung a eficacității sinapsei (LTP) (Berberich S et al., Neuropharmacology 2007; 52(1):77-86) și depresiei pe termen lung (LTD) (Massey, PV et al., J Neurosci. 2004 Sep 8;24(36):7821-8).

- 20 Marea majoritate a receptorilor NMDA de mamifer formează un heterotetramer realizat din două unități GluN1 obligatorii și două subunități variabile ale receptorului GluN2 codificate de către gena GRIN1 și respectiv una din patru gene GRIN2. Una sau ambele subunități GluN2 pot fi potențial înlocuite cu o subunitate GluN3A sau GluN3B.

- 25 Produsul genei GRIN1 are 8 variante de imbinare, deși există 4 gene GRIN2 diferite (GRIN2A-D) care codifică patru subunități GluN2 distincte. Situsul de legare a glicinei este prezent pe subunitatea GluN1 și locul de legare a glutamatului este prezent pe subunitatea GluN2

- 30 Subunitățile GluN2 joacă un rol dominant în determinarea proprietăților funcționale și farmacologice ale ansamblului receptorului NMDA și prezintă o distribuție distinctă în diferite zone ale creierului. De exemplu, subunitățile GluN2B sunt exprimate în principal în prozencefalul creierului de mamifere adulte (Paoletti P et al., Nat Rev Neurosci. 2013; 14(6):383-400; Watanabe M et al., J Comp Neurol. 1993; 338(3):377-90) și sunt implicate în învățare, procesarea memoriei, dispoziție, atenție, emoție și percepția durerii (Cull-Candy S et al., Curr Opin Neurobiol. 2001; 11(3):327-35).

- 35 Compușii care modulează funcția receptorului NMDA care conține GluN2B pot fi utili în tratamentul multor afecțiuni neurologice și psihiatrice, inclusiv, dar fără a se limita la tulburare bipolară (Martucci L et al., Schizophrenia Res. 2006; 84(2-3):214-21), tulburare depresivă majoră (Miller OH et al., eLife. 2014; 3:e03581; Li N et al., Biol Psychiatry. 2011; 69(8):754-61), depresie rezistentă la tratament (Preskom SH et al. J Clin Psychopharmacol. 2008; 28(6):631-7) și tulburările de dispoziție ale lor (incluzând schizofrenie (Grimwood S et al., Neuroreport. 1999;10(3):461-5; Weickert CS et al. Molecular Psychiatry (2013) 18, 1185-1192), depresie ante- și postpartum, tulburare afectivă sezonieră și altele asemenea), boală Alzheimer (Hanson JE et al., Neurobiol Dis. 2015; 74:254-62; Li S et al., J Neurosci. 2011; 31(18):6627-38) și alte demențe (Orgogozo JM et al. Stroke 2002, 33: 1834-1839), boală Parkinson (Duty S, CNS Drugs. 2012; 26(12):1017-32; Steece-Collier K et al., Exp Neurol. 2000; 163(1):239-43; Leaver KR et al. Clin Exp Pharmacol Physiol. 2008; 35(11):1388-94), coree Huntington (Tang TS et al., Proc Natl Acad Sci SUA. 2005; 102(7):2602-7; Li L et al., J Neurophysiol. 2004; 92(5):2738-46), scleroză multiplă (Grasselli G et al., BrJ Pharmacol. 2013; 168(2):502-17; Farjam M et al., Iran J Pharm Res. 2014; 13(2):695-705), depreciere cognitivă (Wang D et al. 2014, Expert Opin Ther Targets. 2014;18(10):1121-30), leziune la cap (Bullock MR et al., Ann N Y Acad Sci. 1999; 890:51-8), leziune a măduvei spinării, accident vascular cerebral (Yang Y et al., J Neurosurg. 2003; 98(2):397-403), epilepsie (Napolini AP et al., Epilepsy Res. 2012 Jun;100(1-2):12-9), tulburări de

mișcare (de exemplu dischinezii) (Morissette M et al., *Mov Disord.* 2006; 21(1):9-17), diferite boli neurodegenerative (de exemplu scleroză laterală amiotrofică (Fuller PI et al., *Neurosci Lett.* 2006; 399(1-2):157-61) sau neurodegenerare asociată cu infecții bacteriene sau cronice), glaucom (Naskar R et al. *Semin Ophthalmol.* 1999 Sep; 14(3):152-8), durere (de exemplu durere cronică, în cancer, post-operatorie și neuropată (Wu LJ și Zhuo M, *Neurotherapeutics.* 2009; 6(4):693-702), neuropatie diabetică, migrenă (Peeteri M et al., *J Pharmacol Exp Ther.* 2007; 321(2):564-72), ischemie cerebrală (Yuan H et al., *Neuron.* 2015; 85(6):1305-18), encefalită (Dalmau J. et al., *Lancet Neurol.* 2008; 7(12):1091-8.), autism și tulburări cu spectru de autism (Won H. et al., *Nature.* 2012; 486(7402):261-5), tulburări de memorie și învățare (Tang, Y. P. et al., *Nature.* 1999; 401(6748):63-9), tulburare obsesiv-compulsivă (Arnold PD et al., *Psychiatry Res.* 2009;172(2):136-9.), tulburare de hiperactivitate cu deficit de atenție (ADHD) (Dorval KM et al., *Genes Brain Behav.* 2007; 6(5):444-52), PTSD (Haller J et al. *Behav Pharmacol.* 2011;22(2):113-21; Leaderbrand K et al. *Neurobiol Learn Mem.* 2014; 113:35-40), tinnitus (Guitton MJ, și Dudai Y, *Neural Plast.* 2007; 80904; Hu SS et al. **2016**; 273(2): 325-332), tulburări de somn (precum narcolepsie sau somnolență excesivă în timpul zilei, brevet WO 2009058261 A1), vertigo și nistagmus (Straube A. et al., *Curr Opin Neurol.* 2005; 18(1):11-4; Starck M et al. *J Neurol.* 1997 Jan;244(1):9-16), tulburări de anxietate autoimunologică precum lupus eritematos sistemic neuropsihiatric (Kowal C et al. *Proc. Natl. Acad. Sci. U.S.A.* 2006; 103, 19854-19859) și boli adictive (de exemplu adicție la alcool, adicție la medicament) (Nagy J, 2004, *Curr Medicament Ținte CNS Neurol Disord.* 2004; 3(3):169-79; Shen H et al., *Proc Natl Acad Sci SUA.* 2011;108(48):19407-12).

Având în vedere importanța clinică a NR2B, identificarea compușilor care modulează funcția receptorului NR2B reprezintă o cale atractivă în dezvoltarea de noi agenți terapeutici. Astfel de compuși sunt furnizați în acest document.

US 2007/275965 A1 se referă la compuși și compoziții farmaceutice care inhibă legarea chemokinei SDF-1 la receptorul de chemokină CXCR4 și/sau legarea chemokinelor SDF-1 sau I-TAC la receptorul de chemokină CCXCR2 (CXCR7).

US 2008/300239 A1 se referă la o metodă de inhibare a activității/funcției kinazei PI3 utilizând derivați de chinolină.

WO 2003/082868 A1 se referă la compuși 7-azaindol 3,5-substituiți, utilizarea lor în inhibarea kinazelor N-terminale c-Jun, utilizarea lor în medicină și în special în prevenirea și/sau tratamentul tulburărilor neurodegenerative legate de apoptoză și/sau inflamație.

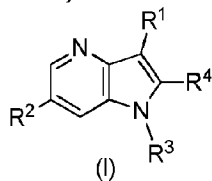
M. H. Buonarati et al. (1990) se referă la 2-hidroxi-amino-1-metil-6-fenilimidazo[4,5-b]piridină (N-hidroxi-PhIP) și la capacitatea ei de a lega ADN *in vitro*.

WO 2014/124651 A1 se referă la compuși care sunt inhibitori ai iGlu R.

WO 2010/043396 A1 se referă la derivați de indol și benzomorfolină care sunt modulatori alosterici pozitivi ai receptorilor metabotropici - subtip 2 („mGluR2“).

Rezumatul invenției

Invenția este direcționată spre realizările generale și respectiv preferate definite prin revendicările independente și dependente atașate în prezentul document. Un aspect al acestei invenții se referă la compuși cu Formula (I):



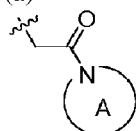
în care:

R¹ este selectat din grupul constând din: H, ³H, halo, alchil_{C1-3}, și haloalchil_{C1-3};

R² este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil_{C1-5}, și haloalchil_{C1-5}; piridinil substituit opțional cu halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, și -CN; tiazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil_{C1-5}, și haloalchil_{C1-5};

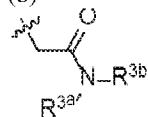
R³ este selectat din grupul constând din:

(a)



in care inelul A este un heterocicloalchil cu 4-7 membri conținând opțional un heteroatom oxigen suplimentar selectat din grupul constând din: azetidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, CH₂OH, alcoxi_{C1-5}, OH, și CN; pirolidinil substituit opțional unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, alcoxi_{C1-5}, și OH; morfolino substituit opțional cu unu sau doi membri alchil_{C1-5}; piperidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, alcoxi_{C1-5}, și OH; 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il; 5-azaspiro[2.3]hexan-5-il; și pirolidin-3-onă; sau

(b)



in care R^{3a} este H, sau alchil_{C1-5};

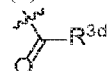
și R^{3b} este selectat din grupul constând din: alchil_{C1-5} substituit opțional cu OH, halo, sau OCH₃; haloalchil_{C1-5}; benzil; CH₂ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; și ciclobutil; sau

(c)



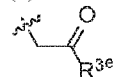
in care R^{3c} este selectat din grupul constând din: ciclopropil; ciclobutil; pirimidinil substituit opțional cu halo; piridinil; piridazinil; furanil substituit opțional cu haloalchil_{C1-5}; oxazolil; izoxazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; oxadiazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; pirazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; triazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; tetrahidrofuranil; tetrahidropiraniil; oxetaniil; și oxiraniil; sau

(d)



in care R^{3d} este CH₂-ciclopropil sau ciclobutil; sau

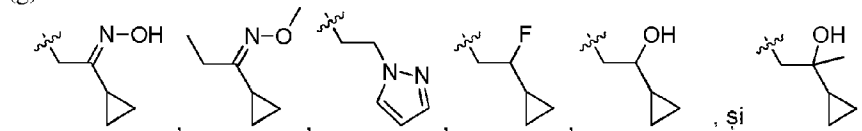
(e)



in care R^{3e} este selectat din grupul constând din: OH, alchil_{C1-5}, ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; sau

(f) alchil_{C1-5} substituit opțional cu OH sau alcoxi_{C1-5}; CH₂S(CH₃); CH₂(S=O)CH₃; CH₂(SO₂)CH₃; și CH₂CH₂(C=O)CH₃; sau

(g)



și

R⁴ este H, ²H sau alchil_{C1-3} și săruri acceptabile farmaceutice ale compuşilor cu Formula (I).

Realizări suplimentare sunt furnizate de săruri acceptabile farmaceutice ale compuşilor cu Formulele (I), promedicamente acceptabile farmaceutice ale compuşilor cu Formula (I), și metaboliți activi farmaceutici ai compuşilor cu Formula (I).

În anumite realizări, compușii cu Formula (I) sunt compuși selectați dintre acele specii descrise sau exemplificate în descrierea detaliată mai jos.

Intr-un alt aspect, invenția se referă la enantiomeri și diastereomeri ai compuşilor cu Formula (I), precum și la sărurile acceptabile farmaceutice.

Intr-un alt aspect, invenția se referă la compoziții farmaceutice pentru utilizare în tratarea unei boli, tulburări, sau afecțiuni medicale mediate de activitatea receptorului NR2B, cuprinzând o cantitate eficientă din cel puțin un compus selectat dintre compușii cu Formula (I) și săruri acceptabile farmaceutice ale compuşilor cu Formula (I).

Compozițiile farmaceutice conform invenției pot cuprinde suplimentar unul sau mai mulți excipienți acceptabili farmaceutici.

Intr-un alt aspect, realizările chimice din prezenta invenție sunt utile ca modulatori ai receptorului NR2B. Astfel, invenția este direcționată spre un compus pentru utilizare într-o metodă pentru modularea activității receptorului NR2B, inclusiv când un astfel de receptor este într-un subiect, cuprinzând expunerea receptorului NR2B la o cantitate eficientă de compus menționat, în

care compusul menționat este cel puțin un compus selectat dintre compuși cu Formula (I) și săruri acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I).

Intr-un alt aspect, invenția este direcționată spre un compus pentru utilizare într-o metodă de tratare a unui subiect care suferă, sau este diagnosticat cu o boală, tulburare, sau afecțiune medicală mediată de activitatea receptorului NR2B, cuprinzând administrarea către subiectul care are nevoie de astfel de tratament a unei cantități eficiente de compus menționat, în care compusul menționat este cel puțin un compus selectat dintre compuși cu Formula (I) și sărurile acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I). Realizările suplimentare ale compușilor pentru

utilizare în metodele de tratament sunt stabilite în descrierea detaliată.

Intr-un alt aspect, metoda de studiere a compușilor marcați izotopic în studii metabolice (de preferință cu ^{14}C), studii cinetice de reacție (de exemplu, cu ^2H sau ^3H), în tehnici de detectare sau imagistică [cum ar fi tomografie cu emisie de pozitron (PET) sau tomografie computerizată cu emisia unui singur foton (SPECT)] incluzând teste de distribuție a medicamentului în substrat sau țesut, sau în tratamentul radioactiv al pacienților. De exemplu, un compus marcat cu ^{18}F sau ^{11}C poate fi preferat în special pentru studii PET sau SPECT.

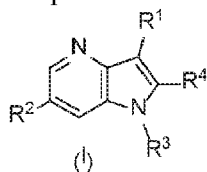
Realizările suplimentare ale acestei invenții includ metode de realizare ale compușilor cu Formula (I) și sărurilor acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I).

Un obiectiv al prezentei invenții este de a învinge sau ameliora cel puțin unul dintre dezavantajele metodologiilor convenționale și/sau din stadiul anterior al tehnicii, sau de a furniza o alternativă utilă la acestea.

Realizările suplimentare, caracteristicile, și avantajele invenției vor fi evidente din următoarea descriere detaliată și prin practicarea invenției.

Descriere detaliată al invenției

Intr-un aspect, în acest document sunt furnizați compuși cu Formula (I), și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi, sau solvați ai acestora,



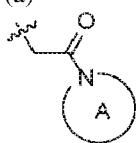
în care:

R^1 este selectat din grupul constând din: H, ^3H , halo, alchil C_{1-3} , și haloalchil C_{1-3} ;

R^2 este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ; piridinil substituit opțional cu halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , și -CN; tiazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ;

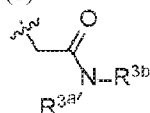
R^3 este selectat din grupul constând din:

(a)



în care inelul A este un heterocicloalchil cu 4-7 membri conținând opțional un heteroatom oxigen suplimentar, selectat din grupul constând din: azetidil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , CH_2OH , alcoxi C_{1-5} , OH, și CN; pirolidinil substituit opțional unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , alcoxi C_{1-5} , și OH; morfolino substituit opțional cu unu sau doi membri alchil C_{1-5} ; piperidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , alcoxi C_{1-5} , și OH; 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il; 5-azaspiro[2.3]hexan-5-il; și pirolidin-3-onă; sau

(b)



în care R^{3a} este H, sau alchil C_{1-5} ;

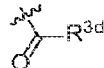
și R^{3b} este selectat din grupul constând din: alchil C_{1-5} substituit opțional cu OH, halo, sau OCH_3 ; haloalchil C_{1-5} ; benzil; CH_2 ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; și ciclobutil; sau

(c)



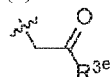
in care R^{3c} este selectat din grupul constand din: ciclopropil; ciclobutil; pirimidinil substituit opțional cu halo; piridinil; piridazinil; furanil substituit opțional cu haloalchil C_{1-5} ; oxazolil; izoxazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; oxadiazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; pirazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; triazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; tetrahydrofuranil; tetrahidropirasil; oxetanil; și oxiranil; sau

(d)



in care R^{3d} este CH_2 -ciclopropil sau ciclobutil; sau

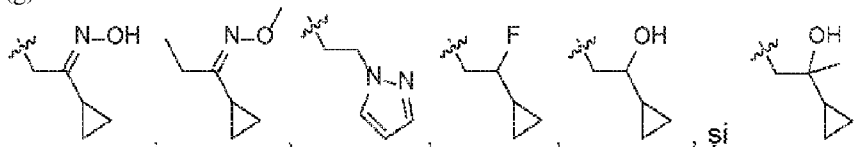
(e)



in care R^{3e} este selectat din grupul constand din: OH, alchil C_{1-5} , ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; sau

(f) alchil C_{1-5} substituit opțional cu OH sau alcoxi C_{1-5} ; $CH_2S(CH_3)$; $CH_2(S=O)CH_3$; $CH_2(SO_2)CH_3$; și $CH_2CH_2(C=O)CH_3$; sau

(g)



și

R^4 este H, ^2H sau alchil C_{1-3} .

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) in care R^1 este H, Cl, Br, F, sau CH_3 .

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^1 este H.

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^1 este Cl.

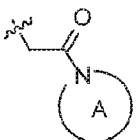
O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^1 este CH_3 .

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^2 este fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: Cl, F, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_2H , și CF_3 ; piridinil substituit opțional cu F, CN, CH_3 și CF_3 ; tiazolil substituit opțional cu CH_3 ; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: Cl, CH_3 , CH_2CH_3 , CHF_2 și CF_3 .

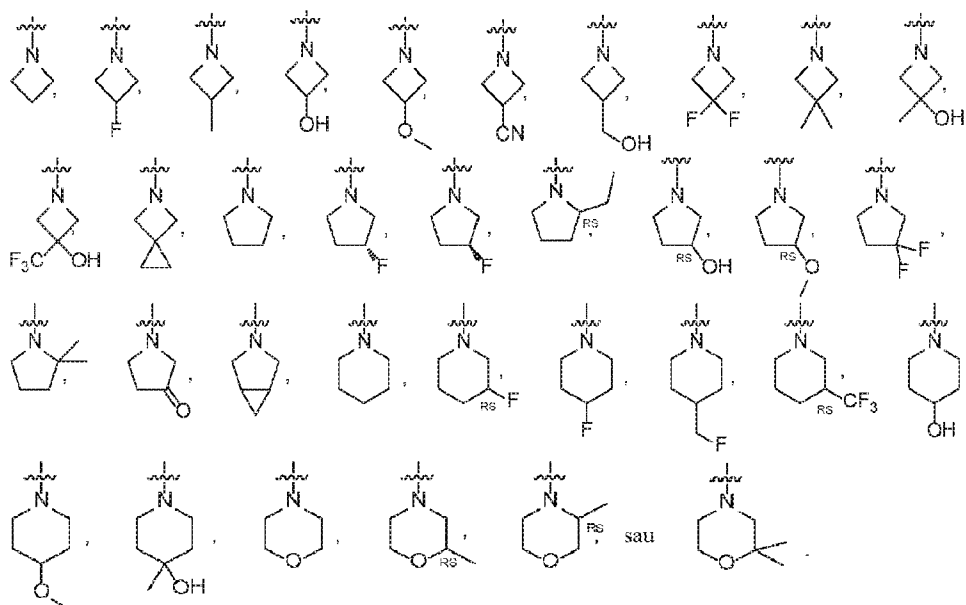
O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^2 este fenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, 3-etilfenil, 3-(difluorometil)fenil, 3-(trifluorometil)fenil, 3,5-dimetilfenil, 2,3-dimetilfenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 3-clorofenil, 4-fluorofenil, 2,3-difluorofenil, 2,4-difluorofenil, 3,4-difluorofenil, 3,4-diclorofenil, 2,5-difluorofenil, 3,5-difluorofenil, 3-cloro-2-fluoro-fenil, 3-cloro-4-fluoro-fenil, 2-fluoro-3-metil-fenil, 4-fluoro-2-metil-fenil, 2-metil-3-(trifluorometil)fenil, 2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil, 4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil, 4-fluoro-3-metilfenil, 2-fluoro-5-metil-fenil, 4-fluoro-2,3-dimetil-fenil, 2,4-difluoro-3-metil-fenil, 2,6-difluoro-3-metil-fenil, 2,3,4-trifluorofenil, 3,4,5-trifluorofenil, 2-tienil, 3-tienil, 5-metil-2-tienil, 4-metil-2-tienil, 5-etil-2-tienil, 5-cloro-2-tienil, 3-cloro-2-tienil, 4-cloro-2-tienil, 5-cloro-3-tienil, 5-(difluorometil)-2-tienil, 5-(trifluorometil)-2-tienil, 2,5-dimetil-3-tienil, 2,5-dicloro-3-tienil, 5-cloro-4-metil-2-tienil, 2,4,5-trimetil-3-tienil, 6-tiazol-5-il, 2-metiltiazol-5-il, 6-metil-3-piridil, 6-fluoro-3-piridil, piridin-2-carbonitril, 2-(trifluorometil)-4-piridil, 5-(trifluorometil)-3-piridil, 6-(trifluorometil)-2-piridil, sau benzotiofen-2-il.

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I), în care R^2 este fenil sau tienil, în care fenilul sau tienilul este substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} .

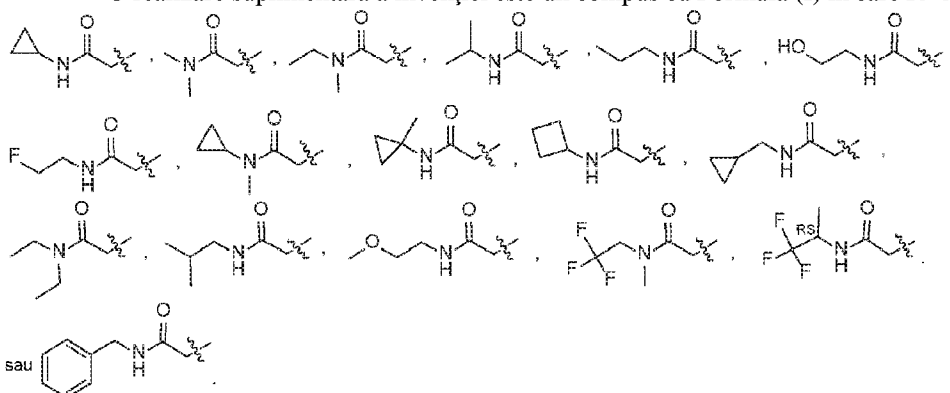
O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^3 este



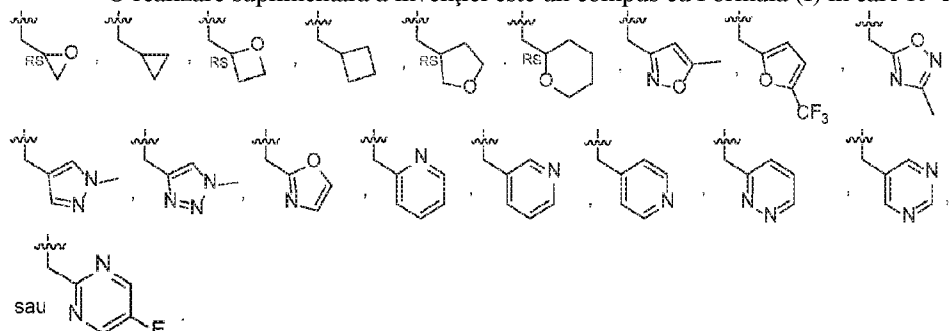
in care inel A este



5 O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^3 este



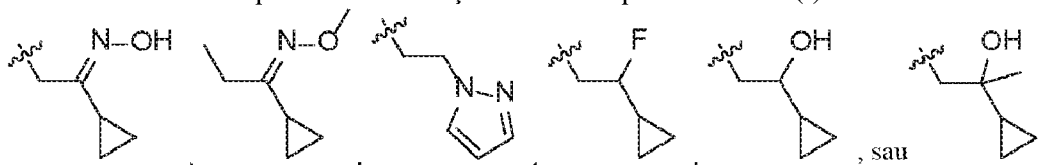
10 O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^3 este



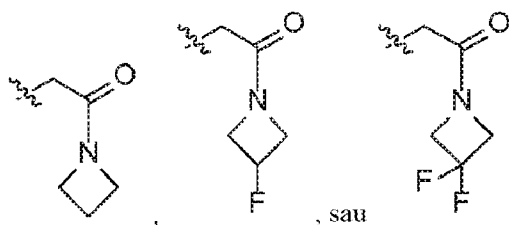
O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^3 este

15 $CH_2S(CH_3)$, $CH_2(S=O)CH_3$, $CH_2(SO_2)CH_3$, sau $CH_2CH_2(C=O)CH_3$.

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) R^3 este



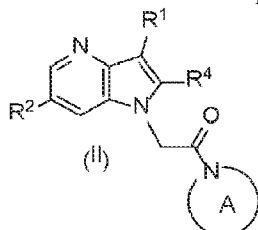
O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^3 este



O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) R^4 este H.

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) în care R^4 este CH_3 .

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având Formula (II):



5

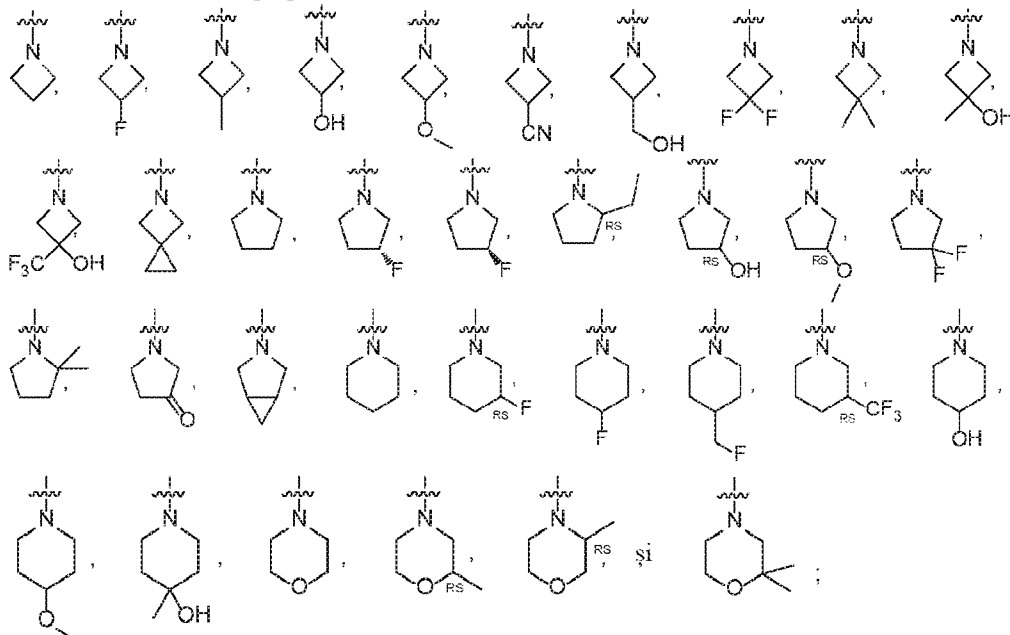
in care

R^1 este selectat din grupul constând din: H, ^3H , halo și alchil C_{1-3} ;

R^2 este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ; piridinil substituit opțional cu halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , și CN; tiazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; și tienil substituit opțional cu halo, sau alchil C_{1-5} ;

10

inel A este selectat din grupul constând din:

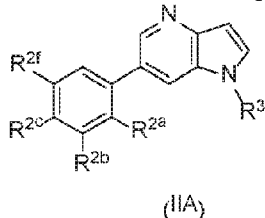


15

și R^4 este H, ^2H , sau CH_3 ;

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compuşilor cu Formula (II).

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având Formula (IIA):



20

in care

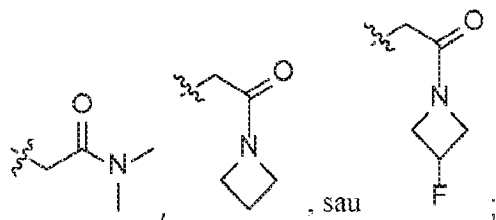
R^{2a} este H, sau F;

R^{2b} este H, F, CH_3 sau CH_2CH_3 ;

R^{2c} este H, F sau CH_3 ;

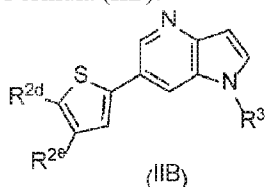
R^{2f} este H, F, sau CH_3 ; și

R^3 este



și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (IIA).

- 5 O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având structura cu Formula (IIB):

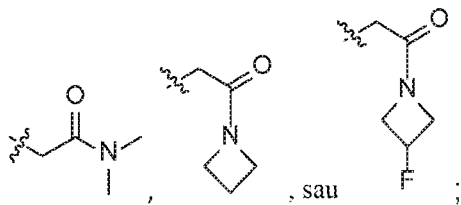


în care

R^{2d} este H, Cl, CH_3 sau CF_3 ;

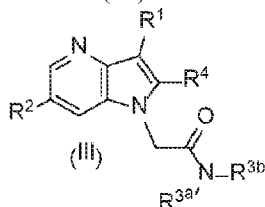
- 10 R^{2e} este H sau CH_3 ; și

R^3 este



și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (IIB).

- 15 O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având structura cu Formula (III):



în care

R^1 este H, ^3H , halo, $alchil_{C_{1-3}}$, sau $haloalchil_{C_{1-3}}$;

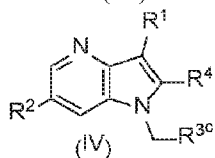
- 20 R^2 este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, $alchil_{C_{1-5}}$, și $haloalchil_{C_{1-5}}$; piridinil substituit opțional cu $haloalchil_{C_{1-5}}$; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre halo, $alchil_{C_{1-5}}$, sau $haloalchil_{C_{1-5}}$;

R^{3a} este H, sau $alchil_{C_{1-5}}$;

- 25 R^{3b} este selectat din grupul constând din: $alchil_{C_{1-5}}$ substituit opțional cu OH sau OCH_3 ; $haloalchil_{C_{1-5}}$; benzil; CH_2 ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu $alchil_{C_{1-5}}$; și ciclobutil; și R^4 este H, H^2 , sau CH_3 ;

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (III).

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având structura cu Formula (IV):

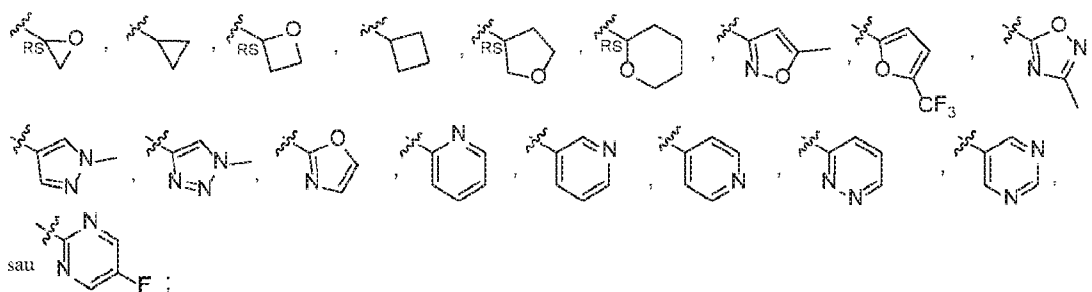


- 30

R^1 este H, sau halo;

R^2 este fenil substituit opțional cu unu, sau doi membri selectați în mod independent dintre: halo, $alchil_{C_{1-5}}$, și $haloalchil_{C_{1-5}}$; sau tienil substituit cu $alchil_{C_{1-5}}$;

R^{3c} este

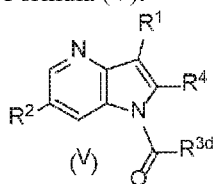


sau

și R^4 este H;

- 5 și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (IV).

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având structura cu Formula (V):



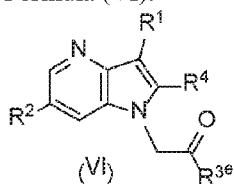
in care

- 10 R^1 și R^4 sunt H;
 R^2 este fenil substituit opțional cu doi halo; și
 R^{3d} este ciclobutil, sau CH_2 -ciclopropil;

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (V).

O realizare suplimentară a invenției este un compus cu Formula (I) având structura cu

- 15 Formula (VI):



R^1 este H sau halo;

R^2 este fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ; sau tienil substituit cu halo sau alchil C_{1-5} ;

- 20 R^{3e} este selectat din grupul constând din: OH, alchil C_{1-5} , ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo;

și

R^4 este H sau CH_3 ;

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (VI).

- 25 O realizare suplimentară a prezentei invenții este un compus așa cum se arată în Tabelul 1 de mai jos.

# Exemplu	Denumire compus
1	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;
2	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
3	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
4	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
5	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;
6	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
7	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
8	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
9	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
10	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
11	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
12	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
13	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
14	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;
15	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
16	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;

# Exemplu	Denumire compus
17	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
18	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
19	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
20	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
21	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
22	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
23	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
24	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
25	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
26	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
27	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
28	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
29	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
30	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
31	2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
32	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
33	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
34	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
35	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
36	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
37	2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
38	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
39	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
40	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
41	1-(Azetidin-1-il)-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
42	2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
43	N-Ciclopropil-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
44	2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
45	2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
46	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
47	1-(Azetidin-1-il)-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
48	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
49	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
50	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
51	N-Ciclopropil-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
52	2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;
53	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
54	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
55	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
56	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
57	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;
58	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
59	3-[[6-(4-Fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;
60	5-Metil-3-[[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;
61	Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;
62	Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;
63	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;
64	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;
65	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;
66	Sare trifluoroacetat de N-ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

# Exemplu	Denumire compus
67	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
68	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
69	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
70	Acid 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic;
71	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
72	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
73	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
74	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
75	N-Ciclopropil-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
76	N-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
77	N-Ciclopropil-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
78	2-(6-Fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
79	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
80	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
81	2-[6-(m-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
82	2-[6-(p-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
83	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
84	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
85	1-Morfolino-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
86	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
87	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
88	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
89	1-Morfolino-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
90	1-Morfolino-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
91	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
92	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
93	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
94	2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
95	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
96	2-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
97	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
98	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
99	N-Ciclopropil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
100	N-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
101	N-Ciclopropil-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
102	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
103	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
104	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
105	2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
106	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
107	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
108	2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
109	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
110	N-Ciclopropil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
111	N-Ciclopropil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
112	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-metil-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
113	5-[1-[2-(Azetidin-1-il)-2-oxo-etil]pirolo[3,2-b]piridin-6-il]piridin-2-carbonitril;
114	6-(3,4-Difluorofenil)-1-(pirimidin-5-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
115	6-(3,4-Difluorofenil)-1-[(5-fluoropirimidin-2-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
116	Ciclobutil-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metanonă;
117	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
118	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
119	2-Ciclopropil-1-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
120	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

# Exemplu	Denumire compus
121	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
122	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
123	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
124	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
125	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
126	1-Morfolino-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
127	1-Morfolino-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
128	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
129	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
130	6-(4-Metil-2-tienil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
131	6-(3,4-Difluorofenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
132	2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
133	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
134	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
135	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
136	1-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
137	6-(4-Metil-2-tienil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;
138	6-(3,4-Difluorofenil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;
139	N,N-Dimetil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
140	1-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
141	1-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
142	1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
143	3,3-Dimetil-1-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
144	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
145	1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
146	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
147	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
148	2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
149	2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
150	2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
151	2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N, N-dimetil-acetamidă;
152	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
153	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
154	Sare trifluoroacetat de N-ciiciclopropil-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
155	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
156	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
157	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
158	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
159	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
160	N-Ciclopropil-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
161	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
162	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
163	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
164	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
165	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
166	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
167	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
168	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
169	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-

# Exemplu	Denumire compus
	b]piridin-1-il]etanonă;
170	Sare trifluoroacetat de 1-butil-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
171	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-izopentil-pirol[3,2-b]piridină;
172	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(3-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
173	Sare trifluoroacetat de 1-(ciclobutilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
174	Sare trifluoroacetat de 1-(ciclopropilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
175	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
176	Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
177	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
178	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
179	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(4-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
180	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
181	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-pirazol-1-ilet)pirolo[3,2-b]piridină;
182	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
183	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(pirimidin-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
184	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxetan-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
185	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
186	Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
187	Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
188	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-1-piperidil)etanonă;
189	Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
190	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-metoxi-1-piperidil)etanonă;
191	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-fluoro-1-piperidil)etanonă;
192	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[4-(fluorometil)-1-piperidil]etanonă;
193	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(1-piperidil)etanonă;
194	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(2-metilmorfolin-4-il)etanonă;
195	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(trifluorometil)-1-piperidil]etanonă;
196	Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(2-etilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
197	Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilmorfolin-4-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
198	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxipirolidin-1-il)etanonă;
199	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoro-1-piperidil)etanonă;
200	Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilpirolidin-1-il)-2-[6-(4fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
201	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;
202	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-3-metil-azetidin-1-il)etanonă;
203	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-hidroxi-3-(trifluorometil)azetidin-1-

# Exemplu	Denumire compus
	il]etanonă;
204	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
205	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
206	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(hidroximetil)azetidin-1-il]etanonă;
207	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă;
208	Sare trifluoroacetat de 1-(5-azaspiro[2.3]hexan-5-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
209	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-4-metil-1-piperidil)etanonă;
210	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil)-fenil))pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilmorfolin-4-il)etanonă;
211	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiazetidin-1-il)etanonă;
212	1-[2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]azetidin-3-carbonitril;
213	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
214	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilazetidin-1-il)etanonă;
215	1-(3,3-Dimetilazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
216	Sare trifluoroacetat de 1-[2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]pirolidin-3-onă;
217	1-(3,3-Difluoropirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
218	(R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxipirolidin-1-il)etanonă;
219	1-Ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
220	1-Ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
221	1-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
222	1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
223	1-[6-(4-Fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
224	1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
225	1-[6-(2,3-Dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
226	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-fenil-etanonă;
227	1-(4-Fluorofenil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
228	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluorofenil)-1-(tetrahidropiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
229	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izopropil-acetamidă;
230	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-propil-acetamidă;
231	(R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2,2,2-trifluoro-1-metil)-etil)acetamidă;
232	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(1-metilciclopropil)acetamidă;
233	N-(2-Fluoroetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
234	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izobutil-acetamidă;
235	5-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;
236	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
237	N-(Ciclopropilmetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
238	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metil)triazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
239	5-[[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;
240	3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
241	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclobutil-etanonă;
242	1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
243	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
244	Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
245	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
246	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
247	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
248	N-Ciclopropil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
249	N-Ciclopropil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
250	N-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
251	N-Benzil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
252	2-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]oxazol;

# Exemplu	Denumire compus
253	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-hidroxietyl)acetamidă;
254	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-metoxietyl)acetamidă;
255	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
256	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
257	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
258	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
259	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
260	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
261	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
262	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
263	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
264	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
265	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
266	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
267	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
268	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
269	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
270	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
271	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
272	(R/S)-1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-ol;
273	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiacetidin-1-il)etanonă;
274	(R/S)-1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanol;
275	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-ciclopropil-1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]propan-2-ol;
276	1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metoxi-etanimină;
277	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
278	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
279	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
280	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
281	2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
282	2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
283	2-[6-(5-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
284	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
285	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
286	Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă oximă;
287	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
288	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
289	(R/S)-1-(2-Ciclopropil-2-fluoro-etil)-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridină;
290	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă;
291	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-metoxietyl)pirolo[3,2-b]piridină;
292	1-Ciclobutil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
293	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;

# Exemplu	Denumire compus
294	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3S)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;
295	Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
296	N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
297	N, N-Dietil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
298	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
299	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropiletanonă;
300	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropiletanonă;
301	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
302	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
303	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
304	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
305	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
306	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
307	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
308	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
309	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
310	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
311	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
312	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
313	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
314	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
315	2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
316	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
317	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
318	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;
319	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
320	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
321	1-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
322	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
323	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
324	1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
325	1-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
326	1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
327	1-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
328	1-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
329	1-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
330	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfanilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
331	(R/S)-6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
332	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
333	1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
334	1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
335	1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
336	1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
337	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
338	1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
339	1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
340	4-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
341	1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
342	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
343	1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
344	1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
345	1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
346	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
347	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

# Exemplu	Denumire compus
348	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
349	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
350	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
351	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
352	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
353	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
354	1-(Azetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
355	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
356	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
357	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
358	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
359	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
360	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
361	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
362	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
363	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
364	1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
365	1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
366	N-Ciclopropil-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
367	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
368	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
369	2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
370	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
371	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
372	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
373	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
374	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
375	N,N-Dimetil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
376	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
377	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
378	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
379	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
380	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
381	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
382	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
383	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
384	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;
385	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
386	Sare trifluoroacetat de N,N-dimetil-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
387	2-[3-Fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
388	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
389	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
390	2-[3-Fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
391	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
392	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
393	2-[6-(5-Etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
394	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
395	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
396	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
397	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
398	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-

# Exemplu	Denumire compus
	fluoroazetidin-1-il)etanonă;
399	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
400	N,N-Dimetil-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
401	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
402	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
403	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
404	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-metiltiazol-5-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
405	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-tiazol-5-ylpirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
406	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-fluoro-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
407	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
408	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
409	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
410	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
411	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;
412	2-[3-Cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
413	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
414	2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
415	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;
416	2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
417	2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
418	2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
419	N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
420	2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
421	2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
422	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
423	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
424	2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
425	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
426	2-[6-(5-Cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
427	2-[6-(2,5-Dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
428	N,N-Dimetil-2-[6-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
429	2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
430	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
431	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
432	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
433	N,N-Dimetil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
434	N,N-Dimetil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
435	N,N-Dimetil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
436	2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
437	N,N-Dimetil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
438	N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
439	2-[6-(5-Cloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
440	2-[6-(2,5-Dicloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
441	N,N-Dimetil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
442	N,N-Dimetil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
443	N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
444	2-[6-(2,6-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
445	2-[6-(2-Fluoro-5-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
446	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
447	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
448	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
449	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
450	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
451	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
452	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

# Exemplu	Denumire compus
453	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
454	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
455	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
456	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
457	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
458	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
459	N-Etil-N-metil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
460	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
461	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;
462	N-Etil-N-metil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
463	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
464	N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
465	2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
466	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
467	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
468	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
469	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;
470	N-Etil-N-metil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
471	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
472	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
473	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
474	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
475	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
476	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
477	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
478	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
479	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
480	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
481	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
482	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
483	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
484	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
485	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
486	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
487	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
488	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
489	2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
490	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
491	2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
492	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
493	2-[3-Fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
494	2-[3-Fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
495	2-(3-Fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;
496	2-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
497	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
498	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
499	2-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
500	2-[3-Fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
501	2-[3-Fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
502	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
503	2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
504	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

# Exemplu	Denumire compus
505	2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
506	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
507	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
508	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
509	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
510	2-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
46	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
512	2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
513	2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
514	2-(3-Cloro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;
515	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
516	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
517	2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
518	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
519	2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
520	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
521	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
522	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
523	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
524	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
525	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
526	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-clorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
527	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
528	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
529	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
530	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
531	2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
532	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
533	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-etilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
534	2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
535	2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
536	2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
537	2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
538	2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
539	2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
540	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
541	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
542	2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
543	2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
544	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
545	2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
546	2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
547	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-2-metil-6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
548	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
549	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
550	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
551	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
552	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
553	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
554	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
555	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
556	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
557	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;

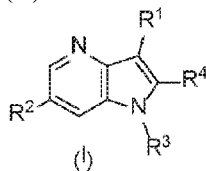
# Exemplu	Denumire compus
558	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
559	N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
560	N-Etil-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
561	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
562	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
563	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
564	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
565	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
566	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
567	2-[3-Metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
568	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
569	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
570	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
571	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
572	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
573	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
574	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
575	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
576	N,N-Dimetil-2-(3-metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
577	N-Etil-N-metil-2-(3-metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
578	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
579	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
580	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
581	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
582	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
583	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
584	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
585	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
586	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
587	N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
588	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
589	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
590	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
591	2-[3-Metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
592	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
593	2-[6-(2-Fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
594	N-Etil-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
595	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
596	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
597	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
598	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
599	2-[3-Cloro-6-(2,5-dimetil-3-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
600	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
601	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
602	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-4-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
603	2-[3-Cloro-6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
604	2-[6-(Benzotiofen-2-il)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
605	2-[3-Fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
606	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

# Exemplu	Denumire compus
607	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
608	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
609	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-[³ H]-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1 H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
610	2-[2-Deuterio-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
611	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
612	3-Cloro-1-(3-piridilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
613	1-(Piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
614	3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
615	3-Cloro-1-(piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
616	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
617	N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;
618	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
619	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
620	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;
621	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
622	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
623	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
624	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
625	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;
626	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
627	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
628	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
629	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
630	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
631	2-[3-Metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
632	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
633	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
634	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
635	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
636	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
637	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
638	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă; și
639	2-[6-[5-(Difluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi, sau solvați ai acestuia.

O realizare suplimentară a invenției este o compoziție farmaceutică cuprinzând:

(A) o cantitate eficientă din cel puțin un compus selectat dintre compuși cu Formula (I):



5

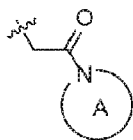
in care

R¹ este selectat din grupul constand din: H, ³H, halo, alchil_{C1-3}, și haloalchil_{C1-3};

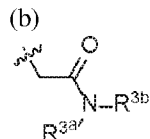
10 R² este selectat din grupul constand din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil_{C1-5}, și haloalchil_{C1-5}; piridinil substituit opțional cu halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, și -CN; tiazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; benzoțiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil_{C1-5}, și haloalchil_{C1-5};

R³ este selectat din grupul constand din:

(a)



in care inelul A este un heterocicloalchil cu 4-7 membri conținând opțional un heteroatom oxigen suplimentar selectat din grupul constând din: azetidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, CH₂OH, alcoxil_{C1-5}, OH, și CN; pirolidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, alcoxil_{C1-5}, și OH; morfolino substituit opțional cu unu sau doi membri alchil_{C1-5}; piperidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil_{C1-5}, haloalchil_{C1-5}, alcoxil_{C1-5}, și OH; 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il; 5-azaspiro[2.3]hexan-5-il; și pirolidin-3-onă; sau

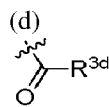


in care R^{3a} este H, sau alchil_{C1-5};

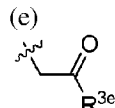
și R^{3b} este selectat din grupul constând din: alchil_{C1-5} substituit opțional cu OH, halo, sau OCH₃; haloalchil_{C1-5}; benzil; CH₂ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; și ciclobutil; sau



in care R^{3c} este selectat din grupul constând din: ciclopropil; ciclobutil; pirimidinil substituit opțional cu halo; piridinil; piridazinil; furanil substituit opțional cu haloalchil_{C1-5}; oxazolil; izoxazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; oxadiazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; pirazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; triazolil substituit opțional cu alchil_{C1-5}; tetrahydrofuranil; tetrahidropirasil; oxetanil; și oxiranil; sau



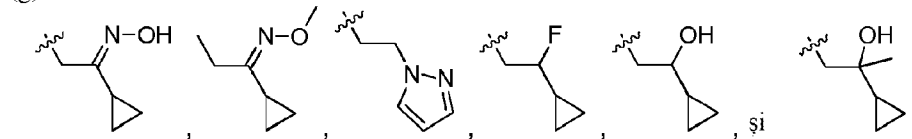
in care R^{3d} este CH₂-ciclopropil sau ciclobutil; sau



in care R^{3e} este selectat din grupul constând din: OH, alchil_{C1-5}, ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; sau

(f) alchil_{C1-5} substituit opțional cu OH sau alcoxil_{C1-5}; CH₂S(CH₃); CH₂(S=O)CH₃; CH₂(SO₂)CH₃; și CH₂CH₂(C=O)CH₃; sau

(g)



și

R⁴ este H, ²H sau alchil_{C1-5},

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (I);

și (B) cel puțin un excipient acceptabil farmaceutic.

O realizare suplimentară a invenției este o compoziție farmaceutică cuprinzând o cantitate eficientă din cel puțin un compus cu Formula (IIA), precum și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (IIA) și cel puțin un excipient acceptabil farmaceutic.

O realizare suplimentară a invenției este o compoziție farmaceutică cuprinzând o cantitate eficientă din cel puțin un compus cu Formula (IIB), precum și din săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor cu Formula (IIB) și cel puțin un excipient acceptabil farmaceutic.

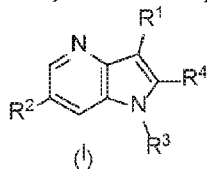
O realizare suplimentară a invenției este o compoziție farmaceutică cuprinzând o cantitate eficientă din cel puțin un compus din Tabelul 1, precum și din săruri acceptabile

farmaceutic, N-oxizi sau solvați ai compușilor din Tabelul 1 și cel puțin un excipient acceptabil farmaceutic.

De asemenea în domeniul invenției sunt enantiomeri și diastereomeri ai compușilor cu Formula (I) (precum și ai Formulelor (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)). De asemenea în domeniul invenției sunt sărurile acceptabile farmaceutic, N-oxizii sau solvații compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)). Prezenta divulgare furnizează de asemenea promedicamente acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), și metaboliți activi farmaceutic ai compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)).

De asemenea în domeniul invenției sunt variante izotopice ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formule (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), cum ar fi, de exemplu, compuși deuterati cu Formula (I). De asemenea în domeniul invenției sunt sărurile acceptabile farmaceutic, N-oxizii sau solvații variantelor izotopice ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)). Prezenta divulgare furnizează de asemenea promedicamente acceptabile farmaceutic ale variantelor izotopice ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), și metaboliți farmaceutici activi ai variantelor izotopice ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formule (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)).

O realizare suplimentară a invenției este un compus pentru utilizare într-o metodă de tratare a unui subiect care suferă sau este diagnosticat cu o boală, tulburare, sau afecțiune medicală mediată de activitatea receptorului NR2B, cuprinzând administrarea la un subiect care are nevoie de un astfel de tratament a unei cantități eficiente de compus menționat, în care compusul menționat este cel puțin un compus selectat dintre compuși cu Formula (I):

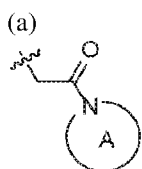


in care

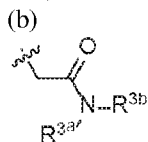
R^1 este selectat din grupul constând din: H, ^3H , halo, alchil C_{1-3} , și haloalchil C_{1-3} ;

R^2 este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ; piridinil substituit opțional cu halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , și -CN; tiazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ;

R^3 este selectat din grupul constând din:



in care inelul A este un heterocicloalchil cu 4-7 membri conținând opțional un heteroatom oxigen suplimentar selectat din grupul constând din: azetidil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , CH_2OH , alcoxi C_{1-5} , OH, și CN; pirolidinil substituit opțional unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , alcoxi C_{1-5} , și OH; morfolino substituit opțional cu unu sau doi membri alchil C_{1-5} ; piperidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchil C_{1-5} , haloalchil C_{1-5} , alcoxi C_{1-5} , și OH; 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il; 5-azaspiro[2.3]hexan-5-il; și pirolidin-3-onă; sau



in care R^{3a} este H, sau alchil C_{1-5} ;

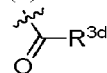
și R^{3b} este selectat din grupul constând din: alchil C_{1-5} substituit opțional cu OH, halo, sau OCH_3 ; haloalchil C_{1-5} ; benzil; CH_2 ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; și ciclobutil; sau



în care R^{3c} este selectat din grupul constând din: ciclopropil; ciclobutil; pirimidinil substituit opțional cu halo; piridinil; piridazinil; furanil substituit opțional cu haloalchil C_{1-5} ; oxazolil; izoxazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; oxadiazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; pirazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; triazolil substituit opțional cu alchil C_{1-5} ; tetrahidrofuranil; tetrahidropiraniil; oxetaniil; și oxiraniil; sau

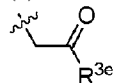
5

(d)



în care R^{3d} este CH_2 -ciclopropil sau ciclobutil; sau

(e)



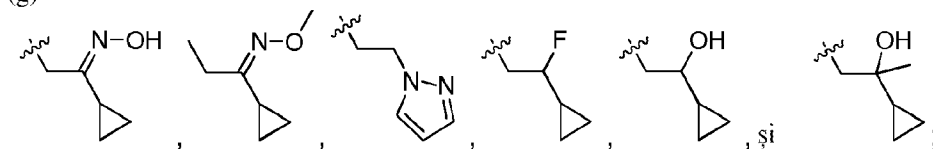
10

în care R^{3e} este selectat din grupul constând din: OH, alchil C_{1-5} , ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; sau

(f) alchil C_{1-5} substituit opțional cu OH sau alcoxi C_{1-5} ; $CH_2S(CH_3)$; $CH_2(S=O)CH_3$; $CH_2(SO_2)CH_3$; și $CH_2CH_2(C=O)CH_3$; sau

15

(g)



și

R^4 este H, ^2H sau alchil C_{1-3} ;

20

și săruri acceptabile farmaceutic, N-oxizi, sau solvați ai acestuia, la un subiect care are nevoie de aceasta.

25

O realizare suplimentară a invenției este un compus pentru utilizare într-o metodă de tratare a unui subiect care suferă sau este diagnosticat cu o boală, tulburare, sau afecțiune medicală mediată de activitatea receptorului NR2B, cuprinzând administrarea la un subiect care are nevoie de un astfel de tratament a unei cantități eficiente de compus menționat, în care compusul menționat este cel puțin un compus selectat dintre compuși cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), enantiomeri și diastereomeri ai compușilor cu Formula (I), variante izotopice ale compușilor cu Formula (I), și săruri acceptabile farmaceutic ale tuturor celor de mai sus.

30

În realizări preferate ale metodei inventive, boala, tulburarea, sau afecțiunea medicală este selectată dintre: tulburări neurologice și psihiatrice incluzând, dar nu limitat la: (1) tulburări de dispoziție și tulburări afective de dispoziție; (2) tulburări nevrotice, legate de stres și somatoforme, incluzând tulburări de anxietate; (3) tulburări de dezvoltare psihologică; (4) sindroame comportamentale asociate cu tulburări fiziologice și factori fizici; (5) tulburări extrapiramidale și de mișcare; (6) tulburări episodice și paroxistice, epilepsie; (7) durere; (8) forme de neurodegenerare; (9) boli cerebrovasculare, acute și cronice; și orice sechele ale bolilor cerebrovasculare.

35

Exemplele de tulburări de dispoziție și tulburări afective de dispoziție care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la, tulburare I bipolară în formă depresivă, hipomanicală, manicală și mixtă; tulburare bipolară II; tulburări depresive, cum ar fi episoade depresive singure sau tulburare depresivă majoră recurentă, tulburare depresivă minoră, depresie rezistentă la tratament, tulburare depresivă cu debut postpartum, tulburări depresive cu simptome psihotice; tulburări de dispoziție persistente, cum ar fi ciclotimia, distimia, eutimia; și tulburare dismorfică premenstruală.

40

Exemplele de tulburări care aparțin tulburărilor nevrotice, legate de stres și somatoforme, care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la, tulburări de anxietate, tulburare de anxietate generală, tulburare de panică cu sau fără agorafobie, fobie specifică, tulburare de anxietate socială, tulburări de anxietate cronică; tulburare obsesiv-compulsivă; tulburări de reacție și adaptare la stres sever, cum ar fi tulburare de stres post-traumatic (PTSD); alte tulburări nevrotice cum ar fi sindrom de depersonalizare-derealizare.

50

Exemplele de tulburări de dezvoltare psihologică care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la acestea, tulburări de dezvoltare obișnuite, incluzând, dar fără a se limita la sindromul Asperger și sindromul Rett, tulburări de autism, autism în copilărie și tulburări de hiperactivitate asociate cu retard mental și mișcări stereotipe, tulburare specifică de dezvoltare a funcției motorii, tulburări specifice de dezvoltare a abilităților școlare.

Exemplele de sindroame comportamentale asociate cu tulburări fiziologice și factori fizici în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la tulburări mentale și de comportament asociate cu nașterea, incluzând, dar fără a se limita la depresie postnatală (postpartum) și prenatală; tulburări de alimentație, incluzând, dar fără a fi limitate la acestea, anorexie nervoasă, bulimie nervoasă, tulburare de comportament alimentar pica și binge.

Exemple de tulburări extrapiramidale și de mișcare care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la acestea, boală Parkinson; Parkinsonism secundar, cum ar fi Parkinsonism postencefalic; Parkinsonism cuprins în alte tulburări; boala cu corpi Lewis; boli degenerative ale ganglionilor bazali; alte tulburări extrapiramidale și de mișcare incluzând dar nu limitat la tremur, tremur esențial și tremur indus de medicament, mioclonus, coree și coree indusă de medicament, ticuri induse de medicament și ticuri de origine organică, distonie acută indusă de medicament, dischinezie tardivă indusă de medicament, dischinezie indusă de L-dopa; tulburări de mișcare induse de neuroleptice incluzând dar nu limitat la sindrom neuroleptic malign (NMS), parkinsonism indus de neuroleptic, dischinezie cu debut timpuriu sau dischinezie acută indusă de neuroleptic, distonie acută indusă de neuroleptic, akatizie acută indusă de neuroleptic, dischinezie tardivă indusă de neuroleptic, tremur indus de neuroleptic; sindromul picioarelor neliniștite, sindromul omului rigid.

Alte exemple de tulburări de mișcare cu malfuncție și/sau degenerare a ganglionilor bazali, care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la distonie incluzând dar nu limitat la distonie focală, distonie multiplu-focală sau segmentară, distonie de torsione, distonie emisferică, generalizată și tardivă (indusă de medicamente psihofarmacologice). Distonia focală include distonie cervicală (torticolis), blefarospasm (crampele pleoapei), distonie apendiculară (crampe în extremități, precum crampele scriitorului), distonie oromandibulară și disfonie spasmodică (crampe ale corzilor vocale);

Exemplele de tulburări episodice și paroxistice care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la epilepsie, incluzând epilepsie idiopatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii cu debut localizat, epilepsie simptomatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii parțiale simple, epilepsie simptomatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii parțiale complexe, epilepsie idiopatică și sindroame epileptice generalizate incluzând dar nu limitat la epilepsie mioclonică în pruncie, convulsii neonatale (familiale), absență epileptică în copilărie (picnolepsie), epilepsie cu convulsii grand mal la trezire, absență epileptică, epilepsie mioclonică (petit mal impulsivă) și convulsii epileptice nespecifice, atonice, clonice, mioclonice, tonice, tonic-clonice.

Alte exemple de epilepsie care pot fi tratate în conformitate cu prezenta invenție includ, dar nu sunt limitate la epilepsie cu absențe mioclonice, convulsii mioclonice-astatice, spasme infantile, sindrom Lennox-Gastaut, atacuri Salaam, encefalopatie mioclonică timpurie simptomatică, sindrom West, convulsii petit și grand mal; stare epileptică.

Exemplele de durere includ, dar nu sunt limitate la tulburări de durere legată de factori psihologici, cum ar fi tulburări somatoforme persistente; durere acută, cronică și cronică intractabilă, durere de cap; durere acută și cronică legată de procese fiziologice și tulburări fizice incluzând dar nu limitat la durere de spate, durere de dinți, durere abdominală, durere de șale, durere în articulații; durere acută și cronică care este legată de boli ale sistemului musculoscheletal și țesutului conjunctiv incluzând, dar nu limitat la reumatism, mialgie, neuralgie și fibromialgie; durere acută și cronică care este legată de tulburări ale nervilor, rădăcinii și plexului nervos, cum ar fi durerea de trigemen, nevralgie postzoster, sindromul membrului fantomă cu durere, sindromul de tunel carpian, leziuni ale nervului sciatic, mononeuropatie diabetică; durere acută și cronică care este legată de polineuropatii și alte tulburări ale sistemului nervos periferic, cum ar fi neuropatie ereditară și idiopatică, polineuropatie inflamatorie, polineuropatie indusă de medicamente, alcool sau agenți toxici, polineuropatie în boală neoplazică, polineuropatie diabetică. Exemplele de boli care includ forme de neurodegenerare includ, dar nu sunt limitate la, neurodegenerare acută, cum ar fi leziuni ale creierului intracraniale, cum ar fi accident vascular cerebral, leziuni difuze și locale ale creierului, hemoragie epidurală, subdurală și subarahnoidă, și neurodegenerare cronică, cum ar fi boală Alzheimer, boală Huntington, scleroză multiplă și ALS.

Exemplele de boli cerebrovasculare includ, dar nu sunt limitate la, hemoragie subarahnoidiană, hemoragie intracerebrală și altă hemoragie intracraniană non-traumatică, infarct cerebral, accident vascular cerebral, ocluzie și stenoza a arterelor precerebrale și cerebrale, care nu rezultă din infarctul cerebral, disecția arterelor cerebrale, anevrism cerebral, ateroscleroză cerebrală, leucoencefalopatie vasculară progresivă, encefalopatie hipertensivă, tromboză nepiogenă a sistemului venos intracranial, arterită cerebrală, angiopatie amiloidă cerebrală și orice sechele ale bolilor cerebrovasculare.

În unele realizări, administrarea unui compus al invenției, sau a unei sări acceptabile farmaceutic a acestuia, este eficientă în prevenirea bolii; de exemplu, prevenirea unei boli, afecțiuni sau tulburări la un individ care poate fi predispus la boală, afecțiune sau tulburare dar încă nu experimentează sau afișază patologia sau simptomatologia bolii.

Realizările suplimentare, caracteristicile, și avantajele invenției vor fi evidente din următoarea descriere detaliată și prin practica invenției.

Invenția poate fi apreciată mai complet prin referire la descrierea următoare, incluzând următorul glosar de termeni și exemplele de concluzionare.

Așa cum s-a utilizat în acest document, termenii „incluzând“, „conținând“ și „cuprinzând“ sunt utilizați în acest document în sensul lor deschis, nelimitativ. Termenul „alchil“ se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 12 atomi de carbon în catenă. Exemplele de grupări alchil includ metil (Me, care de asemenea poate fi reprezentat structural prin simbolul, “/”), etil (Et), n-propil, izopropil, butil, izobutil, *sec*-butil, *terț*-butil (tBu), pentil, izopentil, *terț*-pentil, hexil, izohexil, și grupări care având în vedere calificarea în domeniu și cunoștințele furnizate aici vor fi considerate echivalente pentru oricare dintre exemplele de mai sus. Termenul alchil_{C1-3} așa cum s-a utilizat în acest document se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 3 atomi de carbon în catenă. Termenul alchil_{C1-5} așa cum s-a utilizat în acest document se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 5 atomi de carbon în catenă.

Termenul „alcoxi“ include o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată cu un oxigen terminal care leagă gruparea alchil la restul moleculei. Alcoxi include metoxi, etoxi, propoxi, izopropoxi, butoxi, t-butoxi, pentoxi și altele asemănătoare.

Termenul „aril“ se referă la un carbociclu aromatic monociclic, (structură inelară având toți atomii din inel carbon) având 6 atomi pe inel. (Atomii de carbon din grupările aril sunt hibridizați sp^2 .)

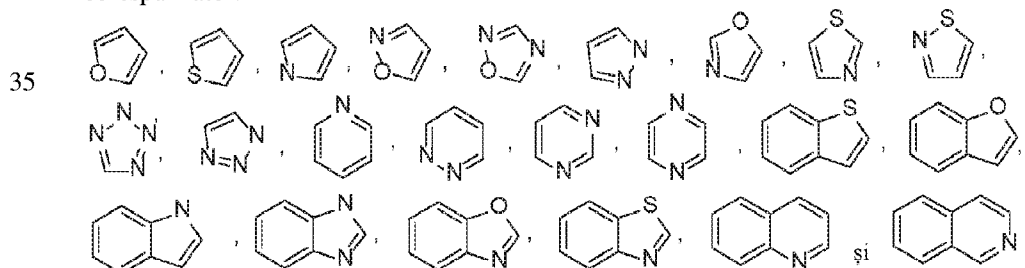
Termenul „fenil“ reprezintă următorul radical:



Termenul „tienil“ reprezintă următorul radical:

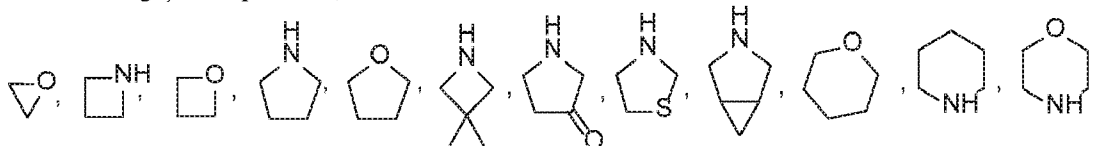


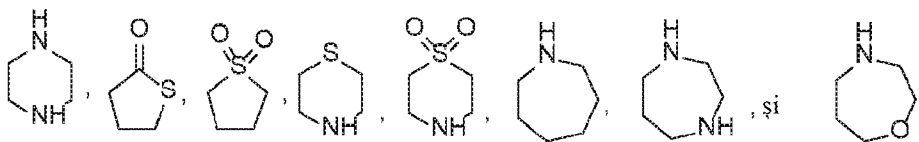
Termenul „heteroaril“ se referă la un heterociclu monociclic sau biciclic fuzionat (structura inelară având atomii din inel selectați dintre atomi de carbon și până la patru heteroatomi selectați dintre azot, oxigen, și sulf) care are de la 3 până la 9 atomi în inel pe heterociclu. Exemplele ilustrative de grupări heteroaril includ următoarele entități, în formă de radicali legați corespunzător:



Cei calificați în domeniu vor recunoaște că speciile de grupări heteroaril, cicloalchil, aril și heterocicloalchil listate sau ilustrate mai sus nu sunt exhaustive, și că pot fi selectate de asemenea specii suplimentare din domeniul acestor termeni definiți.

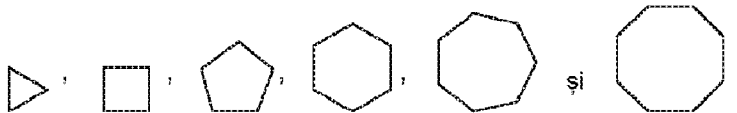
Un „heterocicloalchil“ se referă la o structură de inel monociclic care este saturat sau parțial saturat și are de la 4 până la 7 atomi în inel pe structură inelară, selectați dintre atomii de carbon și până la doi heteroatomi selectați dintre azot, oxigen și sulf. Structura inelului poate conține opțional până la două grupări oxo pe membrii sulf din inel. Entitățile ilustrative, în formă de radicali legați corespunzător, includ:





Termenul „ciano“ se referă la gruparea -CN.

Termenul „cicloalchil“ se referă la un carbociclu monociclic, policiclic fuzionat, sau spiro policiclic, saturat sau parțial saturat, având de la 3 până la 12 atomi în inel pe carbociclu. Exemplele ilustrative de grupări cicloalchil includ următoarele entități, în formă de radicali legați corespunzător:



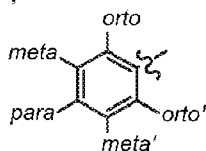
Termenul „halo“ reprezintă cloro, fluoro, bromo sau iodo.

Termenul „perhaloalchil“ sau „haloalchil“ se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 5 atomi de carbon în catenă care substituie opțional hidrogenii cu halogeni. Termenul „haloalchil_{C1-3}“ așa cum s-a utilizat în acest document se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 3 atomi de carbon în catenă, care substituie opțional hidrogenii cu halogeni. Termenul „haloalchil_{C1-5}“ așa cum s-a utilizat în acest document se referă la o grupare alchil cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 5 atomi de carbon în catenă, care substituie opțional hidrogenii cu halogeni. Exemplele de grupări „perhaloalchil“, „haloalchil“ includ trifluorometil (CF₃), difluorometil (CF₂H), monofluorometil (CH₂F), pentafluoroetil (CF₂CF₃), tetrafluoroetil (CHF₂CF₃), monofluoroetil (CH₂CH₂F), trifluoroetil (CH₂CF₃), tetrafluorotrifluorometiletil (-CF(CF₃)₂), și la grupări care având în vedere calificarea în domeniu și cunoștințele furnizate aici vor fi considerate echivalente pentru oricare dintre exemplele de mai sus.

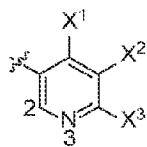
Termenul „perhaloalcoxi“ sau „haloalcoxi“ se referă la o grupare alcoxi cu catenă liniară sau ramificată având de la 1 până la 5 atomi de carbon în catenă care substituie opțional hidrogenii cu halogeni. Exemplele de grupări perhaloalcoxi includ trifluorometoxi (OCF₃), difluorometoxi (OCF₂H), monofluorometoxi (OCH₂F), monofluoroetoxi (OCH₂CH₂F), pentafluoroetoxi (OCF₂CF₃), tetrafluoroetoxi (OCHF₂CF₃), trifluoroetoxi (OCH₂CF₃), tetrafluorotrifluorometiletoxi (-OCF(CF₃)₂), și grupări care având în vedere calificarea în domeniu și cunoștințele furnizate aici vor fi considerate echivalente pentru oricare dintre exemplele de mai sus.

Termenul „substituit“ înseamnă că gruparea sau radicalul specificat poartă unul sau mai mulți substituenți. Termenul „nesubstituit“ înseamnă că gruparea specificată nu poartă substituenți. Termenul „substituit opțional“ înseamnă că gruparea specificată este nesubstituită sau substituită cu unul sau mai mulți substituenți. Acolo unde termenul „substituit“ este utilizat pentru a descrie un sistem structural, substituția se înțelege că apare la orice poziție permisă de valență pe sistem. În cazurile în care un radical sau grupare specificată nu este în mod special notată ca fiind substituită opțional sau substituită cu orice substituent specificat, se înțelege că un astfel de radical sau grupare se intenționează să fie nesubstituită.

Termenii „para“, „meta“, și „orto“ au semnificații ca cele înțelese în domeniu. Astfel, de exemplu, o grupare fenil substituită complet are substituenți la ambele poziții adiacente „orto“(o) la punctul de atașare al inelului fenil, ambele poziții „meta“ (m), și la poziția „para“ (p) opusă punctului de atașare. Pentru a clarifica în continuare poziția substituenților pe inelul fenil, cele 2 poziții orto diferite vor fi desemnate ca orto și orto' și cele 2 poziții meta diferite ca meta și meta', așa cum s-a ilustrat mai jos.



Când se face referire la substituenții pe o grupare piridil, termenii „para“, „meta“, și „orto“ se referă la plasarea unui substituent față de punctul de atașare al inelului piridil. De exemplu structura de mai jos este descrisă ca 3-piridil cu substituentul X¹ în poziția orto, substituentul X² în poziția meta, și substituentul X³ în poziția para:



Pentru a furniza o descriere mai concisă, unele dintre expresiile cantitative date în acest document nu sunt calificate cu termenul „aproximativ”. Se înțelege că, dacă termenul „aproximativ” este utilizat explicit sau nu, fiecare cantitate dată în acest document se înțelege că se referă la valoarea dată de fapt, și este de asemenea menită să se refere la aproximarea pentru o astfel de valoare dată care ar fi în mod rezonabil dedusă pe baza experienței în domeniu, incluzând echivalente și aproximări datorate condițiilor experimentale și/sau de măsurare pentru o astfel de valoare dată. De fiecare dată când un randament este dat ca procent, un astfel de randament se referă la o masă dintr-o entitate, pentru care este dat randamentul, față de cantitatea maximă din aceeași entitate care ar putea fi obținută în condițiile stoechiometrice particulare. Concentrațiile care sunt date ca procente se referă la rapoarte de masă, în afară de cazul când s-a indicat diferit.

Termenii soluție „tamponată” sau soluție „tampon” sunt utilizați în acest document interschimbabil în conformitate cu înțelesul lor standard. Soluțiile tampon sunt utilizate pentru controlul pH-ului unui mediu, și alegerea, utilizarea, și funcționarea lor este cunoscută de cei având calificare obișnuită în domeniu. Vezi, de exemplu, G.D. Considine, ed., Van Nostrand's Encyclopedia of Chemistry, pg. 261, Ed. a 5-a (2005), care descrie, între altele, soluțiile tampon și cum concentrațiile constituenților tamponului se referă la pH-ul tamponului. De exemplu, o soluție tamponată se obține adăugând MgSO_4 și NaHCO_3 la o soluție, într-un raport 10:1 g/g pentru a menține pH-ul soluției la aproximativ 7,5.

Orice formula dată în acest document este destinată să reprezinte compuși care au structuri reprezentate prin formula structurală precum și anumite variante sau forme. În particular, compușii oricărei formule date în acest document pot avea centri asimetrici și prin urmare există în diferite forme enantiomere. Toți izomerii optici ai compușilor cu formula generală, și amestecurile acestora, sunt considerați în domeniul formulei. Astfel, orice formulă dată în acest document este destinată să reprezintă un racemat, una sau mai multe forme enantiomere, una sau mai multe forme diastereomere, una sau mai multe forme atropizomere, și amestecuri ale acestora. Mai mult, anumite structuri pot exista ca izomeri geometrice (adică, izomeri *cis* și *trans*), ca tautomeri, sau ca atropizomeri.

Este de asemenea înțeles faptul că, compușii care au aceeași formulă moleculară dar diferă prin natura sau secvența de legare a atomilor lor sau prin dispunerea atomilor în spațiu sunt denumiți „izomeri”. Izomerii care diferă prin aranjarea atomilor lor în spațiu sunt denumiți „stereoizomeri”.

Stereoizomerii care nu sunt imagini în oglindă unul față de celălalt sunt denumiți „diastereomeri” și cei care sunt imagini în oglindă nesuperpozabile unul față de celălalt sunt denumiți „enantiomeri”. Când un compus are un centru asimetric, adică este legat de patru grupări diferite, este posibilă o pereche de enantiomeri. Un enantiomer poate fi caracterizat prin configurația absolută a centrului său asimetric și este descris de regulile de secvențiere R și S ale lui Cahn și Prelog sau prin modul în care molecula rotește planul luminii polarizate ce este desemnat ca dextrorotatoriu sau levorotatoriu (adică, ca izomeri (+) - sau respectiv (-) -). Un compus chiral poate exista fie ca un enantiomer individual fie ca amestec al acestora. Un amestec care conține proporții egale de enantiomeri este denumit un „amestec racemic”.

„Tautomerii” se referă la compuși care sunt forme interschimbabile ale unei structuri de compus particular, și care diferă prin deplasarea atomilor de hidrogen și a electronilor. Astfel, două structuri pot fi în echilibru prin mișcarea electronilor π și a unui atom (uzual H). De exemplu, enol și cetonă sunt tautomeri deoarece se interconvertesc rapid prin tratare cu acid sau cu bază. Un alt exemplu de tautomerism este al formelor aci- și nitro- ale fenil nitrometanului, care sunt formate în mod asemănător prin tratare cu acid sau cu bază.

Formele tautomere pot fi relevante pentru atingerea reactivității chimice și a activității biologice optime a unui compus de interes.

Compușii acestei invenții pot avea unul sau mai mulți centri asimetrici; astfel de compuși pot fi produși prin urmare ca stereoizomeri individuali (R) sau (S) sau ca amestecuri ale acestora.

În afară de cazul când s-a indicat altfel, descrierea sau denumirea unui compus particular în descriere și revendicări se intenționează să includă ambii enantiomeri individuali și amestecurile lor, racemice sau altfel, ale acestuia. Metodele pentru determinarea stereochemiei și separarea stereoizomerilor sunt bine cunoscute în domeniu.

Unele exemple conțin structuri chimice care sunt reprezentate ca un enantiomer absolut dar se intenționează să indice material enantiopur care este de configurație necunoscută. În aceste cazuri (R^*) sau (S^*) este utilizat în denumire pentru indica faptul că stereochemia absolută a stereocentrului corespunzător este necunoscută. Astfel, un compus denumit ca (R^*) se referă la un compus enantiopur cu o configurație absolută fie (R) fie (S). În cazurile în care stereochemia absolută a fost confirmată, structurile sunt denumite utilizând (R) și (S).

Simbolurile



și



sunt utilizate ca însemnând același aranjament spațial în structurile chimice arătate în acest document. În mod analog, simbolurile



și



sunt utilizate ca însemnând același aranjament spațial în structurile chimice arătate în acest document.

Suplimentar, orice formulă dată în acest document se intenționează să se refere de asemenea la hidrați, solvați, și polimorfe ale unor astfel de compuși, și la amestecuri ale acestora, chiar dacă astfel de forme nu sunt listate explicit. Anumiți compuși cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), sau săruri acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) pot fi obținuți ca solvați. Solvații includ pe cei formați prin interacțiunea sau complexarea compușilor invenției cu unul sau mai mulți solvenți, fie în soluție fie ca solid sau formă cristalină. În unele realizări, solventul este apă și solvații sunt hidrați. În plus, anumite forme cristaline ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) sau sărurile acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) pot fi obținute drept co-cristale. În anumite realizări ale invenției, compușii cu Formula (I) au fost obținuți într-o formă cristalină. În alte realizări, formele cristaline ale compușilor cu Formula (I) au fost cubice. În alte realizări, sărurile acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) au fost obținute într-o formă cristalină. În încă alte realizări, compușii cu Formula (I) au fost obținuți în una din cele câteva forme polimorfe, ca un amestec de forme cristaline, ca forme polimorfe, sau ca formă amorfă. În alte realizări, compușii cu Formula (I) se transformă în soluție în una sau mai multe forme cristaline și/sau forme polimorfe.

Referirea la un compus din acest document înseamnă o referire la oricare dintre următoarele: (a) forma citată de fapt a unui astfel de compus și (b) oricare dintre formele unui astfel de compus în mediul în care compusul este considerat atunci când este denumit. De exemplu, referirea în acest document la un compus cum ar fi $R\text{-COOH}$, cuprinde referirea la oricare dintre, de exemplu, $R\text{-COOH}_{(s)}$, $R\text{-COOH}_{(sol)}$, și $R\text{-COO}^{-}_{(sol)}$. În acest exemplu, $R\text{-COOH}_{(s)}$ se referă la compusul solid, așa cum acesta ar putea fi, de exemplu într-o tabletă sau o altă compoziție sau preparat farmaceutic solid; $R\text{-COOH}_{(sol)}$ se referă la forma nedisociată a compusului într-un solvent; și $R\text{-COO}^{-}_{(sol)}$ se referă la forma disociată a compusului într-un solvent, cum ar fi forma disociată a compusului într-un mediu apos, indiferent dacă o astfel de formă disociată derivă de la $R\text{-COOH}$, de la o sare a acestuia, sau de la orice altă entitate care dă $R\text{-COO}^{-}$ după disociere în mediul considerat. Într-un alt exemplu, o expresie cum ar fi „expunerea unei entități la un compus cu formula $R\text{-COOH}$ ” se referă la expunerea unei astfel de entități la forma, sau formele compusului $R\text{-COOH}$ care există, sau există în mediul în care o astfel de expunere are loc. În încă un alt exemplu, o expresie cum ar fi „punerea în reacție a unei entități cu un compus cu formula $R\text{-COOH}$ ” se referă la punerea în reacție a (a) unei astfel de entitate în forma chimică relevantă, sau formele, dintr-o astfel de entitate care există, sau există în mediul în care o astfel de punerea în reacție are loc, cu (b) forma chimică relevantă, sau formele compusului $R\text{-COOH}$ care există, sau există în mediul în care o astfel de punerea în reacție are loc. În această privință, dacă o astfel de entitate este de exemplu într-un mediu apos, se înțelege că compusul $R\text{-COOH}$ este în același mediu, și prin urmare entitatea care este expusă la specii cum ar fi $R\text{-COOH}_{(aq)}$ și/sau $R\text{-COO}^{-}_{(aq)}$, unde subscriptul “(aq)” înseamnă „apos” în conformitate cu sensul convențional din chimie și biochimie. În aceste exemple de nomenclatură a fost aleasă o grupare funcțională de acid carboxilic; această alegere nu se intenționează, totuși, să fie o limitare, ci este numai o ilustrare. Se înțelege că pot fi furnizate exemple analoage în termeni de alte grupări funcționale, incluzând dar nu limitat la hidroxil, membri azot bazic, cum ar fi cei din amine, și orice altă grupare care interacționează sau se transformă în conformitate cu modalitățile cunoscute, în mediul care conține compusul. Astfel de interacțiuni și transformări includ, dar nu sunt limitate

la, disociere, asociere, tautomerism, solvoliză, inclusiv hidroliză, solvatare, inclusiv hidratare, protonare, și deprotonare. În acest document nu sunt furnizate și alte exemple în acest sens, deoarece aceste interacțiuni și transformări într-un mediu dat sunt cunoscute de către o persoană de specialitate în domeniu.

5 Intr-un alt exemplu, în acest document este cuprins un compus amfionic, care se referă la un compus despre care se știe că formează un amfion, chiar dacă nu este denumit explicit în forma sa amfionică. Termenii cum ar fi amfion, amfioni, și sinonimele lor compus(compuși) amfionic(amfionici) sunt denumiri standard acceptate de IUPAC care sunt bine cunoscute și fac parte din seturi standard de denumiri științifice definite. În acest sens, denumirea amfion este atribuită de denumirea de identificare CHEBI:27369 din dicționarul entităților moleculare Chemical Entities of Biological Interest (ChEBI). După cum este bine cunoscut în general, un amfion sau compus amfionic este un compus neutru care are sarcini unitare formale de semn opus. Uneori la acești compuși se face referire prin termenul „săruri interne”. Alte surse se referă la acești compuși ca „ioni dipolari”, deși ultimul termen este considerat de alte surse ca fiind o denumire greșită. Ca exemplu specific, acidul aminoetanoic (aminoacidul glicină) are formula $\text{H}_2\text{NCH}_2\text{COOH}$, și există în unele medii (în acest caz în mediu neutru) în formă de amfion $^+\text{H}_3\text{NCH}_2\text{COO}^-$. Amfionii, compușii amfionici, sărurile interne și ionii dipolari, în sensurile cunoscute și bine stabilite ale acestor termeni, sunt în sfera de aplicare a acestei invenții, așa cum ar fi în orice caz apreciat astfel de către specialiștii în domeniu. Deoarece nu este necesară denumirea fiecărui exemplu de realizare care ar fi recunoscut de specialiștii în domeniu, nici structurile compușilor amfionici care sunt asociați cu compușii acestei invenții nu sunt date în mod explicit în acest document. Ele sunt, totuși, o parte a realizărilor acestei invenții. În acest document nu sunt furnizate și alte exemple în acest sens, deoarece interacțiunile și transformările într-un mediu dat sunt cunoscute de către o persoană de specialitate în domeniu.

25 Orice formulă dată în acest document este de asemenea destinată să reprezinte forme nemarcate precum și forme marcate izotopic ale compușilor. Compușii marcați izotopic au structuri reprezentate prin formulele date în acest document, cu excepția faptului că unul sau mai mulți atomi sunt înlocuiți cu un atom având o atomică masă sau un număr de masă selectat. Exemplele de izotopi care pot fi încorporați în compușii invenției includ izotopi de hidrogen, carbon, azot, oxigen, fosfor, sulf, fluor, clor, și iod cum ar fi ^2H , ^3H , ^{11}C , ^{13}C , ^{14}C , ^{15}N , ^{18}O , ^{17}O , ^{31}P , ^{32}P , ^{35}S , ^{18}F , ^{36}Cl , respectiv ^{125}I . Astfel de compuși marcați izotopic sunt utili în studii metabolice (preferabil cu ^{14}C), studii de cinetici de reacție (de exemplu cu ^2H sau ^3H), tehnici de detecție sau imagistică [cum ar fi tomografie cu emisie de pozitron (PET) sau tomografie computerizată cu emisia unui singur foton (SPECT)] incluzând teste de distribuție a medicamentului în substrat sau țesut, sau în tratamentul radioactiv al pacienților. În particular, un compus marcat cu ^{18}F sau ^{11}C poate fi preferat în special pentru studii PET sau SPECT. În plus, substituția cu izotopi mai grei cum ar fi deuteriu (adică, ^2H) poate conferi anumite avantaje terapeutice care rezultă din stabilitatea metabolică mai mare, de exemplu perioadă de înjumătățire *in vivo* crescută, sau cerințe de doză redusă. Compușii marcați izotopic ai acestei invenții pot fi preparați în general prin efectuarea procedurilor divulgate în schemele sau în exemplele și preparările descrise mai jos substituind un reactiv nemarcat izotopic cu un reactiv marcat izotopic disponibil cu ușurință.

45 Când se face referire la orice formula dată în acest document, selecția unui radical particular dintr-o listă de specii posibile pentru o variabilă specifică nu se intenționează să definească aceeași alegere a speciilor pentru variabila care apare în altă parte. Cu alte cuvinte, acolo unde o variabilă apare mai mult de o dată, alegerea speciilor dintr-o listă specificată este independentă de alegerea speciilor pentru aceeași variabilă în altă parte în formulă, în afară de cazul când s-a afirmat altfel.

50 În conformitate cu următoarele considerații interpretative asupra atribuirii și nomenclaturii, se înțelege că referirea explicită în acest document la un set implică, în cazul în care este semnificativ din punct de vedere chimic și în afară de cazul când s-a indicat altfel, referirea independentă la realizările dintr-un astfel de set, și referirea la fiecare și la oricare una dintre posibilele realizări ale subseturilor din setul menționat în mod explicit.

55 Prin intermediul unui prim exemplu de terminologie de substituent, dacă substituentul $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este unul dintre S_1 și S_2 , iar substituentul $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este unul dintre S_3 și S_4 , atunci aceste atribuiri se referă la realizări ale acestei invenții date în conformitate cu alegerile $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este S_1 iar $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este S_3 ; $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este S_1 și $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este S_4 ; $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este S_2 și $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este S_3 ; $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este S_2 și $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este S_4 ; și echivalenți ai fiecăreia din astfel de alegeri. Terminologia mai scurtă „ $\text{S}^1_{\text{exemplu}}$ este unul dintre S_1 și S_2 , și $\text{S}^2_{\text{exemplu}}$ este unul dintre S_3 și S_4 ” este utilizată corespunzător în acest document de dragul conciziei, dar nu prin limitare. Primul exemplu anterior referitor la terminologia substituenților, care este menționat în termeni generici, este menit să ilustreze

diferitele atribuiri de substituenți descrise în acest document. Convenția dată mai sus în acest document pentru substituenți se extinde, când este aplicabil, la membri cum ar fi R^1 , R^2 , R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^3 , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} , R^{3e1} , R^4 , Het^1 , și Hal^2 , și orice alt simbol de substituent generic utilizat în acest document.

5 Mai mult, când mai mult de o atribuire este dată pentru orice membru sau substituent, exemplele de realizare ale acestei invenții cuprind diferitele grupări care pot fi făcute din atribuiri listate, luate în mod independent, și echivalenții acestora. Prin intermediul unui al doilea exemplu cu privire la terminologia substituentului, dacă în acest document este descris faptul că substituentul S_{exemplu} este unul dintre S_1 , S_2 și S_3 , această listă se referă la exemplele de realizare
10 ale acestei invenții pentru care S_{exemplu} este S_1 ; S_{exemplu} este S_2 ; S_{exemplu} este S_3 ; S_{exemplu} este unul dintre S_1 și S_2 ; S_{exemplu} este unul dintre S_1 și S_3 ;

S_{exemplu} este unul dintre S_2 și S_3 ; S_{exemplu} este unul dintre S_1 , S_2 și S_3 ; și S_{exemplu} este orice echivalent al fiecăreia din aceste alegeri. Terminologia mai scurtă „ S_{exemplu} este unul dintre S_1 , S_2 , și S_3 ” este utilizată corespunzător în acest document pentru concizie, dar nu ca limitare. Al doilea
15 exemplu anterior referitor la terminologia substituenților, care este menționat în termeni generici, este menit să ilustreze diferitele atribuiri de substituenți descrise în acest document. Convenția dată mai sus în acest document pentru substituenți se extinde, după caz, la membri cum ar fi R^1 , R^2 , R^{2a} , R^{2b} , R^{2c} , R^{2d} , R^{2e} , R^{2f} , R^3 , R^{3a} , R^{3b} , R^{3c} , R^{3d} , R^{3e} , R^{3e1} , R^4 , Het^1 , și Hal^2 , și orice alt simbol de substituent generic utilizat în acest document.

20 Nomenclatura „ C_{i-j} ” cu $j > i$, când s-a aplicat în acest document pentru o clasă de substituenți, se înțelege că se referă la realizările acestei invenții pentru care fiecare și oricare unul dintre numărul de membri carbon, de la i până la j inclusiv i și j , este în mod independent realizată. Cu titlu de exemplu, termenul C_{1-3} se referă în mod independent la realizări care au un membru carbon (C_1), realizări care au doi membri carbon (C_2), și realizări care au trei membri carbon (C_3).

25 Termenul alchil C_{n-m} se referă la o catenă alifatică, fie liniară fie ramificată, cu un număr total N de membri carbon în catenă, care satisfac $n \leq N \leq m$, cu $m > n$. Orice disubstituent la care se face referire în acest document se intenționează să cuprindă diferitele posibilități de atașare, atunci când sunt permise mai mult de una din aceste posibilități. De exemplu, referirea la disubstituent -A-B-, unde $A \neq B$, se referă în acest document la un astfel de disubstituent cu A
30 atașat la un prim membru substituit și B atașat la un al doilea membru substituit, și el se referă de asemenea la un astfel de disubstituent cu A atașat la al doilea membru substituit și B atașat la primul membru substituit.

Invenția include de asemenea săruri acceptabile farmaceutice ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), preferabil ale acelor descriși
35 mai sus și ale compușilor specifici exemplificați în acest document, și astfel de săruri pentru utilizare în metode de tratament.

Termenul „acceptabil farmaceutic” înseamnă aprobat sau probabil de către o agenție de reglementare a guvernului Federal sau a unui stat sau o agenție corespunzătoare din alte țări decât Statele Unite sau care este listată în Pharmacopoeia SUA sau în alte farmacopei recunoscute în
40 general pentru utilizare la animale, și mai ales, la oameni.

O „sare acceptabilă farmaceutic” este destinată să însemne o sare a unui acid sau bază liberă a compușilor reprezentați prin Formula (I) (precum și prin Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) care sunt netoxici, în biologic tolerabili, sau altfel adecvați biologic pentru administrare către un subiect. Aceasta ar trebui să posede activitatea farmacologică dorită a
45 compusului părinte. Vezi, în general, G.S. Paulekuhn, et al., "Trends in Active Pharmaceutical Ingredient Salt Selection based on Analysis of the Orange Book Database", J. Med. Chem., 2007, 50:6665-72, S.M. Berge, et al., "Pharmaceutical Salts", J Pharm Sci., 1977, 66:1-19, și Handbook of Pharmaceutical Salts, Properties, Selection, and Use, Stahl and Wermuth, Eds., Wiley-VCH and VHCA, Zurich, 2002. Exemplele de săruri acceptabile farmaceutice sunt cele care sunt eficiente
50 farmacologic și adecvate pentru contactul cu țesuturile pacienților fără toxicitate nepotrivită, iritare, sau răspuns alergic. Un compus cu Formula (I) (precum și cu Formule (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) poate poseda o grupare suficient de acidă, o grupare suficient de bazică, sau ambele tipuri de grupări funcționale, și reacționa corespunzător cu un număr de baze anorganice sau organice, și acizi anorganici și organici, pentru a forma o sare acceptabilă
55 farmaceutic.

Exemplele de săruri acceptabile farmaceutice includ sulfați, piosulfați, bisulfați, sulfiți, bisulfiți, fosfați, fosfați monoacizi, fosfați diacizi, metafosfați, pirofosfați, cloruri, bromuri, ioduri, acetati, propionați, decanoați, capriilați, acriilați, formați, izobutirați, caproați, heptanoați, propiolați, oxalați, malonați, succinați, suberați, sebacați, fumarati, maleați, butin-1,4-dioați, hexin-1,6-dioați,
60 benzoați, clorobenzoați, metilbenzoați, dinitrobenzoați, hidroxibenzoați, metoxibenzoați, ftalați, sulfonați, xileniulfonați, fenilacetați, fenilpropionați, fenilbutirați, citrați, lactați, γ -hidroxibutirați,

glicolați, tartrați, metan-sulfonați, propansulfonați, naftalin-1-sulfonați, naftalin-2-sulfonați, și mandelați.

Când compușii cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) conțin un azot bazic, sarea acceptabilă farmaceutic dorită poate fi preparată prin orice metodă adecvată disponibilă în domeniu. De exemplu, tratarea bazei libere cu un acid anorganic, cum ar fi acid clorhidric, acid bromhidric, acid sulfuric, acid sulfamic, acid azotic, acid boric, acid fosforic, și alții asemenea, sau cu un acid organic, cum ar fi acid acetic, acid fenilacetic, acid propionic, acid stearic, acid lactic, acid ascorbic, acid maleic, hidroxiacid maleic, acid isetionnic, acid succinic, acid valeric, acid fumaric, acid malonic, acid piruvic, acid oxalic, acid glicolic, acid salicilic, acid oleic, acid palmitic, acid lauric, un acid piranozidilic, cum ar fi acid glucuronic sau acid galacturonic, un alfa-hidroxi acid, cum ar fi acid mandelic, acid citric, sau acid tartric, un aminoacid, cum ar fi acid aspartic, acid glutaric sau acid glutamic, un acid aromatic, cum ar fi acid benzoic, acid 2-acetoxibenzoic, acid naftoic, sau acid cinamic, un acid sulfonic, cum ar fi acid laurilsulfonic, acid *p*-toluensulfonic, acid metansulfonic, acid etansulfonic, orice amestec de acizi compatibili cum ar fi cei dați ca exemplu în acest document, și orice alt acid și amestec al acestora care sunt considerați ca echivalenți sau substituiți acceptabil în lumina nivelului obișnuit de competență în această tehnologie.

Când compusul cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) este un acid, cum ar fi un acid carboxilic sau acid sulfonic, sarea acceptabilă farmaceutic dorită poate fi preparată prin orice metodă adecvată, de exemplu, tratarea acidului liber cu o bază anorganică sau organică, cum ar fi o amină (primară, secundară sau terțiară), un hidroxid de metal alcalin, hidroxid de metal alcalino pământos, orice amestec de baze compatibile cum ar fi cele date ca exemple în acest document, și orice altă bază și amestec al acestora care sunt considerate ca echivalente sau substituite acceptabil în lumina nivelului obișnuit de competență în această tehnologie. Exemplele ilustrative de săruri adecvate includ săruri organice derivate din aminoacizi, cum ar fi *N*-metil-D-glucamină, lizină, colină, glicină și arginină, amoniac, carbonați, bicarbonați, amine primare, secundare, și terțiare, și amine ciclice, cum ar fi trometamină, benzilamină, piroldine, piperidină, morfolină, și piperazină, și săruri anorganice derivate din sodiu, calciu, potasiu, magneziu, mangan, fier, cupru, zinc, aluminiu, și litiu.

Prezența divulgare se referă de asemenea la promedicamente acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), și la metode de tratament care utilizează astfel de promedicamente acceptabile farmaceutic. Termenul „promedicament” înseamnă un precursor al unui compus denumit care, după administrare la un subiect, dă compusul *in vivo* printr-un proces chimic sau fiziologic cum ar fi solvolyză sau clivare enzimatică, sau în condiții fiziologice (de exemplu, un promedicament care fiind adus la pH-ul fiziologic este convertit la compusul cu Formula (I)). Un „promedicament acceptabil farmaceutic” este un promedicament care este netoxic, tolerabil biologic, și altfel adecvat biologic pentru administrare către subiect. Procedeele ilustrative pentru selecția și prepararea derivaților promedicament adecvați sunt descrise, de exemplu, în „Design of Prodrugs”, ed. H. Bundgaard, Elsevier, 1985.

Promedicamentele exemplare includ compuși având un rest de aminoacid, sau un lanț de polipeptidă de două sau mai multe (de exemplu, două, trei sau patru) resturi de aminoacid, imbinat covalent printr-o legătură de amidă sau ester la o grupare amino, hidroxil, sau acid carboxilic liberă dintr-un compus cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)). Exemplele de resturi de aminoacid includ cei douăzeci de aminoacizi care apar natural, denumiți în mod obișnuit prin simboluri de trei litere, precum și 4-hidroxiprolină, hidroxilizină, demozină, izodemozină, 3-metilhistidină, norvalină, beta-alanină, acid gama-aminobutiric, citrulină, homocisteină, homoserină, ornitină și metionin sulfone.

Tipuri suplimentare de promedicamente pot fi produse, de exemplu, prin derivatizarea grupărilor carboxil libere din structuri cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) ca amide sau alchil esteri. Exemplele de amide includ acei derivați din amoniac, amine primare alchilC₁₋₆ și amine secundare di(alchilC₁₋₆). Aminele secundare includ inele heterocicloalchil cu 5 sau cu 6 membri sau radicali heteroaril. Exemplele de amide includ pe cele care sunt derivate din amoniac, amine alchilC₁₋₃ primare, și di(alchilC₁₋₂)amine.

Exemplele de esteri din divulgare includ esteri alchilC₁₋₇, cicloalchilC₅₋₇, fenilici, și fenil(alchilC₁₋₆). Esterii preferați includ ester metilici. Promedicamentele pot fi de asemenea preparate prin derivatizarea grupărilor hidroxil libere utilizând grupări incluzând hemisuccinați, fosfat esteri, dimetilaminoacetați, și fosforiloximetiloxicarbonili, urmând procedee cum ar fi cele prezentate în Fleisher et al Adv. Drug Delivery Rev. 1996, 19, 115-130. Derivații carbamat ai grupărilor hidroxil și amino pot da de asemenea promedicamente. Derivații carbonat, esteri sulfonat, și esterii sulfat ai grupărilor hidroxil pot furniza de asemenea promedicamente.

Derivatizarea grupărilor hidroxil ca (aciloxi)metil și (aciloxi)etil eteri, în care gruparea acil poate fi un alchil ester, substituit opțional cu una sau mai multe funcțiuni de eter, amină, sau acid carboxilic, sau unde gruparea acil este un ester de aminoacid așa cum s-a descris mai sus, este de asemenea utilă pentru a da promedicamente. Promedicamentele de acest tip pot fi preparate așa cum s-a descris în Robinson et al., J Med Chem. 1996, 39 (1), 10-18. Aminele libere pot fi de asemenea derivatizate ca amide, sulfonamide sau fosfonamide. Toți acești radicali promedicament pot încorpora grupări incluzând funcțiuni de eter, amină, și acid carboxilic.

Prezența divulgare se referă de asemenea la metaboliți activi farmaceutic ai compușilor cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)), care pot fi de asemenea utilizați în metodele din divulgare. Un „metabolit farmaceutic activ” înseamnă un produs al metabolismului organismului, farmacologic activ dintr-un compus cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI) ca aplicabil) sau sare a acestuia. Promedicamentele și metaboliții activi ai unui compus se pot determina utilizând tehnici de rutină cunoscute sau disponibile în domeniu. Vezi, de exemplu, Bertolini și colab., J Med Chem. 1997, 40, 2011-2016; Shan, și colab., J Pharm Sci. 1997, 86 (7), 765-767; Bagshawe, Drug Dev Res. 1995, 34, 220-230; Bodor, Adv Drug Res. 1984, 13, 224-331; Bundgaard, Design of Prodrugs (Elsevier Press, 1985); și Larsen, Design and Application of Prodrugs, Drug Design and Development (Krogsgaard-Larsen, și colab., ed., Harwood Academic Publishers, 1991).

Invenția se referă de asemenea la compuși cu Formula (I) (precum și cu Formulele (II), (IIA), (IIB), (III), (IV), (V), și (VI)) și la sărurile lor acceptabile farmaceutic pentru utilizare ca modulatori ai receptorului NR2B. Ca astfel de modulatori, compușii pot acționa ca antagoniști, agoniști sau agoniști inverși. Termenul „modulatori” include atât inhibitori cât și activatori, unde „inhibitori” se referă la compuși care scad, previn, inactivează, desensibilizează, sau reglează negativ expresia sau activitatea receptorului NR2B, și „activatori” sunt compușii care cresc, activează, facilitează, sensibilizează, sau reglează pozitiv expresia sau activitatea receptorului NR2B.

Termenul „tratează”, „tratament” sau „tratare”, așa cum s-a utilizat în acest document, este destinat să se refere la administrarea unui agent activ sau compoziție a invenției la un subiect pentru scopul oferirii unui beneficiu terapeutic sau profilactic prin modularea activității receptorului NR2B. Tratarea include inversarea, ameliorarea, atenuarea, inhibarea progresiei, atenuarea severității, sau prevenirea unei boli, tulburări, sau afecțiuni, sau a uneia sau mai multor simptome ale unei astfel de boli, tulburări sau afecțiuni mediate prin modularea activității receptorului NR2B. Termenul „subiect” se referă la un pacient mamifer care are nevoie de astfel de tratament, cum ar fi un om.

Corepunzător, invenția se referă la utilizarea compușilor descriși în acest document în metode pentru tratarea subiecților diagnosticați sau care suferă de o boală, tulburare, sau afecțiune mediată de activitatea receptorului NR2B, cum ar fi: tulburare bipolară I de formă depresivă, hipomaniacală, maniacală și tulburare bipolară mixtă II; tulburările depresive, cum ar fi tulburare depresivă episodică unică sau depresivă majoră recurentă, tulburare depresivă minoră, depresie rezistentă la tratament, tulburare depresivă cu debut post-partum, tulburare de dereglare a stării de spirit, tulburări depresive cu simptome psihotice; tulburări persistente de dispoziție, cum ar fi ciclotimie, distimie, eutimie; și tulburare disforică premenstruală; tulburări de anxietate, tulburări generale de anxietate, tulburări de panică cu sau fără agorafobie, fobie specifică, tulburări de anxietate socială, tulburări de anxietate cronică; tulburare obsesiv-compulsivă; tulburările de reacție și adaptare la stresul sever, cum ar fi tulburarea de stres post-traumatic (PTSD); alte tulburări nevrotice, cum ar fi sindromul de depersonalizare-derealizare; tulburări de dezvoltare obișnuite, incluzând dar nu limitat la sindrom Asperger și sindrom Rett, tulburări de autism, autismul copilăului și tulburare de hiperactivitate asociată cu retard mental și mișcări stereotipe, tulburare specifică de dezvoltare a funcției motorii, tulburări specifice de dezvoltare a abilităților școlare; depresie postnatală (post-partum) și prenatală; tulburări de alimentație, incluzând dar nu limitat la anorexie nervoasă, bulimie nervoasă, tulburare de comportament alimentar pica și binge; boală Parkinson; Parkinsonism secundar, cum ar fi Parkinsonism postencefalic; Parkinsonism cuprins în alte tulburări; boală cu corpi Lewis; boli degenerative ale ganglionilor bazali; alte tulburări extrapiramidale și de mișcare incluzând dar nu limitat la tremur, tremur esențial și tremur indus de medicament, mioclonus, corea și corea indusă de medicament, ticuri induse de medicament și ticuri de origine organică, distonie acută indusă de medicament, dischinezie tardivă indusă de medicament, dischinezie indusă de L-dopa; tulburări de mișcare induse de neuroleptice incluzând dar nu limitat la sindrom neuroleptic malign (NMS), parkinsonism indus de neuroleptice, dischinezie cu debut timpuriu sau acută, indusă de neuroleptic, distonie acută indusă de neuroleptice, akatisie acută indusă de neuroleptice, dischinezie tardivă indusă de neuroleptice, tremur indus de neuroleptice; sindromul picioarelor neliniștite, sindromul omului rigid; distonie

incluzând dar nu limitat la distonie focală, distonie focală multiplă sau segmentară, distonie de torsione, distonie emisferică, generalizată și tardivă (indusă de medicamente psihofarmacologice). Dystonia focală include distonie cervicală (torticolis), blefarospasm (crampe ale pleoapei), distonie apendiculară (crampe în extremități, cum ar fi crampele scriitorului), distonie oromandibulară și disfonie spasmodică (crampe ale corzilor vocale); epilepsie, incluzând epilepsie idiopatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii cu debut localizat, epilepsie simptomatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii parțiale simple, epilepsie simptomatică și sindroame epileptice legate de localizare (focală) (parțială) cu convulsii parțiale complexe, epilepsie idiopatică și sindroame epileptice generalizate incluzând dar nu limitat la epilepsie mioclonică în pruncie, convulsii neonatale (familiale), absență epileptică în copilărie (picnolepsie), epilepsie cu convulsii grand mal la trezire, absență epileptică, epilepsie mioclonică (petit mal impulsivă) și convulsii epileptice, atonice nespecifice, clonice, mioclonice, tonice, tonic-clonice; epilepsie cu absențe mioclonice, convulsii miocloniastatice, spasme infantile, sindrom Lennox-Gastaut, atacuri Salaam, encefalopatie mioclonică timpurie simptomatică, sindrom West, convulsii petit și grand mal; stare epileptică; epilepsie cu absențe mioclonice, convulsii miocloniastatice, spasme infantile, sindrom Lennox-Gastaut, atacuri Salaam, encefalopatie mioclonică timpurie simptomatică, sindrom West, convulsii petit și grand mal; stare epileptică; tulburări somatoforme persistente; durere acută, cronică și cronică intractabilă, durere de cap; durere acută și cronică legată de procese fiziologice și tulburări fizice incluzând dar nu limitat la durere de spate, durere de dinți, durere abdominală, durere de șale, durere în articulații; durere acută și cronică care este legată de boli ale sistemului musculoscheletal și țesutului conjunctiv incluzând, dar nu limitat la reumatism, mialgie, neuralgie și fibromialgie; durere acută și cronică care este legată de tulburări ale nervilor, rădăcinii și plexului nervos, cum ar fi durerea de trigemen, nevralgie postzoster, sindromul membrului fantomă cu durere, sindromul de tunel carpian, leziuni ale nervului sciatic, mononeuropatie diabetică; durere acută și cronică care este legată de polineuropatii și alte tulburări ale sistemului nervos periferic, cum ar fi neuropatie ereditară și idiopatică, polineuropatie inflamatorie, polineuropatie indusă de medicamente, alcool sau agenți toxici, polineuropatie în boală neoplazică, polineuropatie diabetică. Exemplele de boli care includ forme de neurodegenerare includ, dar nu sunt limitate la, neurodegenerare acută, cum ar fi leziuni ale creierului intracraniale, cum ar fi accident vascular cerebral, leziuni difuze și locale ale creierului, epidural, hemoragie subdurală și subarahnoidă, și neurodegenerare cronică, cum ar fi boală Alzheimer, boală Huntington, scleroză multiplă și ALS, hemoragie subarahnoidiană, hemoragie intracerebrală și altă hemoragie intracraniană netraumatică, infarct cerebral, accident vascular cerebral, ocluzie și stenoză a arterelor precerebrale și cerebrale, care nu conduce la infarctul cerebral, disecția arterelor cerebrale, anevrism cerebral, ateroscleroză cerebrală, leucoencefalopatie vasculară progresivă, encefalopatie hipertensivă, tromboză nepiogenă a sistemului venos intracranial, arterită cerebrală, angiopatie amiloidă cerebrală și orice sechelă de boli cerebrovasculare; glaucom și alte neuropatii; demență, demență vasculară, demență cu corpi Lewy, demență frontotemporală, și demență HIV; vertigo și nistagmus; tinitus; lupus eritematos sistemic neuropsihiatric; tulburare de dereglare a dispoziției; tulburare a spectrului schizofreniei; și tulburări de somn/veghe.

Când un agent farmaceutic este utilizat în metodele de tratament conform invenției, o cantitate eficientă de agent farmaceutic conform invenției este administrat la un subiect care suferă sau este diagnosticat ca având o astfel de boală, tulburare, sau afecțiune. O „cantitate eficientă” înseamnă o cantitate sau doză suficientă pentru a aduce în general aproximativ beneficiul terapeutic dorit sau profilactic la pacienții care au nevoie de astfel de tratament pentru boala, tulburarea, sau afecțiunea denumită. Cantitățile sau dozele eficiente de compuși ai prezentei invenții pot fi constatate de metode de rutină cum ar fi modelare, studii de escaladare a dozei sau studii clinice, și luând în considerație factorii de rutină, de exemplu, modul sau calea de administrare sau de livrare a medicamentului, terapia anterior sau în curs de desfășurare a subiectului, starea de sănătate a subiectului și răspunsul la medicamente, și aprecierea medicului curant. Un exemplu de doză este în intervalul de la aproximativ 0,001 până la aproximativ 200 mg de compus pe kg de greutate corporală a subiectului pe zi, preferabil aproximativ 0,05 până la 100 mg/kg/zi, sau aproximativ 1 până la 35 mg/kg/zi, în unități de dozare unice sau divizate (de exemplu, BID, TID, QID). Pentru un om de 70 kg, un interval ilustrativ pentru o cantitate de doză adecvată este de aproximativ 0,05 până la aproximativ 7 g/zi, sau aproximativ 0,2 până la aproximativ 2,5 g/zi.

După ce s-a produs îmbunătățirea bolii, tulburării sau stării pacientului, doza poate fi ajustată pentru tratamentul preventiv sau de întreținere. De exemplu, doza sau frecvența de administrare, sau ambele, pot fi reduse în funcție de simptome, la un nivel la care efectul terapeutic sau profilactic dorit este menținut. Desigur, dacă simptomele au fost ameliorate la un nivel

adecvat, tratamentul poate înceta. Pacienți pot necesita, totuși, tratament intermitent pe o perioadă lungă de timp, după orice reparație a simptomelor. În plus, agenții activi ai invenției pot fi folosiți în combinație cu ingrediente active suplimentare în metode de tratare a afecțiunilor de mai sus. Ingredientul activ suplimentar poate fi co-administrat separat cu un agent activ al compușilor din Tabelul 1 sau inclus cu un astfel de agent într-o compoziție farmaceutică conform invenției. Într-o realizare exemplară, ingredientele active suplimentare sunt cele care sunt cunoscute sau descoperite ca fiind eficiente în tratamentul afecțiunilor, tulburărilor, sau bolilor mediate de activitatea NR2B, cum ar fi un alt modulator NR2B sau un compus activ împotriva unei alte ținte asociate cu afecțiunea, tulburarea, sau boala particulară. Combinația poate servi pentru a crește eficacitatea (de exemplu, incluzând în combinație un compus care potențează activitatea sau eficacitatea unui agent activ conform invenției).

Agenții activi ai invenției sunt utilizați, singuri sau în combinație cu unul sau mai multe ingrediente active suplimentare, pentru a formula compoziții farmaceutice ale invenției. O compoziție farmaceutică a invenției cuprinde: (a) o cantitate eficientă de cel puțin un agent activ conform invenției; și (b) un excipient acceptabil farmaceutic.

Un „excipient acceptabil farmaceutic” se referă la o substanță care este netoxică, tolerabilă biologic, și altfel adecvată biologic pentru administrare la un subiect, cum ar fi o substanță inertă, adăugată la o compoziție farmacologică sau utilizată altfel, ca vehicul, purtător, sau diluant pentru a facilita administrarea unui agent și care este compatibil cu acesta. Exemplele de excipienți includ carbonat de calciu, fosfat de calciu, diferite zaharuri și tipuri de amidon, derivați de celuloză, gelatină, uleiuri vegetale, și polietilen glicoli.

Formele de livrare a compozițiilor farmaceutice care conțin una sau mai multe unități de dozare ale agenților activi pot fi preparate utilizând excipienți farmaceutici adecvați și tehnici de amestecare cunoscute sau care devin disponibile celor calificați în domeniu. Compozițiile pot fi administrate în metodele inventive pe o cale de livrare adecvată, de exemplu, pe cale orală, parenterală, rectală, topică, sau oculară, sau prin inhalare.

Prepararea poate fi în forma de tablete, capsule, pliculețe, drajee, pulberi, granule, pastile, pulberi pentru reconstituire, preparate lichide, sau supozitoare. Preferabil, compozițiile sunt formulate pentru perfuzie intravenoasă, administrare topică, sau administrare orală.

Pentru administrare orală, compușii invenției pot fi furnizați în formă de tablete sau capsule, sau ca soluție, emulsie, sau suspensie. Pentru a prepara compozițiile orale, compușii pot fi formulați pentru a da o doză, de exemplu, de la aproximativ 0,05 până la aproximativ 100 mg/kg zilnic, sau de la aproximativ 0,05 până la aproximativ 35 mg/kg zilnic, sau de la aproximativ 0,1 până la aproximativ 10 mg/kg zilnic. De exemplu, o doză zilnică totală de aproximativ 5 mg până la 5 g zilnic poate fi realizată prin administrare o dată, de două ori, trei, sau de patru ori pe zi.

Tabletele orale pot include un compus conform invenției amestecat cu excipienți acceptabili farmaceutici cum ar fi diluanți inerti, agenți de dezintegrare, agenți de legare, agenți de lubrifiere, agenți de îndulcire, agenți de aromatizare, agenți de colorare și agenți de conservare. Umpluturile inerte adecvate includ carbonat de sodiu și calciu, fosfat de sodiu și calciu, lactoză, amidon, zahăr, glucoză, metil celuloză, stearat de magneziu, manitol, sorbitol, și altele asemenea. Exemplele de excipienți orali lichizi includ etanol, glicerol, apă, și alții asemenea. Amidon, polivinil-pirolidonă (PVP), amidon glicolat de sodiu, celuloză microcristalină, și acid alginic sunt agenți de dezintegrare adecvați. Agenții de legare pot include amidon și gelatină. Agentul de lubrifiere, dacă este prezent, poate fi stearat de magneziu, acid stearic sau talc. Dacă se dorește, tabletele pot fi acoperite cu un material cum ar fi monostearat de gliceril sau distearat de gliceril pentru a întârzia absorbția în tractul gastrointestinal, sau pot fi acoperite cu o acoperire enterică.

Capsulele pentru administrare orală includ capsule de gelatină tari și moi. Pentru a prepara capsulele de gelatină tari, compușii invenției pot fi amestecați cu un diluant solid, semi-solid, sau lichid. Capsulele moi de gelatină pot fi preparate prin amestecarea compusului invenției cu apă, un ulei cum ar fi ulei de arahide sau ulei de măsline, parafină lichidă, un amestec de mono și di-gliceride cu acizi grași cu catenă scurtă, polietilen glicol 400, sau propilen glicol.

Lichidele pentru administrare orală pot fi în formă de suspensii, soluții, emulsii sau siropuri sau pot fi liofilizate sau prezentate ca produs uscat pentru reconstituire cu apă sau alt vehicul adecvat înainte de utilizare. Astfel de compoziții lichide pot conține opțional: excipienți acceptabili farmaceutici cum ar fi agenți de punere în suspensie (de exemplu, sorbitol, metil celuloză, alginat de sodiu, gelatină, hidroxietilceluloză, carboximetilceluloză, gel de stearat de aluminiu și alții asemenea); vehiculi neapoși, de exemplu, ulei (de exemplu, ulei de migdale sau ulei de nucă de cocos fracționat), propilen glicol, alcool etilic, sau apă; conservanți (de exemplu, p-hidroxibenzoat de metil sau propil sau acid sorbic); agenți de umectare cum ar fi lecitină; și, dacă se dorește, agenți de aromatizare sau de colorare.

Agentii activi ai acestei invenții pot fi de asemenea administrați pe căi non-orale. De exemplu, compozițiile pot fi formulate pentru administrare rectală ca supozitoare. Pentru utilizare parenterală, incluzând căile intravenoasă, intramusculară, intraperitoneală, sau subcutanată, compuşii invenției pot fi furnizați în soluții sau suspensii apoase sterile, tamponate la pH și izotonicitate adecvate, sau în ulei acceptabil parenteral. Vehiculii apoși adecvați includ soluție Ringer și clorură de sodiu izotonică. Astfel de forme vor fi prezentate în formă de doză unică cum ar fi fiole sau dispozitive de injecție de unică folosință, în forme multi-doză cum ar fi fiole din care poate fi extrasă doza adecvată, sau într-o formă solidă sau pre-concentrată care poate fi utilizată pentru a prepara o formulare injectabilă. Dozele de perfuzie ilustrative pot varia de la aproximativ 1 până la 1000 µg/kg/minut de compus, amestecat cu un purtător farmaceutic pe o perioadă care variază de la câteva minute până la câteva zile.

Pentru administrare topică, compuşii pot fi amestecați cu un purtător farmaceutic la o concentrație de aproximativ 0,1 % până la aproximativ 10% de medicament la vehicul. Un alt mod de administrare a compuşilor invenției poate utiliza o formulare plasture pentru a ajuta livrarea transdermică.

Compuşii invenției pot fi administrați alternativ în metodele acestei invenții prin inhalare, pe cale nazală sau orală, de exemplu, într-o formulare spray care conține de asemenea un purtător adecvat.

Compuşii exemplari utili în metodele invenției vor fi acum descriși prin referire la schemele de sinteză ilustrative de mai jos pentru preparare generală și la exemplele specifice care urmează. Practicienii vor recunoaște că, pentru a obține diverşii compuşii din acest document, materiile prime pot fi selectate în mod adecvat, astfel încât substituenții doriți în final să treacă prin schema de reacție cu sau fără protejare, după caz, pentru a da produsul dorit. Alternativ, poate fi necesar sau dezirabil să se utilizeze, în locul substituentului final dorit, o grupare adecvată care poate fi purtată prin schema de reacție și înlocuită cu substituentul dorit adecvat. În afară de cazul când s-a specificat altfel, variabilele sunt așa cum s-au definit mai sus cu referire la Formula (I). Reacțiile pot fi efectuate între punctul de topire și temperatura de reflux a solventului, și preferabil între 0 °C și temperatura de reflux a solventului. Masa de reacție poate fi încălzită utilizând încălzirea convențională sau încălzirea cu microunde. Reacțiile pot fi de asemenea efectuate în vase de presiune etanșate, peste temperatura normală de reflux a solventului.

Abrevierile și acronimele utilizate în acest document includ următoarele:

Tabelul 4:

Termen	Acronim
Acetonitril	ACN
Apoasă	aq
Atmosferă	atm
Clorură de aur(III)	Au(III)Cl ₃
<i>tert</i> -Butilcarbamoil	Boc
Hexafluorofosfat de benzotriazol-1-iloxi-tris(dimetilamino)fosfoniu	BOP
Larg	br
Pământ de diatomee	Celite®
Trifluorură de dietilaminosulf	DAST
1,8-Diazabicyclo[5,4,0]undec-7-enă	DBU
N,N'-Diciclohexilcarbodiimidă	DCC
Dicloroetan	DCE
Diclorometan	DCM
Trifluorură de bis(2-metoxietil)aminosulf	Deoxo-Fluor®
Diizopropiletilamină	DIPEA
4-Dimetilaminopiridină	DMAP
1,2-Dimetoxietan	DME
N,N-Dimetilformamidă	DMF
Dimetilsulfoxid	DMSO
1-Etil-3-(3-dimetilaminopropil)carbodiimidă	EDCI, EDAC, sau EDC
Dietil eter	Eter, Et ₂ O
Acetat de etil	EtOAc, sau EA
Etanol	EtOH
Cromatografie în fază normală pe silicagel	FCC
Grame	g
Ore	h
Hexafluorofosfat de 1-[bis(dimetilamino)metilen]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-b]piridiniu 3-	HATU

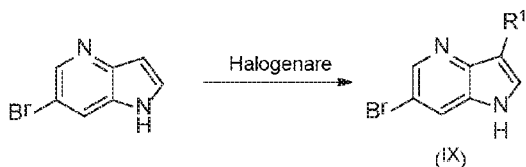
Termen	Acronim
oxid	
Hexafluorofosfat de N,N,N',N'-tetrametil-O-(1H-benzotriazol-1-il)uroni	HBTU
Hidroxibenzotriazol	HOBt
Cromatografie de lichide la presiune înaltă	HPLC
Hertz	Hz
Alcool izopropilic	<i>i</i> PrOH, IPA
Cromatografie de lichide și spectrometrie de masă	LCMS
Litiu bis(trimetilsilil)amidă	LHMDS
Molar	M
Raport masă la sarcină	m/z
Acid meta-cloroperoxibenzoic	<i>m</i> CPBA
Iodură de metil	Mel
Metanol	MeOH
Miligrame	mg
Minut	min
Mililitru	mL
Microlitru	μL
Milimoli	mmol
Spectrometrie de masă	MS
Normal	N
N-Bromosuccinimidă	NBS
N-Clorosuccinimidă	NCS
N-Iodosuccinimidă	NIS
Rezonanță magnetică nucleară	RMN
CF ₃ SO ₃ - sau triflat	OTf
Diclorură de bis(trifenilfosfin)paladiu(II)	Pd(PPh ₃) ₂ Cl ₂
Tetrakis(trifenilfosfin)paladiu(0)	Pd(PPh ₃) ₄
[1,1'-Bis(di-terț-butilfosfino)ferocen]dicloropaladiu(II)	PdCl ₂ (dtbpf) sau Pd(dtbpf) ₂ Cl ₂
Părți pe milion	ppm
Precipitat	ppt
Politetrafluoroetilenă	PTFE
Hexafluorofosfat de bromotripirolidinofosfoniu	PyBroP®
Timp de retenție	Rt
Temperatura camerei	rt
Saturat	sat
bis(Tetrafluoroborat) de 1-clorometil-4-fluoro-1,4-diazoniabicyclo[2,2,2]octan	Selectfluor®
[2-(Trimetilsilil)etoxi]metil acetal	SEM
Cromatografie în fluid supercritic	SFC
Temperatură	T
Fluorură de tetra-n-butilamoniu	TBAF
Trietilamină	TEA
Acid trifluoroacetic	TFA
Tetrahidrofuran	THF
Cromatografie în strat subțire	TLC

EXAMPLE PREPARATIVE

Compușii exemplari utili în metodele invenției se vor descrie acum prin referire la schemele de sinteză ilustrative pentru prepararea generală a acestora, de mai jos, și la exemplele specifice de urmat.

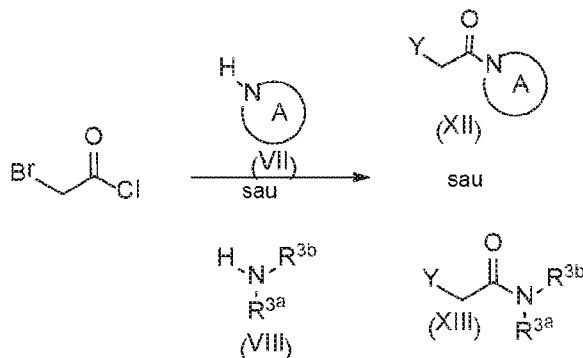
5

SCHEMA 1



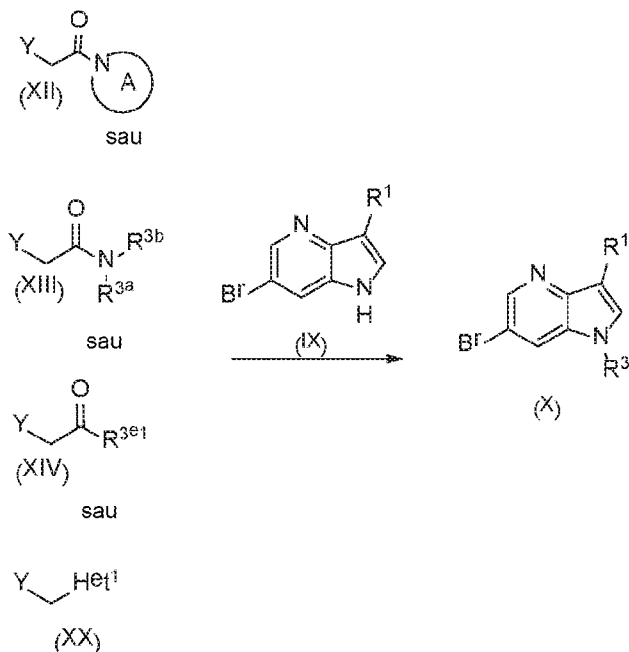
- In conformitate cu SCHEMA 1, 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină disponibilă comercial sau accesibilă prin sinteză este halogenată în condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu. De exemplu, 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridina este halogenată utilizând un reactiv cum ar fi NCS, NBS, și alții, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, și alții asemenea, la o temperatură care variază de la 0 °C până la rt, pentru a furniza un compus cu Formula (IX), unde R¹ este Cl sau Br. Un compus cu formula (IX), unde R¹ este F, este preparat sub condiții de fluorurare cunoscute unei persoane calificate în domeniu, de exemplu, reacție cu un agent de fluorurare cum ar fi Selectfluor®, piridină, într-un solvent adecvat cum ar fi ACN, și alții asemenea, la temperatura camerei.

SCHEMA 2



- În conformitate cu SCHEMA 2, clorură de 2-bromoacetyl reacționează cu o heterocicloalchilamină cu formula (VII) disponibilă comercial sau accesibilă prin sinteză substituită adecvat, unde A este un inel cu 3-7 membri complet saturat sau parțial saturat, opțional conținând suplimentar atomi de S, N, sau O, sau amină cu formula (VIII) substituită adecvat, unde R^{3a} și R^{3b} sunt așa cum s-au definit în Formula (I), în prezența unei baze adecvate cum ar fi Et₃N (TEA), într-un solvent cum ar fi acetonitril (ACN), la temperaturi care variază de la - 78 °C până la rt, pentru a furniza un compus cu formula (XII) sau (XIII).

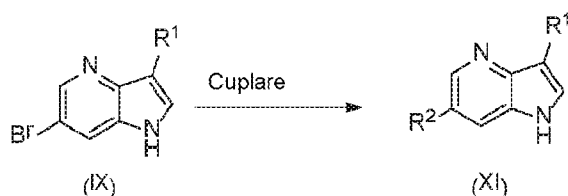
SCHEMA 3



- In conformitate cu SCHEMA 3, un compus cu formula (IX), unde R¹ este H, Cl, F, este alchilat cu un compus cu formula (XII), (XIII), (XIV), sau (XX) unde Y este Cl, Br sau -OSO₂Me, utilizând o bază cum ar fi NaH, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, la temperaturi care variază de la 0 °C până la rt, pentru a da un compus cu formula (X). Când agentul de alchilare este un compus cu formula (XIV), R^{3e1} este OalchilC₁₋₅, alchilC₁₋₅ sau ciclopropil. Când agentul de alchilare este un compus cu formula (XX), Het¹ este un heteroaril substituit adecvat cum ar fi izoxazol, și Y este Cl.

Un compus cu formula (X), unde R¹ este H, este fluorurat suplimentar utilizând condițiile descrise anterior, pentru a furniza un compus cu formula (X), unde R¹ este F.

SCHEMA 4

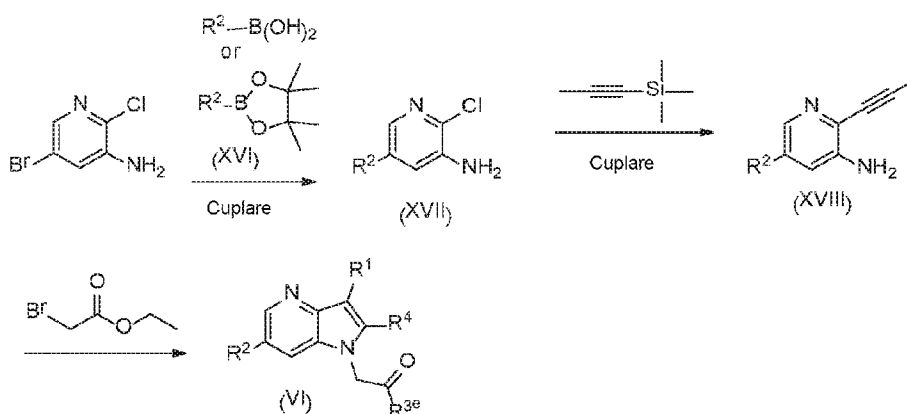


In conformitate cu SCHEMA 4, un compus cu formula (IX), unde R¹ este H, sau Cl, reacționează printr-o reacție de cuplare încrucișată mediată de metal pentru a furniza un compus cu formula (XI), unde R² este un fenil, piridinil, tienil, fiecare substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre halo, -CN, alchil_{C1-5} și haloalchil_{C1-5}. De exemplu, un compus cu formula (IX), unde R¹ este H, sau Cl, reacționează cu un acid aril sau heteroaril boronic, ester boronat substituit adecvat, și alții asemenea, în prezența unui catalizator de paladiu cum ar fi PdCl₂(dtbpf), Pd(PPh₃)₄, și alții asemenea, o bază cum ar fi K₃PO₄, Na₂CO₃ aq., Cs₂CO₃, și alții asemenea, într-un solvent adecvat cum ar fi 1,4-dioxan, DMF, apă, sau un amestec al acestora, la o temperatură care variază de la 60 - 90 °C, pentru o perioadă de aproximativ 16 h, pentru a furniza un compus cu formula (XI).

Un compus cu formula (XI), unde R¹ este H, și R² este un fenil substituit adecvat, este halogenat, utilizând condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu, de exemplu, prin reacție cu NIS, și alții, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, și alții asemenea, la o temperatură care variază de la 0 °C până la rt, pentru a furniza un compus cu formula (XI), unde R¹ este I.

Intr-o metodă suplimentară, un compus cu formula (XI), unde R¹ este Br, azotul N1 este protejat cu o grupare de protecție adecvată la azot cum ar fi SEM, utilizând condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu. De exemplu, reacția bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridinei cu 2-clorometoxietil)trimetilsilan, în prezența unei baze cum ar fi NaH, și altele asemenea, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, la temperaturi care variază de la 0 °C până la rt, furnizează 3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1-((2-(trimetilsilil)etoxi)metil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină. Trans-halogenarea unui compus unde R¹ este Br, este obținută în condiții de reacție cum ar fi *t*BuLi, și N-fluoro-N-(fenilsulfonil)benzensulfonamidă, într-un solvent cum ar fi THF, pentru a furniza un compus unde R¹ este F. Deprotejarea ulterioară a grupării SEM, în condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu, cum ar fi reacția cu TBAF, într-un solvent adecvat cum ar fi THF, la o temperatură de aproximativ 60 °C furnizează un compus cu formula (XI), unde R¹ este F.

SCHEMA 5

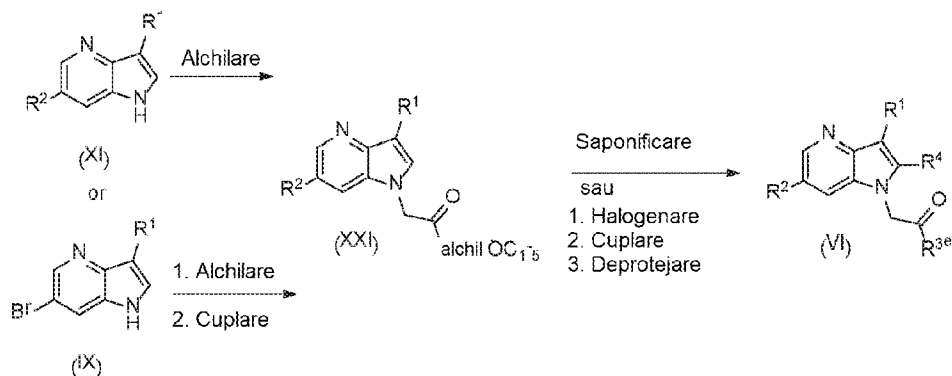


In conformitate cu SCHEMA 5, 5-bromo-2-cloropiridin-3-amina disponibilă comercial sau accesibilă prin sinteză este cuplată cu un acid boronic sau ester boronic cu Formula (XVI), unde R² este un fenil substituit adecvat, în prezența unui catalizator de paladiu cum ar fi Pd(dtbpf)₂Cl₂, și alții asemenea, o bază cum ar fi K₃PO₄, într-un solvent cum ar fi dioxan, apă, sau un amestec al acestora, la 80 °C pentru a furniza un compus cu formula (XVII). Un compus cu formula (XVII) reacționează într-o reacție de cuplare încrucișată Sonogashira catalizată de paladiu cu o (trimetilsilil)alchină, un catalizator de paladiu cum ar fi Pd(PPh₃)₂Cl₂, și alții asemenea, un ligand cum ar fi PPh₃, un cocatalizator de cupru(I) cum ar fi CuI, o bază amină cum ar fi Et₃N, DBU, DIPEA, și altele asemenea, CsF, într-un solvent cum ar fi DMF, Et₂O, dioxan, THF, și alții asemenea, la o temperatură de aproximativ 90 °C, pentru a furniza un compus cu formula (XVIII).

Reacția unui compus cu formula (XVIII) cu o bază cum ar fi NaH, 2-bromoacetat de etil, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, și alții asemenea, la o temperatură care variază de la 0 °C până la temperatura camerei, pentru o perioadă de aproximativ 12-24 h, furnizează un compus cu formula (VI), unde R¹ este H și R⁴ este CH₃.

5

SCHEMA 6



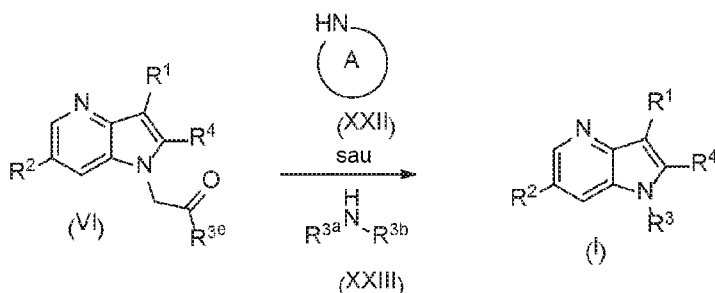
În conformitate cu SCHEMA 6, un compus cu formula (VI), este preparat în două etape de la un compus cu formula (XI). Într-o primă etapă, un compus cu formula (XI) unde R¹ este H, și R² este un fenil sau tienil substituit adecvat, este alchilat cu electrofil cum ar fi 2-bromoacetat de etil, 2-bromoacetat de *terf*-butil, și alții asemenea, o bază cum ar fi NaH, și altele asemenea, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, la temperaturi care variază de la 0 °C până la rt pentru a furniza un compus cu formula (XXI), unde R^{3e} este alchilC₁₋₅. Saponificarea unui compus ester cu formula (XXI) sub condiții bazice cum ar fi LiOH, și altele asemenea, într-un solvent cum ar fi THF și apă, la o temperatură de aproximativ rt, dau un compus cu formula (VI), unde R⁴ este H, și R^{3e} este -OH.

Un compus cu formula (XXI), este preparat dintr-un compus cu formula (IX) în două etape. Un compus cu formula (IX), într-o primă etapă este alchilat utilizând condiții descrise anterior cu un electrofil cum ar fi 2-bromoacetat de etil, 2-bromoacetat de *terf*-butil, și alții asemenea. Într-o a doua etapă, cuplarea cu un fenil sau un acid sau ester tienil boronic substituit adecvat, utilizând condiții descrise anterior, furnizează un compus cu formula (XXI).

Se va înțelege că în anumite cazuri, poate avea loc hidroliza esterului *in situ*, fără izolarea unui ester (XXI) discret pentru a furniza un compus cu formula (VI), unde R^{3e} este -OH.

Într-o metodă alternativă, un compus cu formula (VI) unde R¹ este alchilC₁₋₅, R² este un fenil substituit adecvat, și R⁴ este H, este preparat dintr-un compus cu formula (XXI), unde R¹ este H, în 3 etape. Într-o primă etapă, bromurarea unui compus cu formula (XXI), unde R¹ este H, utilizând condiții descrise anterior dă un compus unde R¹ este Br. Într-o a doua etapă, conversia mediată de metal de tranziție a unui compus halogenură de aril unde R¹ este Br, utilizând tetrametilstanu, un catalizator de paladiu cum ar fi Pd(PPh₃)₂Cl₂, și alții asemenea, un aditiv cum ar fi LiCl, într-un solvent adecvat cum ar fi DMF, ACN, dioxan, xileni, și alții asemenea, la temperaturi care variază de la 80 până la 110 °C dă un compus unde R¹ este CH₃. Deprotejarea ulterioară a esterului, utilizând condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu, de exemplu, reacție cu TFA, într-un solvent cum ar fi DCM, și alții asemenea, la temperaturi care variază de la 0 °C până la rt, dă un compus cu formula (VI), unde R¹ este CH₃.

SCHEMA 7

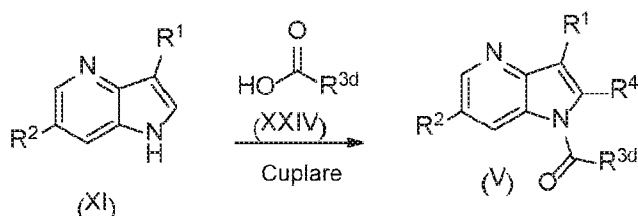


În conformitate cu SCHEMA 7, un compus cu Formula (I), unde R¹ și R⁴ sunt H sau CH₃, R² este un fenil sau tienil substituit adecvat, este preparat prin tehnici convenționale de formare a legăturii amidice cum ar fi reacții de cuplare care sunt bine cunoscute celor calificați în

35

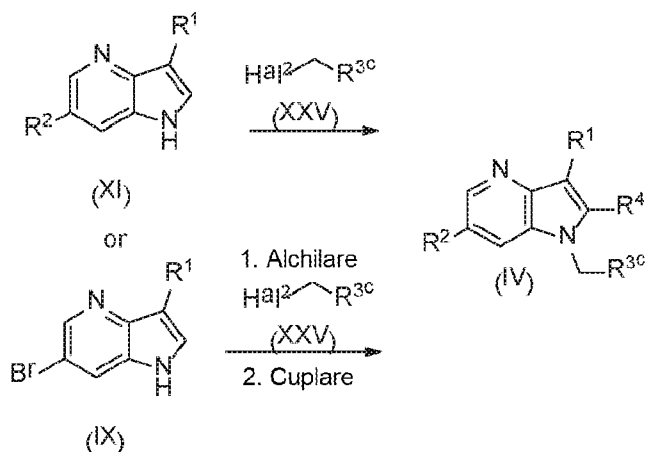
- domeniu. De exemplu, reacția unei heterocicloalchil amine substituită adecvat cu formula (XXII) sau amine cu formula (XXIII) unde R^{3a} este H sau alchil C_{1-5} și R^{3b} este alchil C_{1-5} , cicloalchil C_{3-6} , cu un compus acid cu formula (VI), unde R^{3e} este OH, unde acidul este activat cu un reactiv de activare adecvat, de exemplu o carbodiimidă, cum ar fi DCC sau EDCI opțional în prezență de HOBt și/sau un catalizator cum ar fi DMAP; o sare de halotrisaminofosfoniu cum ar fi BOP, sau PyBroP; o sare de piridiniu adecvată cum ar fi clorură de 2-cloro-1-metil piridiniu; sau un alt agent de cuplare adecvat cum ar fi HBTU, HATU, și alții asemenea. Reacțiile de cuplare sunt efectuate într-un solvent adecvat cum ar fi DCM, THF, DMF și alții asemenea, opțional în prezență unei amine terțiare cum ar fi N-metilmorfolină, N-etildizopropilamină, sau TEA, la o temperatură care variază de la aproximativ 0 °C până la rt, pentru a furniza un compus cu Formula (I).

SCHEMA 8



- În conformitate cu SCHEMA 8, un compus cu formula (XI), unde R^1 și R^4 sunt H, reacționează cu un acid cu formula (XXIV), unde R^{3d} este ciclobutil, sau CH_2 -ciclopropil, sub condiții de formare a legăturii amidice așa cum s-a descris anterior, pentru a furniza un compus cu formula (V). Într-o metodă preferată, HATU este reactivul de cuplare, DIPEA este baza, DMF este solventul.

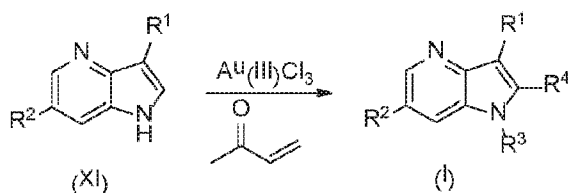
SCHEMA 9



- În conformitate cu SCHEMA 9, un compus cu formula (XI), reacționează cu o halogenură de heteroaril alchil cu formula (XXV), unde Hal^2 este Cl, utilizând condiții de alchilare descrise anterior pentru a furniza un compus cu formula (IV), unde R^1 este H sau halo, R^2 este un fenil sau tienil substituit adecvat, R^{3c} este un cicloalchil C_{3-6} substituit adecvat, un heterocicloalchil cu 3-6 membri substituit adecvat, sau un inel heteroaril cu 5 sau 6 membri substituit adecvat, și R^4 este H. Într-o metodă preferată baza este NaH, și solventul este DMF.

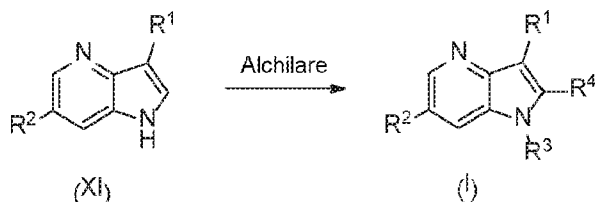
- Într-o metodă alternativă, un compus cu formula (IX), unde R^1 este H, este alchilat cu o halogenură de heteroaril alchil cu formula (XXV), unde Hal^2 este Cl, apoi într-o a doua etapă, reacționează într-o reacție de cuplare mediată de metal cu un acid fenil boronic sau un ester tienil boronic substituit adecvat, așa cum s-a descris anterior, pentru a furniza un compus cu formula (IV).

SCHEMA 10



În conformitate cu SCHEMA 10, un compus cu formula (XI), unde R^1 este H, și R^2 este un fenil substituit adecvat, reacționează cu but-3-en-2-onă, $Au(III)Cl_3$, trifluorometansulfonat de argint, într-un solvent cum ar fi DCE, la o temperatură de aproximativ 100 °C, pentru a furniza compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2CH_2(C=O)CH_3$.

SCHEMA 11



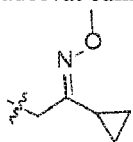
5

În conformitate cu SCHEMA 11, un compus cu formula (XI), este alchilat în condiții descrise anterior, adică, prin reacție cu (clorometil)(metil)sulfan; haloalchil C_{1-5} substituiți opțional cum ar fi 1-bromobutan, 1-bromo-3-metilbutan, 1-bromo-2-metoxietan, și alții asemenea; (halometil)cicloalchil C_{3-6} cum ar fi (bromometil)ciclopropan, (bromometil)ciclobutan, și alții asemenea; (halometil)heterocicloalchili cum ar fi 2-(bromometil)oxiran, 3-(bromometil)tetrahidrofuran, și alții asemenea; 2-bromo-1-ciclobutiletanonă; 2-bromo-1-ciclopropiletanonă; 2-bromo-1-feniletanonă; 1-bromobutan-2-onă; (halometil)heteroarili cum ar fi 3-(bromometil)piridină, 5-(clorometil)-3-metil-1,2,4-oxadiazol, 4-(clorometil)-1-metil-1H-pirazol, 4-(clorometil)-1-metil-1H-1,2,3-triazol, și alții asemenea; 1-(2-cloroetil)-1H-pirazol; metansulfonat de (5-fluoropirimidin-2-il)metil; sau metansulfonat de pirimidin-5-ilmetil; utilizând condiții de alchilare descrise anterior, furnizează un compus cu Formula (I).

Un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2(C=O)alchilC_{1-5}$, este redus cu un agent reducător cum ar fi $NaBH_4$, și alții asemenea, într-un solvent cum ar fi THF, MeOH, sau un amestec al acestora, la o temperatură care variază de la °C până la rt, și furnizează un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2CH(OH)alchilC_{1-5}$.

Un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2(C=O)cicloalchilC_{3-6}$, reacționează cu un reactiv Grignard cum ar fi bromură de metilmagneziu, și alții asemenea, într-un solvent adecvat cum ar fi Et_2O , THF, sau un amestec al acestora, la o temperatură care variază de la °C până la rt, și furnizează un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2(CH_3)(OH)cicloalchilC_{3-6}$.

Un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2(C=O)cicloalchilC_{3-6}$, reacționează cu clorhidrat de O-metilhidroxilamină, o bază cum ar fi $NaHCO_3$, și altele asemenea, într-un solvent adecvat cum ar fi MeOH, și alții asemenea, și furnizează un compus cu Formula (I), unde R^3 este



Un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2CH(OH)cicloalchilC_{3-6}$ este fluorurat în condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu, de exemplu, prin reacție cu un agent de fluorurare cum ar fi DAST, și alții asemenea, într-un solvent cum ar fi DCM, și alții asemenea, la o temperatură care variază de la °C până la rt, furnizând un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2CH(F)cicloalchilC_{3-6}$.

Un compus cu Formula (I), unde R^3 este CH_2SCH_3 , este oxidat în condiții cunoscute unei persoane calificate în domeniu, de exemplu, prin reacție cu un agent de oxidare cum ar fi mCPBA, într-un solvent cum ar fi DCM, și alții asemenea, la o temperatură care variază de la °C până la rt, furnizând un compus cu Formula (I), unde R^3 este $CH_2(S=O)CH_3$, și $CH_2(SO_2)CH_3$.

Compușii cu Formula (I) pot fi converșiți la sărurile lor corespunzătoare utilizând metode cunoscute de cineva având calificare obișnuită în domeniu. De exemplu, o amină cu Formula (I) este tratată cu acid trifluoroacetic, HCl, sau acid citric într-un solvent cum ar fi Et_2O , CH_2Cl_2 , THF, MeOH, cloroform, sau izopropanol pentru a furniza forma de sare corespunzătoare. Alternativ, sărurile de acid trifluoroacetic sau acid formic sunt obținute ca rezultat al condițiilor de purificare prin HPLC cu fază inversă. Formele cristaline ale sărurilor acceptabile farmaceutic ale compușilor cu Formula (I) pot fi obținute în formă cristalină prin recristalizare din solvenți polari (inclusiv amestecuri de solvenți polari și amestecuri apoase de solvenți polari) sau din solvenți nepolari (inclusiv amestecuri de solvenți nepolari).

Acolo unde compușii în conformitate cu această invenție au cel puțin un centru chiral, ei pot exista corespunzător ca enantiomeri. Acolo unde compușii posedă doi sau mai mulți centri

chirali, ei pot exista suplimentar ca diastereomeri. Trebuie să se înțeleagă că toți acești izomeri și amestecurile acestora sunt cuprinși în domeniul prezentei invenții.

- Compușii preparați în conformitate cu schemele descrise mai sus pot fi obținuți ca forme individuale, cum ar fi enantiomeri individuali, prin sinteză specifică formei sau prin rezoluție.
- 5 Compușii preparați în conformitate cu schemele de mai sus pot fi obținuți în mod alternativ ca amestecuri de diverse forme, cum ar fi amestecuri racemice (1:1) sau neracemice (nu 1:1). Acolo unde sunt obținute amestecuri racemice și neracemice de enantiomeri, enantiomerii individuali pot fi izolați utilizând metode convenționale de separare cunoscute de cei cu calificare obișnuită în domeniu, cum ar fi cromatografie chirală, recristalizare, formare de sare diastereomeră,
- 10 derivatizare în aducți diastereomerici, biotransformare, sau transformare enzimatică. Acolo unde sunt obținute amestecuri de regioizomeri sau diastereomeri, ca aplicabile, izomerii individuali pot fi separați utilizând metode convenționale cum ar fi cromatografie sau cristalizare.

Următoarele exemple specifice sunt furnizate pentru a ilustra suplimentar invenția și diferite realizări preferate.

15 **EXAMPLE**

În obținerea compușilor descriși în exemplele de mai jos și în datele analitice corespunzătoare, au fost urmate protocoalele experimentale și analitice următoare, dacă nu s-a indicat altfel.

- Dacă nu se afirmă altfel, amestecurile de reacție au fost agitate magnetic la temperatura camerei (rt) sub o atmosferă de azot. În cazul în care soluțiile au fost „uscate“, ele au fost în
- 20 general uscate pe un agent de uscare cum ar fi Na_2SO_4 sau MgSO_4 . Acolo unde amestecurile, soluțiile, și extractele au fost „concentrate“, ele au fost de obicei concentrate pe un evaporator rotativ sub presiune redusă. Reacțiile sub condiții de iradiere cu microunde au fost efectuate într-un instrument Biotage Initiator sau CEM (Microwave Reactor) Discover.

- Pentru reacțiile efectuate sub condiții de curgere continuă, „curgere printr-un mixer LTF-VS“ se referă la utilizarea unei Pompe Seringă cu Atingere Chemyx Fusion 100 care este conectată prin conductă din PTFE 1/16“ cu un mixer LTF-VS (Little Things Factory GmbH (<http://www.ltf-gmbh.com>), dacă nu s-a indicat altfel.

- 30 Cromatografia pe silicagel cu fază normală (FCC) a fost efectuată pe silicagel (SiO_2) utilizând cartușe preambalate.

Cromatografia de lichide de înaltă performanță cu fază inversă preparativă (RP HPLC) a fost efectuată prin oricare dintre:

- METODA A.** Agilent HPLC cu o coloană Xterra Prep RP18 (5 μM , 30 x 100 sau 50 x 150mm) sau o coloană XBridge C18 OBD (5 μM , 30 x 100 sau 50 x 150mm), și o fază mobilă de ACN 5% în NH_4OH 20mM menținută 2 min, apoi un gradient de 5-99% ACN în timp de 15 min, apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 5 min, cu un debit de 40 sau 80 mL/min.

sau

- METODA B.** Shimadzu LC-8A Series HPLC cu o coloană Inertsil ODS-3 (3 μm , 30 x 100mm, T = 45 °C), fază mobilă de ACN 5% în H_2O (ambele cu 0,05% TFA) menținută timp de 1 min, apoi un gradient de ACN 5-99% în timp de 6 min, apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 3 min, cu un debit de 80 mL/min.

sau

- METODA C.** Shimadzu LC-8A Series HPLC cu o coloană XBridge C18 OBD (5 μm , 50 x 100mm), fază mobilă de ACN 5% în H_2O (ambele cu 0,05% TFA) menținută timp de 1 min, apoi un gradient de ACN 5-99% în timp de 14 min, apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 10 min, cu un debit de 80 mL/min.

sau

- METODA D.** Gilson HPLC cu o coloană XBridge C18 (5 μm , 100 x 50mm), fază mobilă de ACN 5-99% în NH_4OH 20 mM în timp de 10 min și apoi s-a menținut la ACN 99 timp de 2 min, la un debit de 80 mL/min.

- Cromatografia de lichide de înaltă performanță cu fluid supercritic preparativă (SFC) a fost efectuată fie pe un sistem SFC Jasco preparativ, un sistem APS 1010 de la Berger instruments,
- 55 fie pe SFC-PICLAB-PREP 200 (PIC SOLUTION, Avignon, Franța). Separările au fost efectuate la 100-150 bari cu un debit care variază de la 40-60 mL/min. Coloana au fost încălzită la 35-40 °C.

Spectrele de masă (MS) au fost obținute pe un Agilent serii 1100 MSD utilizând ionizare electrospray (ESI) în mod pozitiv dacă nu s-a indicat altfel. Masa calculată (calc.) corespunde cu masa exactă.

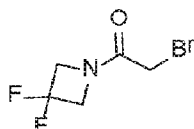
- 60 Spectrele de rezonanță magnetică nucleară (RMN) au fost obținute pe spectrometre Bruker model DRX. Definițiile pentru multiplicitate sunt după cum urmează: s = singlet, d =

dublet, t= triplet, q = cvartet, m = multiplu, br = larg. Se va înțelege că pentru compușii care cuprind un proton schimbabil, protonul menționat poate fi sau poate să nu fie vizibil pe un spectru RMN, în funcție de alegerea solventului utilizat pentru efectuarea spectrului RMN și de concentrația compusului în soluție.

5 Denumirile chimice au fost generate utilizand ChemDraw Ultra 12.0, ChemDraw Ultra 14.0 (CambridgeSoft Corp., Cambridge, MA) sau ACD/Name Version 10.01 (Advanced Chemistry).

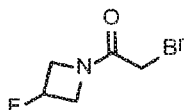
Compușii denumiți ca R* sau S* sunt compuși enantiopuri unde configurația absolută nu a fost determinată.

10 **Intermediar 1: 2-Bromo-1-(3,3-difluoroazetidină-1-il)etanonă.**



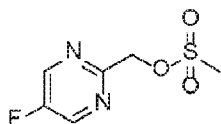
La o soluție de clorhidrat de 3,3-difluoroazetidină (3 g, 23 mmol) și Et₃N (3,2 mL, 23 mmol) în ACN (29 mL) la -78 °C s-a adăugat clorură de 2-bromoacetyl (1,9 mL, 23 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească încet la temperatura camerei. După 30 minute, s-a adăugat apă și faza apoasă a fost extrasă cu DCM (3x). Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate pentru a da compusul din titlu (3,45 g, 70 %). ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 4,66 (t, J = 12,5 Hz, 2H), 4,36 (t, J = 12,6 Hz, 2H), 4,26 (s, 2H).

20 **Intermediar 2: 2-Bromo-1-(3-fluoroazetidină-1-il)etanonă.**



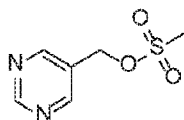
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 1. Acest compus a fost izolat ca un amestec de 2-bromo-1-(3-fluoroazetidină-1-il)etanonă și 2-cloro-1-(3-fluoroazetidină-1-il)etanonă și a fost utilizat în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară.

25 **Intermediar 3: Metansulfonat de (5-fluoropirimidin-2-il)metil.**



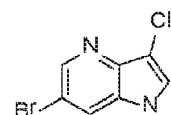
La o soluție de (5-fluoropirimidin-2-il)metanol (100 mg, 0,78 mmol) în DCM (3 mL) s-a adăugat Et₃N (0,16 mL, 1,2 mmol) urmată de clorură de metansulfonil (79 μL, 1 mmol) la 0 °C. După 30 minute, s-au adăugat apă (10 mL) și o soluție apoasă saturată de NaHCO₃ (10 mL). Faza apoasă a fost extrasă cu DCM de două ori și straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate pentru a da compusul din titlu (160 mg, randament cantitativ). Materialul a fost utilizat în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară.

35 **Intermediar 4: Metansulfonat de pirimidin-5-ilmetil.**



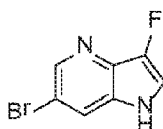
La o soluție de 5-pirimidin metanol (110 mg, 0,999 mmol) în DCM (4 mL) s-a adăugat Et₃N (0,21 mL, 1,5 mmol) urmată de clorură de metansulfonil (0,10 mL, 1,3 mmol) la 0 °C. După 30 minute, s-au adăugat apă (10 mL) și o soluție apoasă saturată de NaHCO₃ (10 mL). Faza apoasă a fost extrasă cu DCM de două ori și straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate pentru a da compusul din titlu (188 mg, randament cantitativ). Materialul a fost utilizat în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară.

45 **Intermediar 5: 6-Bromo-3-cloro-1H-pirol[3,2-b]piridină.**



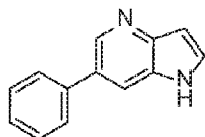
La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (3 g, 15 mmol) în DMF (34 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat încet NCS (2,4 g, 18 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. Apoi s-a adăugat apă și amestecul a fost agitat timp de 20 minute. Compusul din titlu a fost colectat prin filtrare și spălat cu apă (2,6 g, 74%). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11,74 (s, 1H), 8,45 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,09 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 7,86 (d, *J* = 3,0 Hz, 1H).

Intermediar 6: 6-Bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridină.



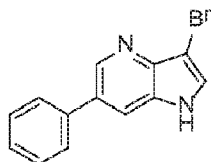
La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (2 g, 10,2 mmol) și Selectfluor® (4,3 g, 12,2 mmol) în ACN (20 mL) s-a adăugat piridină (6 mL). După 16 ore la temperatura camerei, solventul a fost evaporat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 50-100% în hexani) a dat compusul din titlu (666 mg, 31%). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11,28 (s, 1H), 8,41 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,04 (t, *J* = 2,2 Hz, 1H), 7,71 (t, *J* = 2,6 Hz, 1H).

Intermediar 7: 6-Fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină.



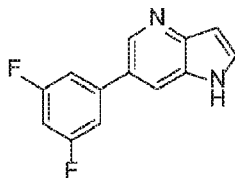
La o soluție a 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (400 mg, 2,03 mmol) în dioxan (100 mL) s-a adăugat acid fenilboronic (297 mg, 2,43 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (149 mg, 0,203 mmol), Cs₂CO₃ (1,9 g, 6,09 mmol) și apă (10 mL). După 16 ore la 90 °C amestecul de reacție s-a răcit și a fost concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (257 mg, 65%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₁₀N₂, 194,1; *m/z* găsit, 195,0 [M+H]⁺.

Intermediar 8: 3-Bromo-6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină.



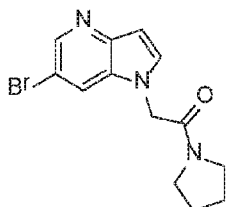
La o soluție de 6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină (Intermediar 7, 526 mg, 2,708 mmol) în DMF (6 mL) la 0 °C s-a adăugat N-bromosuccinimidă (NBS) (500 mg, 2,809 mmol) în porții mici. Amestecul de reacție a fost agitat la 0 °C timp de 15 min. Amestecul de reacție a fost turnat în apă (25 mL). Precipitatul a fost colectat și spălat cu apă (2 x 4 mL) și metanol (2 x 4 mL) pentru a da compusul din titlu (510 mg, 1,867 mmol, 69%) ca pulbere maro deschis. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₉BrN₂, 272,0; *m/z* găsit, 273,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11,78 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,88 (d, *J* = 2,9 Hz, 1H), 7,74 (d, *J* = 7,6 Hz, 2H), 7,51 (t, *J* = 7,5 Hz, 2H), 7,40 (t, *J* = 7,3 Hz, 1H).

Intermediar 9: 6-(3,5-Difluorofenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină.



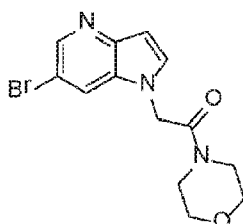
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 7. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₈F₂N₂, 230,07; *m/z* găsit, 231 = [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11,61 - 11,38 (s, 1H), 8,75 - 8,56 (d, *J* = 2,1 Hz, 1H), 8,16 - 7,85 (m, 1H), 7,77 - 7,65 (m, 1H), 7,62 - 7,39 (m, 2H), 7,29 - 7,04 (tt, *J* = 9,4, 2,3 Hz, 1H), 6,73 - 6,47 (d, *J* = 3,1 Hz, 1H).

Intermediar 10: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă.



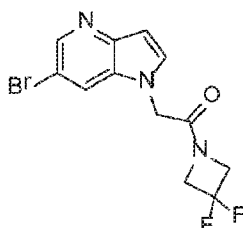
La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (1 g, 5,0 mmol) în DMF (20 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (284 mg, 7,1 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute și s-a adăugat 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă (1,02 g, 5,3 mmol) în DMF (5 mL). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă (1 mL) și amestecul de reacție a fost concentrat pe silicagel. Purificarea (FCC, SiO₂, 0-20% MeOH în EtOAc) a dat compusul din titlu (randament cantitativ). ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,37 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,18 (dd, *J* = 2,1, 0,8 Hz, 1H), 7,58 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 6,58 (dd, *J* = 3,3, 0,8 Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 3,56 (t, *J* = 6,8 Hz, 2H), 3,37 - 3,25 (m, 2H), 2,01 - 1,90 (m, 2H), 1,86 - 1,75 (m, 2H).

Intermediar 11: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă.



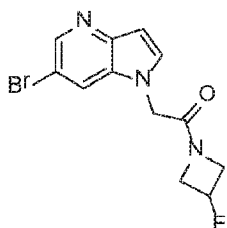
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, înlocuind 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă cu 2-bromo-1-morfolinoetanonă. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,37 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,18 (dd, *J* = 2,1, 0,9 Hz, 1H), 7,58 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 6,59 (dd, *J* = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,69 (t, *J* = 4,8 Hz, 2H), 3,60 (t, *J* = 4,9 Hz, 2H), 3,54 (t, *J* = 4,8 Hz, 2H), 3,44 (t, *J* = 4,8 Hz, 2H).

Intermediar 12: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



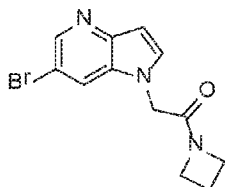
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, înlocuind 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă cu 2-bromo-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 1). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₂H₁₀BrF₂N₃O, 329,0; m/z găsit, 330,0 [M+H]⁺.

Intermediar 13: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



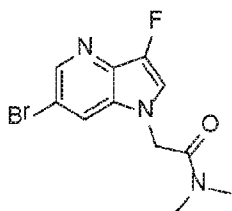
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, înlocuind 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă cu 2-bromo-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 2). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₂H₁₁BrFN₃O, 311,0; m/z găsit, 312,0 [M+H]⁺.

Intermediar 14: 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



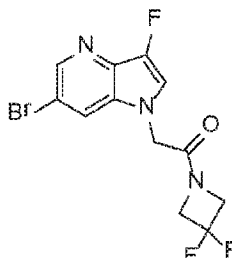
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-bromoetanonă și 6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridină. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,44 - 8,31 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,19 - 8,11 (m, 1H), 7,66 - 7,43 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 6,64 - 6,50 (m, 1H), 5,02 - 4,85 (s, 2H), 4,29 - 4,15 (m, 2H), 3,96 - 3,81 (m, 2H), 2,34 - 2,20 (m, 2H).

Intermediar 15: 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



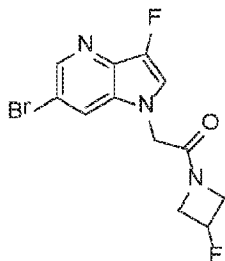
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, înlocuind 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă cu 2-bromo-N,N-dimetilacetamidă și 6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridină cu 6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridină (Intermediar 6). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,42 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,29 (t, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,63 (d, *J* = 2,2 Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Intermediar 16: 2-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



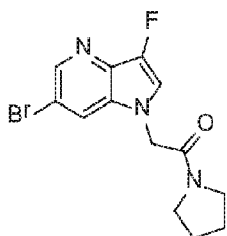
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 2-bromo-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 1) și 6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridină (Intermediar 6). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,52 - 8,39 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,34 - 8,21 (m, 1H), 7,73 - 7,53 (d, *J* = 2,2 Hz, 1H), 5,07 - 4,89 (s, 2H), 4,83 - 4,56 (m, 2H), 4,46 - 4,25 (m, 2H).

Intermediar 17: 2-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



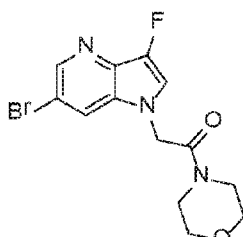
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 2-bromo-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 2) și 6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridină (Intermediar 6). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,51 - 8,36 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,36 - 8,17 (t, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,70 - 7,63 (d, *J* = 2,2 Hz, 1H), 5,60 - 5,48 (m, 0,5H), 5,48 - 5,31 (m, 0,5H), 5,07 - 4,79 (d, *J* = 2,2 Hz, 2H), 4,69 - 4,47 (m, 1H), 4,40 - 4,17 (m, 2H), 4,14 - 3,87 (m, 1H).

Intermediar 18: 2-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă.



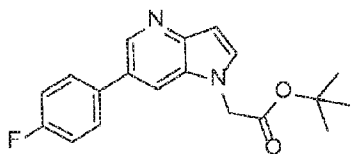
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 6, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 10). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,50 - 8,36 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,36-8,21 (t, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,76 - 7,57 (d, *J* = 2,2 Hz, 1H), 5,13-4,86 (s, 2H), 3,62 - 3,47 (m, 2H), 3,41 - 3,17 (s, 2H), 2,03 -1,86 (m, 2H), 1,86 - 1,66 (m, 2H).

Intermediar 19: 2-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 6, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₁₃BrFN₃O₂, 341,0; m/z găsit, 342,0 [M+H]⁺.

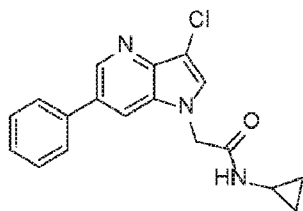
Intermediar 20: 2-(6-(4-Fluorofenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil.



Etapa A: 6-(4-Fluorofenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 7. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 11,39 (s, 1H), 8,60 (d, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,95 (dd, *J* = 2,1, 0,9 Hz, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,70 - 7,65 (m, 1H), 7,36 - 7,28 (m, 2H), 6,60 - 6,56 (m, 1H).

Etapa B: 2-(6-(4-Fluorofenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10. ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,65 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,79 (dd, *J* = 8,6, 5,5 Hz, 2H), 7,66 (d, *J* = 3,2 Hz, 1H), 7,34 (t, *J* = 8,8 Hz, 2H), 6,61 (d, *J* = 3,0 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 1,41 (s, 9H).

Exemplul 1: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă.



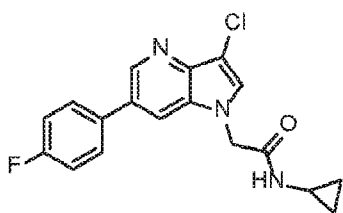
Etapa A: 6-Fenil-1H-pirololo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridină (400 mg, 2,03 mmol) în dioxan (100 mL) s-a adăugat acid fenilboronic (297 mg, 2,43 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (149 mg, 0,203 mmol), CS₂CO₃ (1,9 g, 6,09 mmol) și apă (10 mL). După 16 h la 90 °C amestecul de reacție s-a răcit și s-a concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (257 mg, 65%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₁₀N₂, 194,1; m/z găsit, 195,0 [M+H]⁺.

Etapa B: 3-Cloro-6-fenil-1H-pirololo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-fenil-1H-pirololo[3,2-b]piridină (600 mg, 3,09 mmol) în *N,N*-dimetilformamidă (6 mL) la 0 °C s-a adăugat *N*-clorosuccinimidă (619 mg, 4,64 mmol) în câteva porții mici. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitarea a fost continuată timp de 5 ore. Amestecul a fost turnat în apă (30 mL). Precipitatul a fost colectat și spălat cu metanol cald (5 mL) pentru a da compusul din titlu (503 mg,

2,20 mmol, 71%) ca pulbere maro deschis. MS (ESI): masă calc. Pentru $C_{13}H_9ClN_2$, 229,0; m/z găsit, 229 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 11,68 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,86 (d, $J = 2,9$ Hz, 1H), 7,74 (d, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,51 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,40 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H).

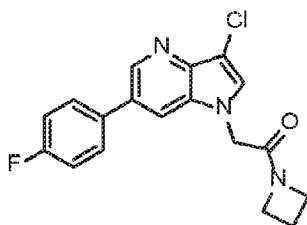
5 Etapa C: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă. La o soluție de 3-cloro-6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină (70 mg, 0,306 mmol) în DMF anhidră (1,4 mL) s-a adăugat NaH (dispersie 60%, 18 mg, 0,46 mmol) la 0 °C în porții mici, sub argon. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 min. Amestecul de reacție a fost răcit la 0 °C și la amestec s-a adăugat 2-bromo-N-ciclopropilacetamidă (81 mg, 0,46 mmol), în porții mici. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitarea a fost continuată timp de 2
10 ore. Amestecul de reacție a fost turnat în apă cu gheață (10 mL). Precipitatul a fost colectat și spălat cu apă (2 x 3 mL). S-a purificat (FCC, SiO_2 , cloroform în MeOH 100:1 până la 95:5). Produsul s-a triturat cu etanol cald (1 mL) pentru a da compusul din titlu (30 mg, 0,09 mmol, 30%) ca un pulbere albicioasă. MS (ESI): masă calc. Pentru $C_{18}H_{16}ClN_3O$, 325,1; m/z găsit, 326 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,83 (s, 1H),
15 7,76 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 4,89 (s, 2H), 2,71 - 2,58 (m, 1H), 0,68 - 0,57 (m, 2H), 0,51 - 0,33 (m, 2H).

Exemplul 2: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



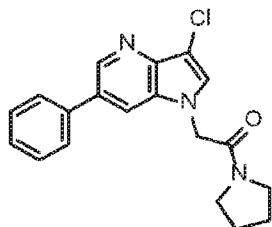
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,31 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,79 (dd, $J = 8,6, 5,3$ Hz, 2H), 7,35 (t, $J = 8,6$ Hz, 2H), 4,88 (s, 2H), 2,71 - 2,60 (m, 1H), 0,69 - 0,57 (m, 2H), 0,50 - 0,39 (m, 2H).

25 **Exemplul 3: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



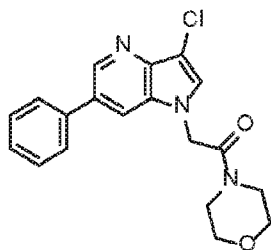
30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,86 - 7,74 (m, 2H), 7,79 (s, 1H), 7,36 (t, $J = 8,6$ Hz, 2H), 5,01 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,28 (quint, $J = 7,8$ Hz, 2H).

Exemplul 4: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă.



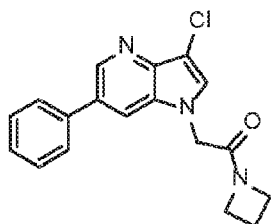
35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}ClN_3O$, 339,1; m/z găsit, 340,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,77 (d, $J = 7,8$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,58 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,37 - 3,26 (m, 2H), 1,97 (quint, $J = 6,7$ Hz, 2H), 1,81 (quint, $J = 6,9$ Hz, 2H).

40 **Exemplul 5: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă.**



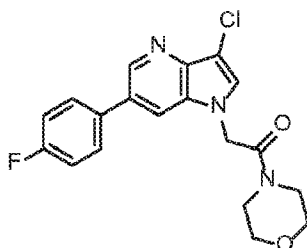
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}ClN_3O_2$, 355,1; m/z găsit, 356,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,76 (d, $J = 7,0$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,90 - 3,37 (m, 8H).

Exemplul 6: 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



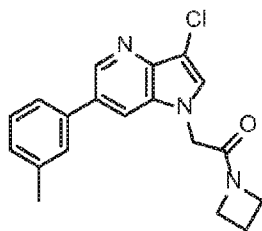
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}ClN_3O$, 325,1; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,77 (d, $J = 7,2$ Hz, 2H), 7,53 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,28 (quint, $J = 7,7$ Hz, 2H).

Exemplul 7: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



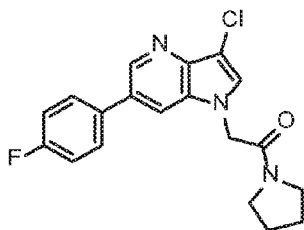
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClFN_3O_2$, 373,1; m/z găsit, 374,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,85 - 7,72 (m, 2H), 7,78 (s, 1H), 7,36 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 5,30 (s, 2H), 3,80 - 3,65 (m, 2H), 3,65 - 3,50 (m, 4H), 3,50 - 3,37 (m, 2H).

Exemplul 8: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



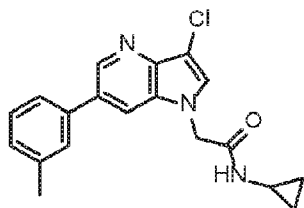
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}ClN_3O$, 339,1; m/z găsit, 340,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,55 (d, $J = 8,2$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,28 (quint, $J = 7,8$ Hz, 2H).

Exemplul 9: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



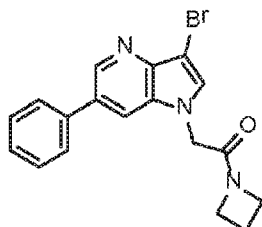
- 5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClFN_3O$, 357,1; m/z găsit, 358,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,80 (dd, $J = 8,4, 6,1$ Hz, 2H), 7,77 (s, 1H), 7,35 (t, $J = 8,6$ Hz, 2H), 5,18 (s, 2H), 3,58 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,36 - 3,20 (m, 2H), 1,97 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H), 1,81 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H).

Exemplul 10: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



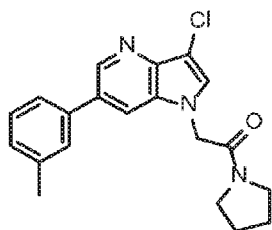
- 10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}ClN_3O$, 339,1; m/z găsit, 340,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,33 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,53 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 4,89 (s, 2H), 2,70 - 2,58 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 0,70 - 0,53 (m, 2H), 0,50-0,29 (m, 2H).

- 15 **Exemplul 11: 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-bromo-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.**



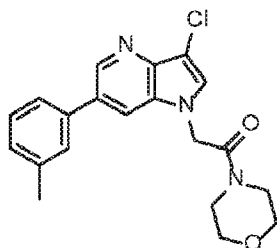
- 20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}BrN_3O$, 369,0; m/z găsit, 370,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,77 (d, $J = 7,7$ Hz, 2H), 7,53 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,30 (quint, $J = 7,5$ Hz, 2H).

Exemplul 12: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



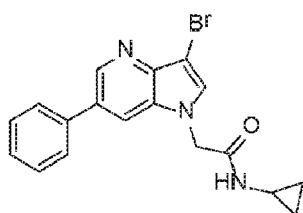
- 25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}ClN_3O$, 353,1; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,39 - 3,24 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,97 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H), 1,81 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H).

- 30 **Exemplul 13: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.**



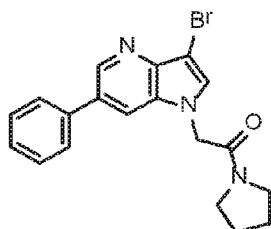
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}ClN_3O_2$, 369,1; m/z găsit, 370,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,53 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,85 - 3,65 (m, 2H), 3,65 - 3,50 (m, 4H), 3,50 - 3,37 (m, 2H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 14: 2-(3-Bromo-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă.



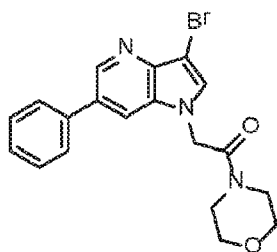
- 10 Etapă A: 3-Bromo-6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină (Intermediar 7, 526 mg, 2,708 mmol) în DMF (6 mL) la 0 °C s-a adăugat *N*-bromosuccinimidă (NBS) (500 mg, 2,809 mmol) în porții mici. Amestecul de reacție a fost agitat la 0 °C timp de 15 min. Amestecul de reacție a fost turnat în apă (25 mL). Precipitatul a fost
- 15 colectat și spălat cu apă (2 x 4 mL) și metanol (2 x 4 mL) pentru a da compusul din titlu (510 mg, 1,867 mmol, 69%) ca pulbere maro deschis. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{13}H_9BrN_2$, 272,0; m/z găsit, 273,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 11,78 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,88 (d, $J = 2,9$ Hz, 1H), 7,74 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,51 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,40 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H).
- 20 Etapă B: 2-(3-Bromo-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă. La o soluție de 3-bromo-6-fenil-1H-pirol[3,2-b]piridină (60 mg, 0,22 mmol) în DMF anhidră (1,5 mL) s-a adăugat NaH (dispersie 60%, 13 mg, 0,33 mmol) în porții mici, la 0 °C sub argon. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 min. Amestecul de reacție a fost răcit la 0 °C și la amestec s-a adăugat 2-bromo-*N*-ciclopropilacetamidă (43 mg, 0,24 mmol) în porții mici. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitarea a fost continuată timp de 1
- 25 oră. Amestecul de reacție a fost turnat în apă cu gheață (6 mL) și precipitatul a fost colectat și spălat cu apă (2 x 0,5 mL). Produsul brut a fost recristalizat din etanol (1,7 mL) pentru a da compusul din titlu (49 mg, 0,13 mmol, 60%) ca pulbere albă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}BrN_3O$, 369,0; m/z găsit, 370 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (s, 1H), 8,35 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,76 (d, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 2,71 - 2,59 (m, 1H), 0,68 - 0,55 (m, 2H), 0,49 - 0,36 (m, 2H).

30 **Exemplul 15: 2-(3-Bromo-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă.**



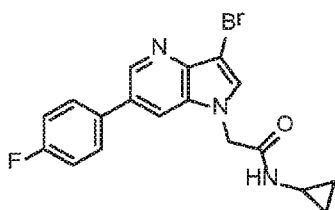
- 35 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}BrN_3O$, 383,1; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (s, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,76 (d, $J = 7,8$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,40 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,34 - 3,23 (m, 2H), 1,97 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H), 1,82 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H).

Exemplul 16: 2-(3-Bromo-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă.



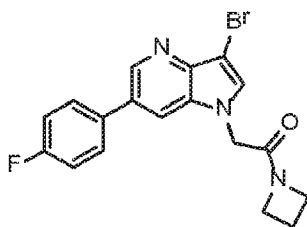
5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}BrN_3O_2$, 399,1; m/z găsit, 400,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,75 (d, $J = 7,7$ Hz, 2H), 7,52 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,80 - 3,65 (m, 2H), 3,65 - 3,50 (m, 4H), 3,51 - 3,37 (m, 2H).

Exemplul 17: 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



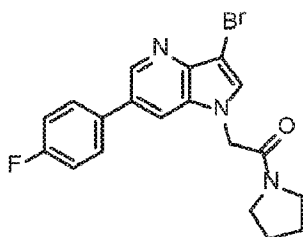
10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}BrFN_3O$, 387,0; m/z găsit, 388,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,34 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,80 (dd, $J = 8,5, 5,5$ Hz, 2H), 7,36 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 4,90 (s, 2H), 2,70 - 2,58 (m, 1H), 0,68 - 0,57 (m, 2H), 0,50 - 0,38 (m, 2H).

Exemplul 18: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



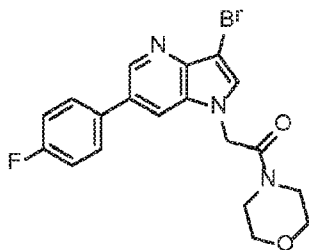
15 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}BrFN_3O$, 387,0; m/z găsit, 388,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,87 - 7,74 (m, 2H), 7,81 (s, 1H), 7,36 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 5,02 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,28 (quint, $J = 7,7$ Hz, 2H).

20 **Exemplul 19: 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.**



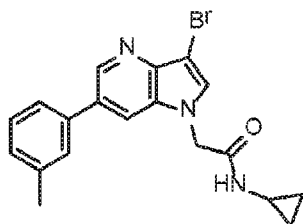
25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}BrFN_3O$, 401,1; m/z găsit, 402,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,88 - 7,70 (m, 2H), 7,79 (s, 1H), 7,35 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 5,19 (s, 2H), 3,58 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,38 - 3,25 (m, 2H), 1,97 (quint, $J = 6,7$ Hz, 2H), 1,81 (quint, $J = 6,8$ Hz, 2H).

Exemplul 20: 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



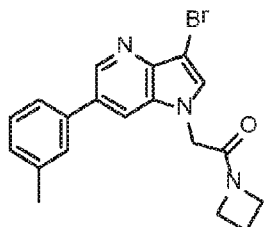
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}BrFN_3O_2$, 417,0; m/z găsit, 418,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,86 - 7,74 (m, 2H), 7,80 (s, 1H), 7,36 (t, J = 8,6 Hz, 2H), 5,31 (s, 2H), 3,76 - 3,65 (m, 2H), 3,64 - 3,51 (m, 4H), 3,51 - 3,38 (m, 2H).

Exemplul 21: 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



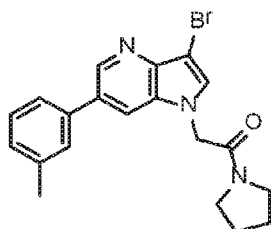
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}BrN_3O$, 383,1; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,35 (d, J = 4,1 Hz, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 7,40 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 2,71 - 2,59 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 0,70 - 0,57 (m, 2H), 0,50 - 0,37 (m, 2H).

Exemplul 22: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



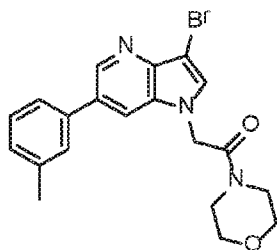
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}BrN_3O$, 383,1; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,53 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 7,40 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,25 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,28 (quint, J = 7,8 Hz, 2H).

Exemplul 23: 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



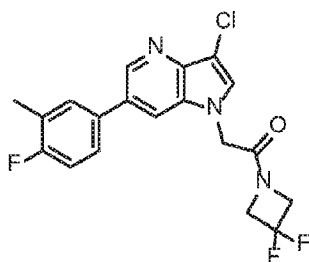
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}BrN_3O$, 397,1; m/z găsit, 398,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 7,40 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 7,5 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,59 (t, J = 6,8 Hz, 2H), 3,33 - 3,24 (m, 2H), 2,41 (s, 3H), 1,96 (quint, J = 6,7 Hz, 2H), 1,82 (quint, J = 6,8 Hz, 2H).

Exemplul 24: 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



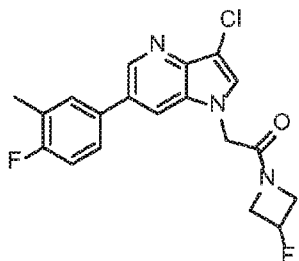
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 14. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}BrN_3O_2$, 413,1; m/z găsit, 414,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,56 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,93-3,66 (m, 2H), 3,66-3,50 (m, 4H), 3,50-3,37 (m, 2H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 25: 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



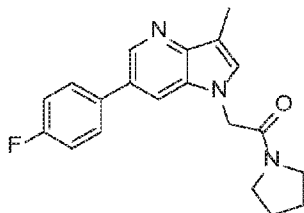
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$, 393,1; m/z găsit, 394,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,68 (d, $J = 6,8$ Hz, 1H), 7,63 - 7,52 (m, 1H), 7,29 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 2,34 (s, 3H).

Exemplul 26: 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$, 375,1; m/z găsit, 376,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,68 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,64 - 7,54 (m, 1H), 7,28 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,62 - 5,32 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,67 - 4,49 (m, 1H), 4,45 - 4,13 (m, 2H), 4,08 - 3,86 (m, 1H), 2,34 (s, 3H).

Exemplul 27: 2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Etapa A: 6-(4-Fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11,39 (s, 1H), 8,60 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,95 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,70 - 7,65 (m, 1H), 7,36 - 7,28 (m, 2H), 6,60 - 6,56 (m, 1H).

Etapa B: 2-(6-(4-fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *terț*-butil. Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa C, utilizand 2-bromoacetat de *terț*-butil și 6-(4-fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (s, 1H), 8,16 (s,

1H), 7,79 (dd, $J = 8,6, 5,5$ Hz, 2H), 7,66 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,34 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 6,61 (d, $J = 3,0$ Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 1,41 (s, 9H).

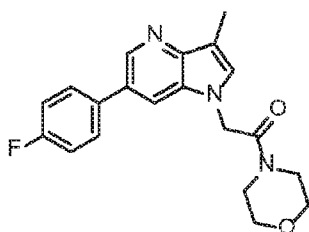
Etapă C: 2-(3-bromo-6-(4-fluorofenil)-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil. La o soluție de 2-(6-(4-fluorofenil)-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil (516 mg, 1,58 mmol) în DMF (10 mL) s-a adăugat N-bromosuccinimidă (NBS) (281 mg, 1,58 mmol) în porții mici. Amestecul de reacție a fost agitat la 50 °C timp de 2 ore. Amestecul de reacție a fost turnat în apă și extras cu EtOAc. Organicile combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate, și concentrate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc/hexani 0-100%) a dat compusul din titlu (640 mg, 37%).

Etapă D: 2-(6-(4-fluorofenil)-3-metil-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil. Pd(PPh₃)₂Cl₂ (272 mg, 0,39 mmol) s-a adăugat la o soluție de 2-(3-bromo-6-(4-fluorofenil)-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil (1,6 g, 3,9 mmol), tetrametilstanan (2,1 mL, 15 mmol) și LiCl (656 mg, 15 mmol) în DMF (5 mL) într-o eprubetă etanșată. Amestecul de reacție a fost încălzit la 110 °C timp de 12 ore și s-a adăugat apă urmată de EtOAc. Stratul organic a fost separat, uscat pe MgSO₄, filtrat și evaporat. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-50% în heptan) a dat compusul din titlu (1,3 g, 22%). MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₁FN₂O₂, 340,2; m/z găsit, 341,0 [M+H]⁺.

Etapă E: Acid 2-(6-(4-fluorofenil)-3-metil-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetic. La o soluție de 2-(6-(4-fluorofenil)-3-metil-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de *tert*-butil (290 mg, 0,85 mmol) în DCM (6 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat în picătură TFA (6 mL, 78 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. Volatilele au fost evaporate și brutul a fost utilizat direct în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară.

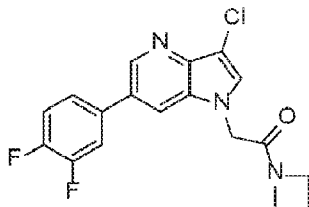
Etapă F: 2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă. La o soluție de acid 2-(6-(4-fluorofenil)-3-metil-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetic (80 mg, 0,28 mmol) în DMF (5 mL) s-a adăugat DIPEA (151 μL, 1,1 mmol) și HBTU (160 mg, 0,42 mmol). După 30 minute, s-a adăugat pirolidină (35 μL, 0,42 mmol) în DMF (0,2 mL) și amestecul de reacție a fost agitat timp de încă 30 minute. S-a adăugat o soluție apoasă saturată de NaHCO₃ urmată de EtOAc. Faza organică a fost separată, uscată pe MgSO₄, filtrată și evaporată. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în heptan) a dat compusul din titlu (31 mg, 32%). MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O, 337,2; m/z găsit, 338,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO) δ 8,60 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,82 - 7,69 (m, 2H), 7,42 - 7,25 (m, 3H), 5,09 (s, 2H), 3,57 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 3,33 - 3,24 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,02 - 1,88 (m, 2H), 1,87 - 1,72 (m, 2H).

Exemplul 28: 2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O₂, 353,2; m/z găsit, 354,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO) δ 8,59 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,02 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,75 (dd, $J = 8,5, 5,6$ Hz, 2H), 7,39 - 7,25 (m, 3H), 5,21 (s, 2H), 3,75 - 3,64 (m, 2H), 3,64 - 3,51 (m, 4H), 3,49 - 3,39 (m, 2H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 29: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

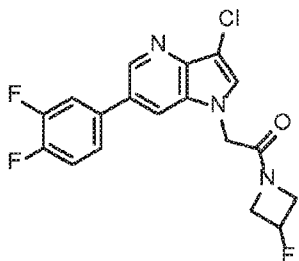


Etapă A: 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-bromo-3-cloro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă. La o soluție de 6-bromo-3-cloro-1H-pirol[3,2-b]piridină (Intermediar 5, 250 mg, 1,08 mmol) în DMF (60 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (60 mg, 1,51 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 minute și apoi răcit la 0 °C, urmat de adăugarea unei soluții de 1-(azetidin-1-il)-2-bromoetanonă (1,29 mmol) în DMF. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul

a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO_4), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (247 mg, 70%). MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{12}\text{H}_{11}\text{BrClN}_3\text{O}$, 327,0; m/z găsit, 328,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

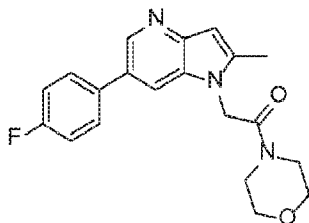
Etapa B: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}$, 361,1; m/z găsit, 361,9 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,76 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,27 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,90 (ddd, $J = 12,3, 7,8, 2,2$ Hz, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,69 - 7,52 (m, 2H), 5,01 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,36 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 30: 2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{18}\text{H}_{13}\text{ClF}_3\text{N}_3\text{O}$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,76 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,89 (ddd, $J = 10,4, 7,3, 1,8$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,72 - 7,49 (m, 2H), 5,48 (d, $J = 57,3$ Hz, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,70 - 4,46 (m, 1H), 4,37 (dd, $J = 26,4, 15,7$ Hz, 1H), 4,29 - 4,11 (m, 1H), 3,98 (dd, $J = 25,0, 11,6$ Hz, 1H).

Exemplul 31: 2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



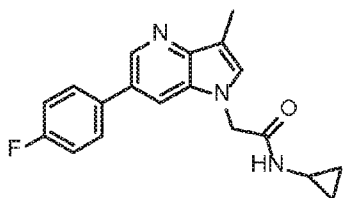
Etapa A: 2-Cloro-5-(4-fluorofenil)piridin-3-amină. La o soluție de acid 5-bromo-2-cloropiridin-3-amină (5 g, 24 mmol) și acid (4-fluorofenil)boronic (4 g, 29 mmol) în dioxan (100 mL) și apă (25 mL) s-a adăugat K_3PO_4 (15 g, 72 mmol) urmat de $\text{PdCl}_2(\text{dtbpf})$ (393 mg, 0,60 mmol). Amestecul de reacție a fost degazat și apoi încălzit la 80 °C timp de 2 ore. O dată răcit la temperatura camerei, la amestecul de reacție s-a adăugat apă și EtOAc. Faza apoasă a fost extrasă cu EtOAc (3x). Straturile organice combinate au fost spălate cu apă, uscate (Na_2SO_4), filtrate și evaporate pentru a da compusul din titlu (6 g, 76%). Brutul a fost utilizat în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară.

Etapa B: 5-(4-Fluorofenil)-2-(prop-1-in-1-il)piridin-3-amină. La o soluție de 2-cloro-5-(4-fluorofenil)piridin-3-amină (2 g, 6,7 mmol) și trimetil(prop-1-in-1-il)silan (12 mL, 82 mmol) în DMF (100 mL) s-a adăugat $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_2\text{Cl}_2$ (600 mg, 0,86 mmol), iodură de cupru(I) (100 mg, 0,53 mmol), CsF (13 g, 86 mmol) și Et_3N (22 mL, 158 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la 90 °C timp de 5 ore. Volatilele au fost evaporate și la reziduu s-a adăugat apă și s-a extras de 3 ori cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (Na_2SO_4), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-80% în eter de petrol) a dat compusul din titlu (250 mg, 14%). MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{14}\text{H}_{11}\text{FN}_2$, 226,1; m/z găsit, 227,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

Etapa C: Acid 2-(6-(4-fluorofenil)-2-metil-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il) acetic. La o soluție de 5-(4-fluorofenil)-2-(prop-1-in-1-il)piridin-3-amină (100 mg, 0,44 mmol) în DMF (10 mL), răcită la 0 °C, s-a adăugat NaH (35 mg, 0,88 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost apoi lăsat să se încălzească la temperatura camerei. După 12 ore, masa de reacție a fost răcită la 0 °C și s-a adăugat NaH (25 mg, 0,63 mmol, dispersie 60% în ulei) și s-a agitat la această temperatură timp de 30 minute. S-a adăugat în picătură 2-bromoacetat de etil (60 μL , 0,54 mmol) și amestecul a fost agitat la temperatura camerei timp de 5 ore. La 0 °C s-a adăugat apă și faza apoasă a fost extrasă cu MTBE. Stratul apos a fost acidulat cu HCl 1M și volatilele au fost evaporate pentru a da compusul din titlu (100 mg, 55%). Brutul a fost utilizat în etapa următoare fără nici o purificare suplimentară. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{FN}_2\text{O}_2$, 284,1; m/z găsit, 285,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

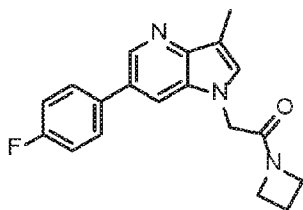
Etapa D: 2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă. Un amestec de intermediar acid 2-(6-(4-fluorofenil)-2-metil-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetic (100 mg, 0,24 mmol), morfolină (37 mg, 0,43 mmol), HATU (170 mg, 0,45 mmol) și Et₃N (63 μL, 0,45 mmol) în DMF (5 mL) a fost agitat la temperatura camerei timp de 1 oră. S-a adăugat apă și faza apoasă a fost extrasă de 3 ori cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (Na₂SO₄), filtrate și evaporate. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (30 mg, 33%). MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O₂, 353,2; m/z găsit, 354,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,53 (d, *J* = 1,5 Hz, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,76 (dd, *J* = 5,5, 8,5 Hz, 2H), 7,32 (t, *J* = 8,9 Hz, 2H), 6,38 (s, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,72 (br. s., 2H), 3,61 (d, *J* = 14,6 Hz, 4H), 3,44 (br. s., 2H), 2,34 (s, 3H).

Exemplul 32: N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



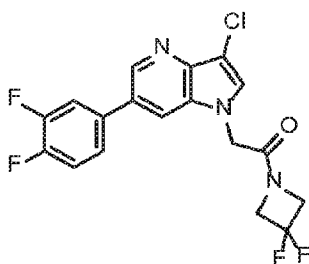
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₈FN₃O, 323,1; m/z găsit, 324,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,72 (s, 1H), 7,75 - 7,48 (m, 3H), 7,36 - 7,03 (m, 3H), 5,47 (br s, 1H), 4,75 (s, 2H), 2,72 - 2,60 (m, 1H), 2,45 (s, 3H), 0,91 - 0,63 (m, 2H), 0,48 - 0,15 (m, 2H).

Exemplul 33: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



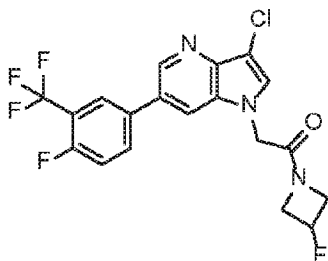
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₈FN₃O, 323,1; m/z găsit, 324,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,61 (s, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,82 - 7,70 (m, 2H), 7,43 - 7,25 (m, 3H), 4,93 (s, 2H), 4,19 (t, *J* = 7,4 Hz, 2H), 3,89 (t, *J* = 7,4 Hz, 2H), 2,37-2,15 (m, 5H).

Exemplul 34: 2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



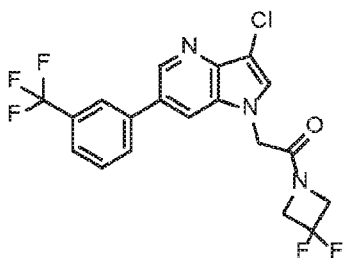
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₂ClF₄N₃O, 397,1; m/z găsit, 398,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,77 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,88 (dd, *J* = 12,0, 8,2 Hz, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,72 - 7,52 (m, 2H), 5,14 (s, 2H), 4,76 (t, *J* = 12,4 Hz, 2H), 4,38 (t, *J* = 12,6 Hz, 2H).

Exemplul 35: 2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



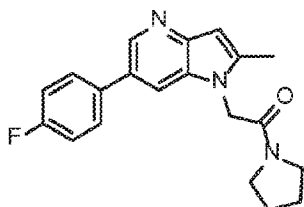
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$, 429,1; m/z găsit, 430,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,78 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,32 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18-8,06 (m, 2H), 7,84 (s, 1H), 7,69 (t, $J = 9,6$ Hz, 1H), 5,62 - 5,32 (m, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,68 - 4,48 (m, 1H), 4,45 - 4,15 (m, 2H), 4,07 - 3,86 (m, 1H).

Exemplul 36: 2-[3-Chloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



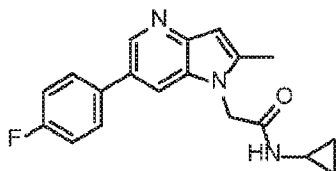
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$, 429,1; m/z găsit, 430,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,81 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,15 - 7,98 (m, 2H), 7,84 (s, 1H), 7,81 - 7,70 (m, 2H), 5,17 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H).

Exemplul 37: 2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



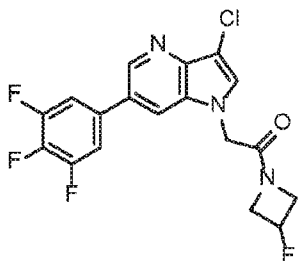
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,58 (br. s., 1H), 7,48 - 7,62 (m, 3H), 7,15 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 6,55 (s, 1H), 4,82 (s, 2H), 3,54 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 3,48 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,47 (s, 3H), 2,06 (quin, $J = 6,8$ Hz, 2H), 1,84 - 1,96 (m, 2H).

Exemplul 38: N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



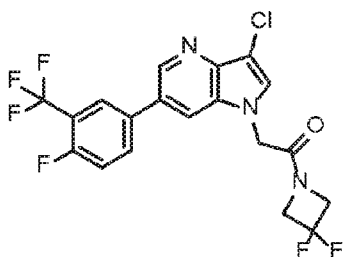
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,66 (br. s., 1H), 7,50 - 7,63 (m, 3H), 7,12 - 7,23 (m, 2H), 6,57 (s, 1H), 5,39 (br. s., 1H), 4,75 (s, 2H), 2,67 (qt, $J = 3,6$, 7,1 Hz, 1H), 2,45 (s, 3H), 0,70 - 0,80 (m, 2H), 0,30 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 39: 2-[3-Chloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



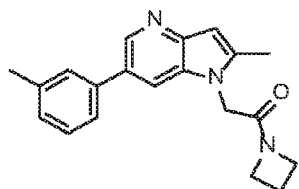
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}ClF_4N_3O$, 397,1; m/z găsit, 398,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,80 (s, 1H), 8,33 (s, 1H), 7,92 - 7,74 (m, 3H), 5,63 - 5,34 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,68 - 4,49 (m, 1H), 4,44 - 4,17 (m, 2H), 4,08-3,87 (m, 1H).

Exemplul 40: 2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



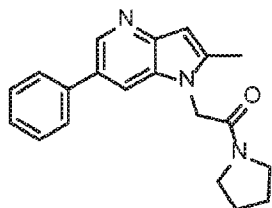
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{12}ClF_6N_3O$, 447,1; m/z găsit, 448,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 (s, 1H), 8,32 (s, 1H), 8,22 - 8,02 (m, 2H), 7,83 (s, 1H), 7,69 (t, $J = 9,7$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H).

Exemplul 41: 1-(Azetidin-1-il)-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



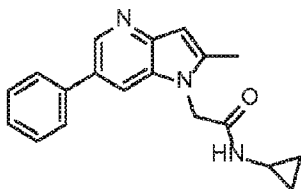
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,65 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,39 - 7,47 (m, 2H), 7,31 - 7,38 (m, 1H), 7,18 (d, $J = 7,3$ Hz, 1H), 6,52 (s, 1H), 4,73 (s, 2H), 4,05 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,59 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,16 (quin, $J = 7,8$ Hz, 2H).

Exemplul 42: 2-(2-Metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă.



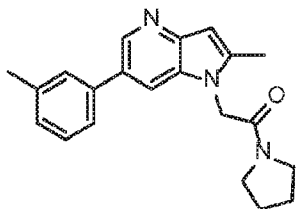
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,60 (br. s., 1H), 7,59 (d, $J = 7,3$ Hz, 3H), 7,44 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,29 - 7,38 (m, 1H), 6,54 (s, 1H), 4,81 (s, 2H), 3,48 (td, $J = 6,8, 20,0$ Hz, 4H), 2,44 (s, 3H), 2,03 (quin, $J = 6,7$ Hz, 2H), 1,82 - 1,92 (m, 2H).

Exemplul 43: N-Ciclopropil-2-(2-metil-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă.



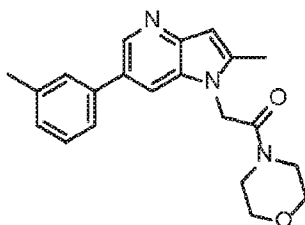
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,69 (s, 1H), 7,57 - 7,67 (m, 3H), 7,49 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,34 - 7,43 (m, 1H), 6,53 (s, 1H), 5,58 (br. s., 1H), 4,76 (s, 2H), 2,68 (dt, $J = 3,5, 7,1$ Hz, 1H), 2,45 (s, 3H), 0,69 - 0,80 (m, 2H), 0,31 - 0,43 (m, 2H).

Exemplul 44: 2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



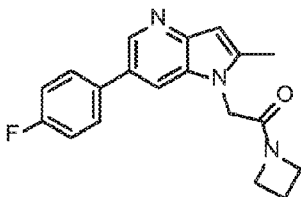
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{23}N_3O$, 333,2; m/z găsit, 334,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,36 - 7,44 (m, 2H), 7,29 - 7,36 (m, 1H), 7,15 (d, $J = 7,3$ Hz, 1H), 6,52 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 3,51 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,43 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 2,02 (quin, $J = 6,9$ Hz, 2H), 1,87 (quin, $J = 6,9$ Hz, 2H).

Exemplul 45: 2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



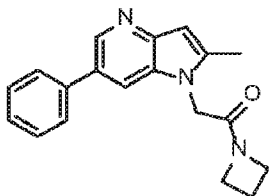
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{23}N_3O_2$, 349,2; m/z găsit, 350,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,36 - 7,44 (m, 2H), 7,29 - 7,36 (m, 1H), 7,15 (d, $J = 7,3$ Hz, 1H), 6,52 (s, 1H), 4,80 (s, 2H), 3,51 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,43 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,42 (s, 3H), 2,02 (quin, $J = 6,9$ Hz, 2H), 1,87 (quin, $J = 6,9$ Hz, 2H).

Exemplul 46: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



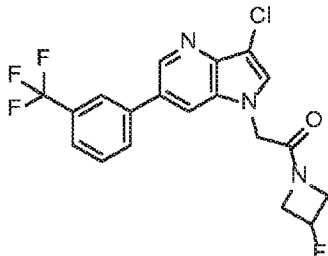
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,58 (br. s., 1H), 7,66 (s, 1H), 7,57 (dd, $J = 5,29, 8,4$ Hz, 2H), 7,16 (t, $J = 8,6$ Hz, 2H), 6,54 (s, 1H), 4,75 (s, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 3,76 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,23 (quin, $J = 7,8$ Hz, 2H).

Exemplul 47: 1-(Azetidin-1-il)-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,66 (br. s., 1H), 7,62 (d, $J = 8,6$ Hz, 3H), 7,46 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,32 - 7,39 (m, 1H), 6,52 (s, 1H), 4,72 (s, 2H), 4,05 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 3,64 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,47 (s, 3H), 2,17 (quin, $J = 7,8$ Hz, 2H).

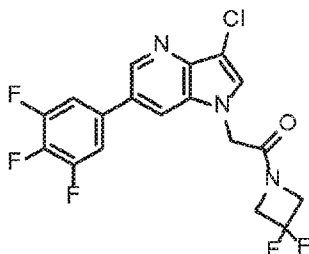
5 **Exemplul 48:** 2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$, 411,1; m/z găsit, 412,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,81 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,08 (s, 2H), 7,94 - 7,65 (m, 3H), 5,65 - 5,32 (m, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,70-4,47 (m, 1H), 4,46 - 4,15 (m, 2H), 4,08-3,84 (m, 1H).

Exemplul 49: 2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.

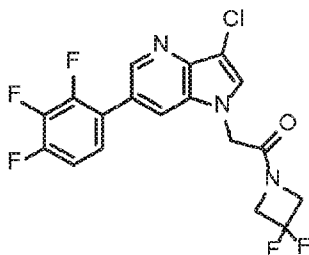
15



20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{11}ClF_5N_3O$, 415,1; m/z găsit, 416,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,81 (s, 1H), 8,33 (s, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,81 (dd, $J = 9,3, 7,0$ Hz, 2H), 5,14 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,4$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H).

Exemplul 50: 2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.

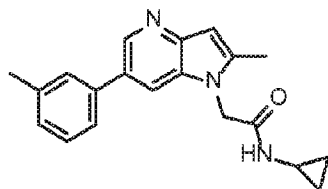
25



25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{11}ClF_5N_3O$, 415,1; m/z găsit, 416,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$): 8,58 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,57 - 7,41 (m, 2H), 5,14 (s, 2H), 4,75 (t, $J = 12,4$ Hz, 2H), 4,37 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H).

Exemplul 51: N-Ciclopropil-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

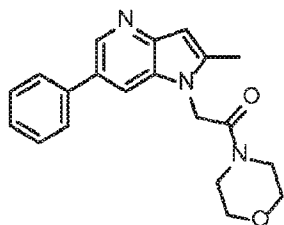
30



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,68 (s,

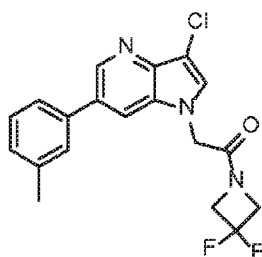
1H), 7,64 (s, 1H), 7,32 - 7,47 (m, 3H), 7,21 (d, $J = 7,1$ Hz, 1H), 6,52 (s, 1H), 5,65 (br. s., 1H), 4,76 (s, 2H), 2,68 (dt, $J = 3,5, 7,1$ Hz, 1H), 2,46 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 0,74 (d, $J = 5,7$ Hz, 2H), 0,38 (dd, $J = 1,0, 3,6$ Hz, 2H).

Exemplul 52: 2-(2-Metil-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă.



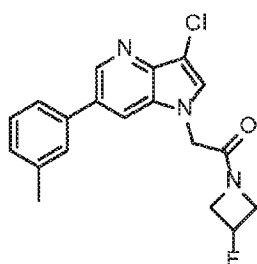
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O_2$, 335,2; m/z găsit, 336,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,37 (s, 1H), 7,30 - 7,36 (m, 2H), 7,19 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,05 - 7,12 (m, 1H), 6,99 (s, 1H), 6,29 (s, 1H), 4,61 (s, 2H), 3,46 (d, $J = 4,0$ Hz, 4H), 3,38 (d, $J = 4,0$ Hz, 2H), 3,30 (d, $J = 4,4$ Hz, 2H), 2,17 (s, 3H).

Exemplul 53: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



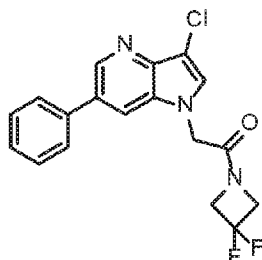
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$, 375,1; m/z găsit, 376,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,72 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 7,41 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 54: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



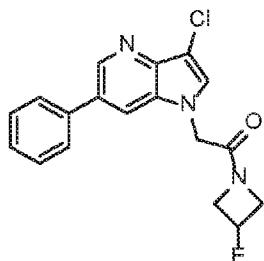
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClFN_3O$, 357,1; m/z găsit, 358,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,72 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,20 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,60 - 7,49 (m, 2H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,63 - 5,32 (m, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,68 - 4,48 (m, 1H), 4,44 - 4,16 (m, 2H), 4,08-3,86 (m, 1H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 55: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.



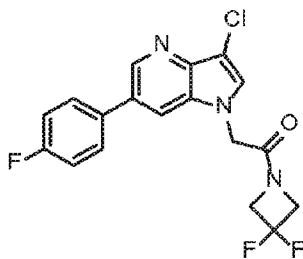
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,76 (d, $J = 8,2$ Hz, 2H), 7,53 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 7,42 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H).

5 **Exemplul 56: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.**



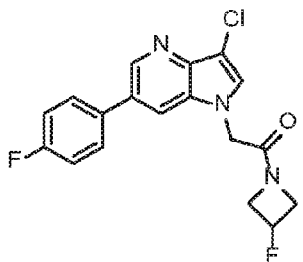
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClF_3N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,22 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,81 - 7,72 (m, 3H), 7,52 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,41 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 5,56 - 5,38 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 3,0$ Hz, 2H), 4,66 - 4,51 (m, 1H), 4,42 - 4,30 (m, 1H), 4,30-4,19 (m, 1H), 4,06-3,88 (m, 1H).

15 **Exemplul 57: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă.**



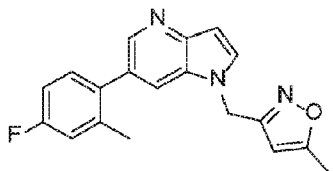
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,22 (s, 1H), 7,87 - 7,71 (m, 2H), 7,79 (s, 1H), 7,36 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 5,14 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,4$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H).

Exemplul 58: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,21 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,88 - 7,72 (m, 3H), 7,36 (t, $J = 8,7$ Hz, 2H), 5,62 - 5,32 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,66 - 4,49 (m, 1H), 4,46 - 4,15 (m, 2H), 4,06 - 3,89 (m, 1H).

30 **Exemplul 59: 3-[[6-(4-Fluoro-2-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol.**

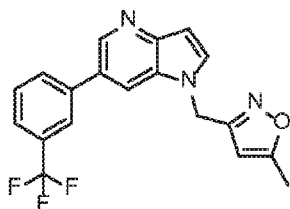


Etapă A: 3-((6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)metil)-5-metilizoxazol. La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (300 mg, 1,5 mmol) în DMF (2 mL), la 0 °C, s-a adăugat NaH (183 mg, 4,6 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura

camerei și agitat timp de 10 minute și apoi răcit la 0 °C și s-a adăugat 3-(clorometil)-5-metilizoxazol (240 mg, 1,8 mmol). Amestecul a fost agitat la 0 °C timp de 10 minute apoi încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 4 ore. S-a adăugat apă și amestecul de reacție a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (407 mg, 92%). ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,41 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,26 (dd, *J* = 2,0, 0,9 Hz, 1H), 7,78 (d, *J* = 3,4 Hz, 1H), 6,64 (dd, *J* = 3,3, 1,0 Hz, 1H), 6,07 (d, *J* = 1,0 Hz, 1H), 5,52 (s, 2H), 2,33 (d, *J* = 0,9 Hz, 3H).

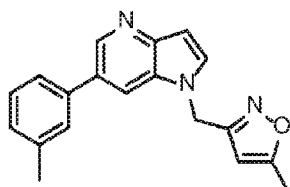
Etapă B: 3-[[6-(4-Fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol. Într-un flacon pentru microunde, 3-((6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)metil)-5-metilizoxazol (50 mg, 0,17 mmol) a fost dizolvat în dioxan (3 mL), urmat de adăugare de acid (4-fluoro-2-metilfenil)boronic (32 mg, 0,21 mmol), Pd(PPh₃)₄ (19 mg, 0,02 mmol), Na₂CO₃ (54 mg, 0,51 mmol) și apă (3 mL). Flaconul la microunde a fost acoperit și amestecul de reacție a fost încălzit la 70 °C timp de 14 ore și apoi răcit la temperatura camerei. S-a adăugat DMSO (1 mL) și amestecul de reacție a fost filtrat, diluat cu MeOH și purificat prin HPLC Metodă C pentru a da compusul din titlu (23 mg, 42%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₆FN₃O, 321,1; *m/z* găsit, 322,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,66 (d, *J* = 1,6 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,20 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,41 (dd, *J* = 8,5, 6,0 Hz, 1H), 7,27 (dd, *J* = 10,2, 2,7 Hz, 1H), 7,20 (td, *J* = 8,6, 2,8 Hz, 1H), 6,87 (dd, *J* = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 6,19 (d, *J* = 0,9 Hz, 1H), 5,72 (s, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,28 (s, 3H).

Exemplul 60: 5-Metil-3-[[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol.



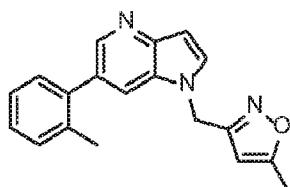
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₄F₃N₃O, 357,1; *m/z* găsit, 358,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9,03 (d, *J* = 1,8 Hz, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,20 (s, 1H), 8,19 - 8,14 (m, 2H), 7,87 - 7,76 (m, 2H), 6,86 (d, *J* = 3,2 Hz, 1H), 6,18 (s, 1H), 5,77 (s, 2H), 2,33 (s, 3H).

Exemplul 61: Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(*m*-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol.



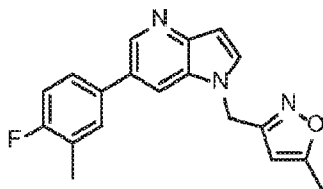
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇N₃O, 303,1; *m/z* găsit, 304,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,99 (d, *J* = 1,7 Hz, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,21 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,65 (d, *J* = 7,9 Hz, 1H), 7,46 (t, *J* = 7,6 Hz, 1H), 7,30 (d, *J* = 7,5 Hz, 1H), 6,87 (d, *J* = 3,2 Hz, 1H), 6,20 (d, *J* = 0,8 Hz, 1H), 5,79 (s, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,34 (s, 3H).

Exemplul 62: Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(*o*-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol.



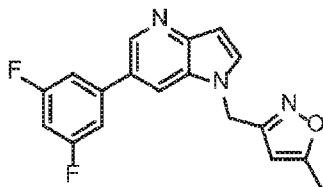
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇N₃O, 303,1; *m/z* găsit, 304,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,69 (d, *J* = 1,6 Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,22 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,42 - 7,34 (m, 4H), 6,88 (dd, *J* = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 6,19 (d, *J* = 1,0 Hz, 1H), 5,73 (s, 2H), 2,34 (d, *J* = 0,9 Hz, 3H), 2,27 (s, 3H).

Exemplul 63: Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol.



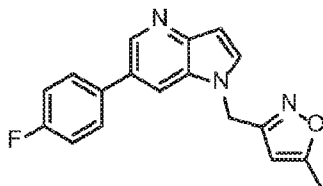
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}FN_3O$, 321,1; m/z găsit, 322,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,96 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,89 (s, 1H), 8,19 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,80 (dd, $J = 7,3, 2,4$ Hz, 1H), 7,74 - 7,67 (m, 1H), 7,35 (dd, $J = 9,6, 8,6$ Hz, 1H), 6,86 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,19 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 5,77 (s, 2H), 2,37-2,32 (m, 6H).

Exemplul 64: Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol.



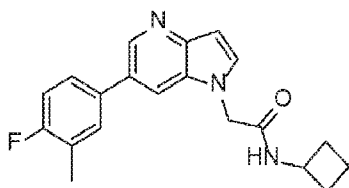
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_2N_3O$, 325,1; m/z găsit, 326,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,00 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,89 (s, 1H), 8,14 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,72 - 7,63 (m, 2H), 7,38 - 7,28 (m, 1H), 6,83 (dd, $J = 3,4, 0,8$ Hz, 1H), 6,18 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 5,73 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 0,8$ Hz, 3H).

Exemplul 65: Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 59. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}FN_3O$, 307,1; m/z găsit, 308,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,95 (s, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,20 - 8,15 (m, 1H), 7,93 - 7,85 (m, 2H), 7,48 - 7,37 (m, 2H), 6,88 - 6,83 (m, 1H), 6,19 (s, 1H), 5,76 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H).

Exemplul 66: Sare trifluoroacetat de N-ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Etapa A: 6-(4-Fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. La o soluție a 6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridină (2 g, 10,2 mmol) în dioxan (50 mL) s-a adăugat acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic (1,9 g, 12,2 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (743 mg, 1,02 mmol), Cs₂CO₃ (9,9 g, 30,5 mmol) și apă (5 mL). După 16 ore la 90 °C amestecul de reacție a fost răcit și concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (1,95 g, 85%). ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 11,37 (s, 1H), 8,59 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,93 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,71 - 7,62 (m, 2H), 7,59 - 7,51 (m, 1H), 7,24 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,59 - 6,55 (m, 1H), 2,33 (d, $J = 2,0$ Hz, 3H).

Etapa B: 2-(6-(4-Fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetat de etil. La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină (1,5 g, 6,6 mmol) în DMF (60 mL), la 0 °C, s-a adăugat NaH (371 mg, 9,3 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 minute. Amestecul de reacție a fost răcit la 0 °C și s-a adăugat 2-bromoacetat de etil (0,77 mL, 7 mmol). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul a fost extras cu EtOAc.

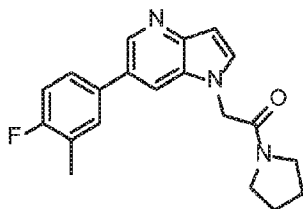
Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO_4), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-50% în hexani) a dat compusul din titlu (1,8 g, 87%). ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,65 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,69 (dd, $J = 7,7, 2,5$ Hz, 1H), 7,67 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 1H), 7,29 - 7,21 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,2, 0,8$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H),

4,16 (q, $J = 7,1$ Hz, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,22 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H).

Etapa C: Acid 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic. La o soluție de 2-(6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetat de etil (700 mg, 2,2 mmol) în THF (40 mL) s-a adăugat LiOH (107 mg, 4,5 mmol) în apă (10 mL) și amestecul de reacție a fost agitat la temperatura camerei timp de 30 minute. Amestecul de reacție a fost apoi acidulat cu HCl 1N și extras cu EtOAc. PH-ul stratului apos a fost ajustat la pH 6 și produsul a precipitat. Solidul a fost colectat prin filtrare și utilizat brut în etapa următoare (300 mg, 47%). MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{16}\text{H}_{13}\text{FN}_2\text{O}_2$, 284,1; m/z găsit, 285,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$.

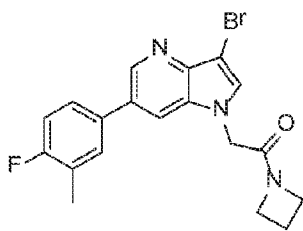
Etapa D: Sare trifluoroacetat de N-ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă. La o suspensie de acid 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic (50 mg, 0,18 mmol) și BOP (78 mg, 0,18 mmol) în DCM (3 mL) s-a adăugat Et_3N (73 μL , 0,53 mmol) urmată de ciclobutanamină (30 μL , 0,36 mmol). Materialul brut a fost purificat prin HPLC Metoda C pentru a da compusul din titlu (9 mg, 11%). MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{FN}_3\text{O}$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,88 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,57 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 8,00 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,76 (dd, $J = 7,4, 2,4$ Hz, 1H), 7,71 - 7,65 (m, 1H), 7,33 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,77 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,25-4,13 (m, 1H), 2,35 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H), 2,21 - 2,11 (m, 2H), 1,99 - 1,89 (m, 2H), 1,71 - 1,56 (m, 2H).

Exemplul 67: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{20}\text{H}_{20}\text{FN}_3\text{O}$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,91 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,01 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,80 - 7,75 (m, 1H), 7,71 - 7,66 (m, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 1H), 6,81 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,65 - 3,57 (m, 2H), 3,36 - 3,30 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,03 - 1,96 (m, 2H), 1,85 - 1,79 (m, 2H).

Exemplul 68: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

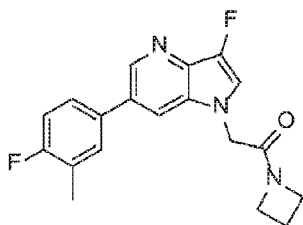


Etapa A: 3-Bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină (Exemplul 66, Etapa A, 1 g, 4,4 mmol) în DMF (45 mL) la temperatura camerei s-a adăugat NBS (944 mg, 5,3 mmol). După 1 oră, s-a adăugat apă și amestecul de reacție a fost extras cu EtOAc 60% în hexani. Straturile organice combinate au fost spălate cu apă, uscate pe MgSO_4 , filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (1,2 g, 89%). ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 11,78 (s, 1H), 8,67 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,98 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,88 (d, $J = 2,9$ Hz, 1H), 7,72 - 7,63 (m, 1H), 7,62 - 7,53 (m, 1H), 7,25 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Etapa B: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. La o soluție de 3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină (200 mg, 0,66 mmol) în DMF (7 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (37 mg, 0,92 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 minute și apoi răcit la 0 °C urmat de adăugarea unei soluții de 1-(azetidin-1-il)-2-bromoetanonă (140 mg, 0,78 mmol) în DMF (3 mL). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a

adăugat apă și amestecul a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% in hexani) a dat compusul din titlu (178 mg, 68%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇BrFN₃O, 401,1; m/z găsit, 402,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ 8,70 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,71 - 7,67 (m, 1H), 7,64 - 7,56 (m, 1H), 7,28 (dd, J = 9,7, 8,5 Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,24 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,34 (d, J = 1,9 Hz, 3H), 2,33 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 69: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



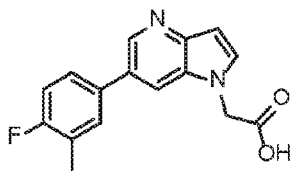
Etapă A: 3-Bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1-((2-(trimetilsilil)etoxi)-metil)-1H-pirol[3,2-b]piridină. La o soluție de 3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină (Exemplul 68, Etapa A, 200 mg, 0,66 mmol) în DMF (5 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (34 mg, 0,85 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 minute și apoi răcit la 0 °C urmat de adăugarea unei soluții de (2-(clorometoxi)etil)trimetilsilan (120 mg, 0,72 mmol) în DMF (3 mL). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% in hexani) a dat compusul din titlu (166 mg, 58%). ¹H RMN (500 MHz, DMSO-d₆) δ 8,75 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,73 - 7,69 (m, 1H), 7,64 - 7,59 (m, 1H), 7,32 - 7,25 (m, 1H), 5,65 (s, 2H), 3,52 - 3,44 (m, 2H), 2,34 (d, J = 1,8 Hz, 3H), 0,84 - 0,76 (m, 2H), -0,11 (s, 9H).

Etapă B: 3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1-((2-(trimetilsilil)etoxi)-metil)-1H-pirol[3,2-b]piridină. La o soluție de 3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1-((2-(trimetilsilil)etoxi)metil)-1H-pirol[3,2-b]piridină (160 mg, 0,34 mmol) în THF (10 mL) la -78 °C s-a adăugat tBuLi (0,65 mL, 1,1 mmol, 1,7M în pentan) și amestecul de reacție a fost agitat la -78 °C timp de 1 oră. S-a adăugat în picătură N-fluoro-N-(fenilsulfonil)benzensulfonamidă (348 mg, 1,10 mmol) în THF (2 mL) și amestecul de reacție a fost agitat la -78 °C timp de 30 minute, încălzit la 0 °C și agitat timp de 30 minute. Amestecul de reacție a fost turnat în apă și extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% in hexani) a dat compusul din titlu (77 mg, 56%). MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₄F₂N₂OSi, 374,2; m/z găsit, 375,2 [M+H]⁺.

Etapă C: 3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină. La o soluție de 3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1-((2-(trimetilsilil)etoxi)-metil)-1H-pirol[3,2-b]piridină (75 mg, 0,2 mmol) în THF (3 mL) s-a adăugat TBAF (0,8 mL, 0,8 mmol, 1M în THF) și amestecul de reacție a fost încălzit la 60 °C timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul de reacție a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% in hexani) a dat compusul din titlu (29 mg, 59%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₄H₁₀F₂N₂, 244,1; m/z găsit, 245,1 [M+H]⁺.

Etapă D: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 68 Etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇F₂N₃O, 341,1; m/z găsit, 342,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (600 MHz, CDCl₃) δ 8,69 (s, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,44 - 7,40 (m, 1H), 7,40 - 7,36 (m, 1H), 7,18 (dd, J = 2,6, 1,1 Hz, 1H), 7,11 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 4,68 (s, 2H), 4,09 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 3,92 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,37 (s, 3H), 2,31 - 2,24 (m, 2H).

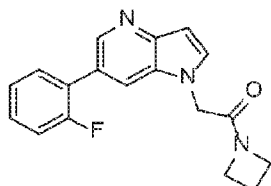
Exemplul 70: Acid 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66 Etapa A prin Etapa C. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₆H₁₃FN₂O₂, 284,1; m/z găsit, 285,1 [M+H]⁺. ¹H RMN

(400 MHz, DMSO- d_6) δ 13,32 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 9,00 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,19 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,85 (dd, J = 7,3, 2,4 Hz, 1H), 7,79 - 7,71 (m, 1H), 7,36 (dd, J = 9,6, 8,6 Hz, 1H), 6,89 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 2,35 (d, J = 1,9 Hz, 3H).

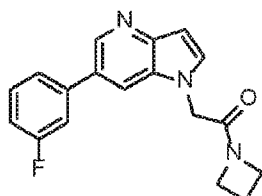
Exemplul 71: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Etapa A: 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă. La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (1,5 g, 7,6 mmol) la 0 °C s-a adăugat NaH (913 mg, 22,8 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute la rt, apoi răcit la 0 °C și s-a adăugat 1-(azetidin-1-il)-2-bromoetanonă (1,6 g, 9,1 mmol) în DMF (10 mL). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul de reacție a fost extras cu EtOAc. Organicele au fost combinate, uscate, și concentrate sub presiune redusă. Purificarea (FCC, 0-30% MeOH în DCM) a dat compusul din titlu 1,39 g, 62%. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,38 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,16 (dd, J = 2,0, 1,0 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,59 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,22 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,33 - 2,22 (m, 2H).

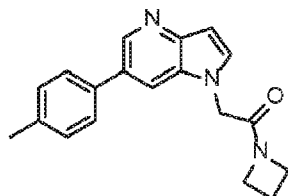
Etapa B: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59, Etapa B utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă și acid (2-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{FN}_3\text{O}$, 309,1; m/z găsit, 310,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 - 8,49 (m, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,64 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,60 (td, J = 7,8, 1,7 Hz, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 2H), 6,62 (dd, J = 3,2, 0,9 Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,20 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 3,90 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,30 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 72: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



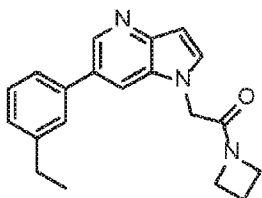
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71 utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă și acid (3-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{18}\text{H}_{16}\text{FN}_3\text{O}$, 309,1; m/z găsit, 310,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,18 (dd, J = 2,1, 0,9 Hz, 1H), 7,65 - 7,60 (m, 3H), 7,58 - 7,51 (m, 1H), 7,24 - 7,18 (m, 1H), 6,61 (dd, J = 3,2, 0,9 Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,21 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,32 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 73: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



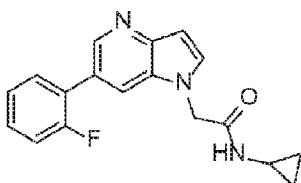
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71 utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă și acid p-tolilboronic. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 - 8,60 (m, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,67 - 7,61 (m, 2H), 7,59 - 7,55 (m, 1H), 7,34 - 7,28 (m, 2H), 6,60 - 6,56 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,20 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 3,90 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,30 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 74: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71 utilizând 1-(azetidină-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă și acid (3-etilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,08 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,61 - 7,52 (m, 3H), 7,41 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,20 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,70 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,31 - 2,21 (m, 2H), 1,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

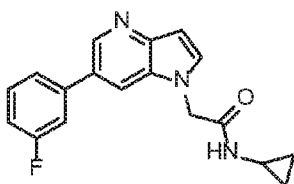
Exemplul 75: N-Ciclopropil-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Etapa A: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă. La o soluție de 6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridină (1 g, 5,0 mmol) în DMF (20 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (284 mg, 7,1 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute și s-a adăugat 2-bromo-N-ciclopropilacetamidă (1,08 g, 6,1 mmol) în DMF (5 mL). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. Apoi s-a adăugat apă și amestecul de reacție a fost extras cu EtOAc 60% în hexani. Straturile organice combinate au fost uscate ($MgSO_4$), filtrate și evaporate. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (1,21 g, 81%). ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,38 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,31 (d, $J = 4,3$ Hz, 1H), 8,12 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,81 (s, 2H), 2,69 - 2,60 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,41 (m, 2H).

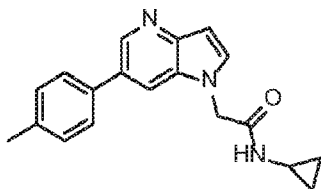
Etapa B: N-Ciclopropil-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59, Etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 4,3$ Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,66 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,60 (td, $J = 7,8, 1,7$ Hz, 1H), 7,48 - 7,41 (m, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 2H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,85 (s, 2H), 2,68 - 2,59 (m, 1H), 0,66 - 0,58 (m, 2H), 0,46 - 0,39 (m, 2H).

Exemplul 76: N-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



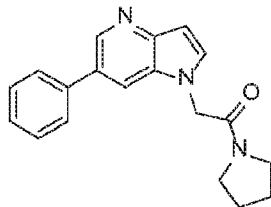
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,17 - 8,14 (m, 1H), 7,66 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 2H), 7,58 - 7,50 (m, 1H), 7,24 - 7,17 (m, 1H), 6,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 4,88 (s, 2H), 2,69 - 2,60 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 77: N-Ciclopropil-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,03 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,66 - 7,58 (m, 3H), 7,34 - 7,28 (m, 2H), 6,57 (dd, $J = 3,2, 0,8$ Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 2,70 - 2,59 (m, 1H), 2,36 (s, 3H), 0,67 - 0,59 (m, 2H), 0,47 - 0,40 (m, 2H).

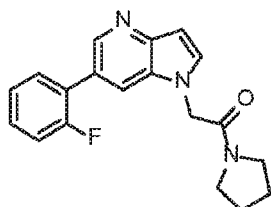
Exemplul 78: 2-(6-Fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Etapa A: 2-(6-Bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă. La o soluție de 6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridină (1 g, 5,0 mmol) în DMF (20 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (284 mg, 7,1 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute și s-a adăugat 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanonă (1,02 g, 5,3 mmol) în DMF (5 mL). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă (1 mL) și amestecul de reacție a fost concentrat pe silicagel. Purificarea (FCC, SiO_2 , MeOH 0-20% în EtOAc) a dat compusul din titlu (randament cantitativ). ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,37 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,1, 0,8$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,58 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 3,56 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,37 - 3,25 (m, 2H), 2,01 - 1,90 (m, 2H), 1,86 - 1,75 (m, 2H).

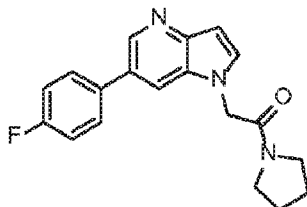
Etapa B: 2-(6-Fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 59, Etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 - 8,62 (m, 1H), 8,12 - 8,10 (m, 1H), 7,77 - 7,71 (m, 2H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,53 - 7,46 (m, 2H), 7,40 - 7,34 (m, 1H), 6,60 - 6,57 (m, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,62 - 3,56 (m, 2H), 3,35 - 3,30 (m, 2H), 2,01 - 1,92 (m, 2H), 1,85 - 1,76 (m, 2H).

Exemplul 79: 2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



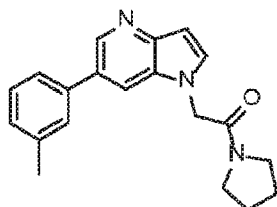
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,49 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,63 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,48 - 7,41 (m, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 6,63 - 6,60 (m, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,61 - 3,53 (m, 2H), 3,34 - 3,30 (m, 2H), 1,98 - 1,92 (m, 2H), 1,83 - 1,76 (m, 2H).

Exemplul 80: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



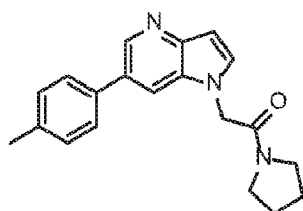
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 - 8,61 (m, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,60 - 7,57 (m, 1H), 7,36 - 7,29 (m, 2H), 6,60 - 6,57 (m, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,32 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 1,99 - 1,93 (m, 2H), 1,84 - 1,77 (m, 2H).

Exemplul 81: 2-[6-(m-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă



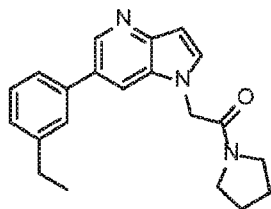
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 8,10 - 8,07 (m, 1H), 7,58 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,52 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,38 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,19 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,58 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,33 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,40 (s, 3H), 1,99 - 1,94 (m, 2H), 1,84 - 1,77 (m, 2H).

Exemplul 82: 2-[6-(p-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



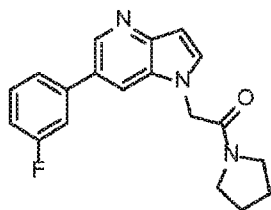
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 - 8,60 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 2H), 7,56 (dd, $J = 3,2, 1,0$ Hz, 1H), 7,30 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 6,58 - 6,55 (m, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,32 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 2,36 (s, 3H), 2,00 - 1,92 (m, 2H), 1,84 - 1,76 (m, 2H).

Exemplul 83: 2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



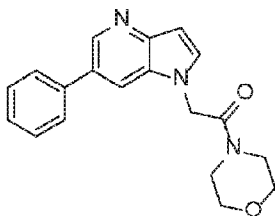
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{23}N_3O$, 333,2; m/z găsit, 334,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 - 8,62 (m, 1H), 8,09 - 8,07 (m, 1H), 7,59 - 7,51 (m, 3H), 7,42 - 7,38 (m, 1H), 7,22 (d, $J = 7,1$ Hz, 1H), 6,59 - 6,57 (m, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,32 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 2,70 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,00 - 1,94 (m, 2H), 1,84 - 1,77 (m, 2H), 1,27 - 1,22 (m, 3H).

Exemplul 84: 2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 78. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 - 8,68 (m, 1H), 8,20 - 8,17 (m, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 3H), 7,56 - 7,50 (m, 1H), 7,23 - 7,17 (m, 1H), 6,62 - 6,58 (m, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,59 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,33 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,00 - 1,94 (m, 2H), 1,85 - 1,77 (m, 2H).

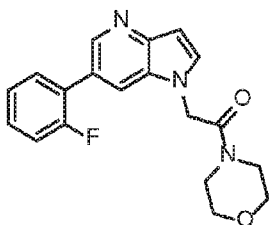
Exemplul 85: 1-Morfolino-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



Etapa A: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 78, Etapa A înlocuind 2-bromo-1-(pirolidin-1-il)etanona cu 2-bromo-1-morfolinoetanonă. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,37 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,69 (t, $J = 4,8$ Hz, 2H), 3,60 (t, $J = 4,9$ Hz, 2H), 3,54 (t, $J = 4,8$ Hz, 2H), 3,44 (t, $J = 4,8$ Hz, 2H).

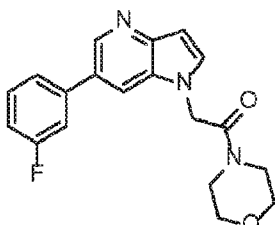
Etapa B: 1-Morfolino-2-(6-fenilpirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 78, Etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}_2$, 321,1; m/z găsit, 322,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,76 - 7,70 (m, 2H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,54 - 7,47 (m, 2H), 7,41 - 7,35 (m, 1H), 6,59 (s, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,70 (s, 2H), 3,59 (s, 4H), 3,44 (s, 2H).

Exemplul 86: 2-[6-(2-Fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



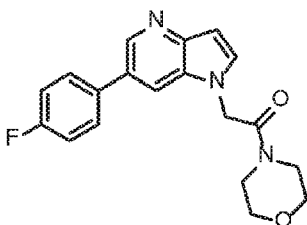
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 - 8,48 (m, 1H), 8,02 - 8,00 (m, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,59 (td, $J = 7,8, 1,7$ Hz, 1H), 7,48 - 7,42 (m, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 2H), 6,62 (dd, $J = 3,2, 0,8$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,70 - 3,65 (m, 2H), 3,60 - 3,55 (m, 4H), 3,43 (t, $J = 5,0$ Hz, 2H).

Exemplul 87: 2-[6-(3-Fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



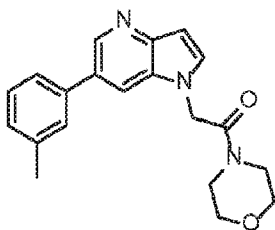
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,65 - 7,58 (m, 3H), 7,57 - 7,50 (m, 1H), 7,24 - 7,17 (m, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,75 - 3,68 (m, 2H), 3,62 - 3,56 (m, 4H), 3,47 - 3,41 (m, 2H).

Exemplul 88: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



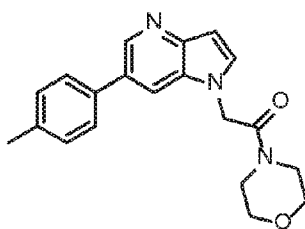
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{18}\text{FN}_3\text{O}_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 - 8,60 (m, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,60 - 7,57 (m, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,61 - 6,58 (m, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,72 - 3,68 (m, 2H), 3,61 - 3,55 (m, 4H), 3,47 - 3,41 (m, 2H).

Exemplul 89: 1-Morfolino-2-[6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



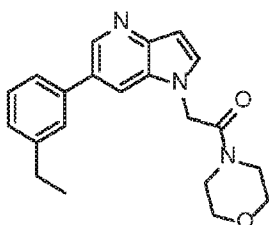
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O_2$, 335,2; m/z găsit, 336,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (s, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,58 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,52 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,38 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,19 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,59 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,73 - 3,67 (m, 2H), 3,62 - 3,56 (m, 4H), 3,47 - 3,42 (m, 2H), 2,40 (s, 3H).

Exemplul 90: 1-Morfolino-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



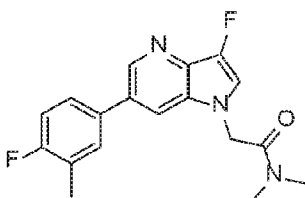
- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O_2$, 335,2; m/z găsit, 336,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 - 8,60 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 2H), 7,58 - 7,55 (m, 1H), 7,33 - 7,28 (m, 2H), 6,58 (d, $J = 3,1$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,72 - 3,66 (m, 2H), 3,62 - 3,55 (m, 4H), 3,46 - 3,41 (m, 2H), 2,36 (s, 3H).

- 15 **Exemplul 91: 2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.**

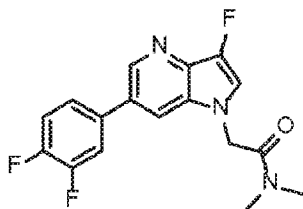


- 20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 85. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{23}N_3O_2$, 349,2; m/z găsit, 350,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 - 8,59 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,60 - 7,51 (m, 3H), 7,41 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,72 - 3,67 (m, 2H), 3,62 - 3,56 (m, 4H), 3,46 - 3,42 (m, 2H), 2,74 - 2,66 (m, 2H), 1,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

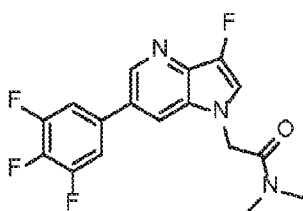
Exemplul 92: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



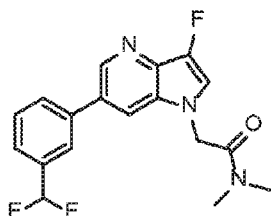
- 25 La o soluție de 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15, 68 mg, 0,22 mmol) în dioxan (1mL) s-a adăugat acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic (419 mg, 0,27 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (16,6 mg, 0,203 mmol), Cs₂CO₃ (221 mg, 0,68 mmol). După 16 ore la 90 °C amestecul de reacție a fost răcit și concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, MeOH 0-20% în EtOAc) a dat compusul din titlu (37 mg, 50%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,17 - 8,12 (m, 1H), 7,68 (dd, $J = 7,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,27 (dd, $J = 9,6, 8,5$ Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).
- 30
- 35

Exemplul 93: 2-[6-(3,4-Difluorofenil-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă.

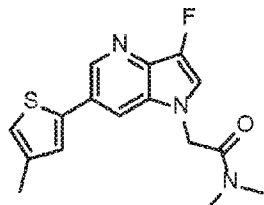
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92 utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}F_3N_3O$, 333,1; m/z găsit, 334,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 - 8,70 (m, 1H), 8,27 - 8,22 (m, 1H), 7,88 (ddd, J = 12,3, 7,8, 2,3 Hz, 1H), 7,68 - 7,52 (m, 3H), 5,20 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 94: 2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

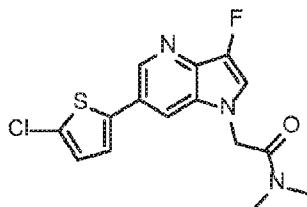
15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92 utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și acid (2,3,4-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}F_4N_3O$, 351,1; m/z găsit, 352,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,30 (t, J = 2,2 Hz, 1H), 7,85 - 7,79 (m, 2H), 7,67 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 95: 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

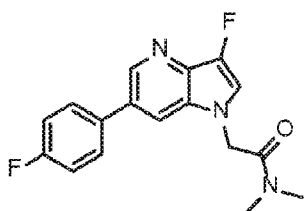
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92 utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și acid (3-(difluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,27 - 8,23 (m, 1H), 7,94 (s, 2H), 7,71 - 7,58 (m, 3H), 7,12 (t, J = 55,8 Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 96: 2-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{16}FN_3OS$, 317,1; m/z găsit, 318,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,13 - 8,09 (m, 1H), 7,59 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,42 (d, J = 1,4 Hz, 1H), 7,18 - 7,14 (m, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,26 (s, 3H).

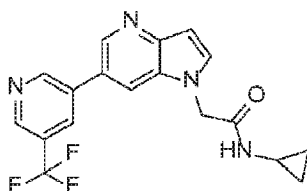
Exemplul 97: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și acid (5-clorotiofen-2-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{13}ClFN_3OS$, 337,0; m/z găsit, 338,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,47 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 4,0$ Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 98: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

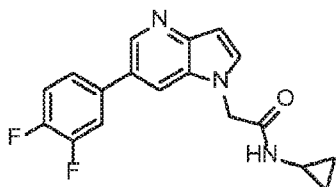
- 15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Intermediar 15) și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 - 8,65 (m, 1H), 8,20 - 8,16 (m, 1H), 7,83 - 7,76 (m, 2H), 7,64 - 7,60 (m, 1H), 7,40 - 7,30 (m, 2H), 5,21 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

- 20 **Exemplul 99: N-Ciclopropil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.**

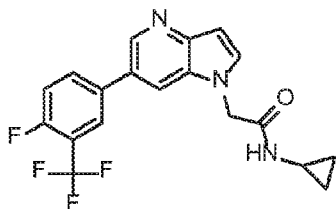


- 25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,16 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,24 - 8,22 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,70 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 2,73 - 2,66 (m, 1H), 0,76 - 0,69 (m, 2H), 0,56 - 0,50 (m, 2H).

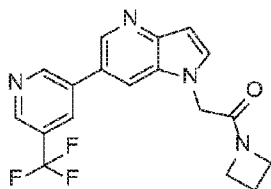
- 30 **Exemplul 100: N-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.**



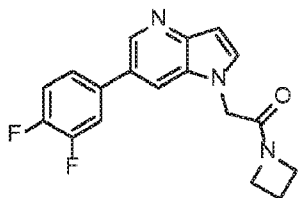
- 35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,03 - 8,01 (m, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,50 - 7,45 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 1H), 6,67 - 6,65 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 2,72 - 2,66 (m, 1H), 0,75 - 0,69 (m, 2H), 0,54 - 0,49 (m, 2H).

Exemplul 101: N-Ciclopropil-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

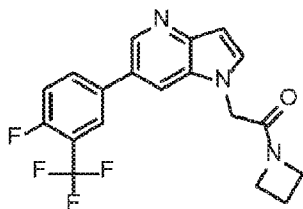
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,07 (s, 1H), 8,00 - 7,94 (m, 2H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,45 (t, $J = 9,6$ Hz, 1H), 6,67 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 4,92 (s, 2H), 2,73 - 2,66 (m, 1H), 0,77 - 0,69 (m, 2H), 0,55 - 0,49 (m, 2H).

Exemplul 102: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

- 15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,16 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,67 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,69 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,30 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 3,33 - 3,29 (m, 2H).

Exemplul 103: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

- 25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 - 8,03 (m, 1H), 7,66 - 7,59 (m, 1H), 7,56 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,51 - 7,46 (m, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,05 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,40 - 2,31 (m, 2H).

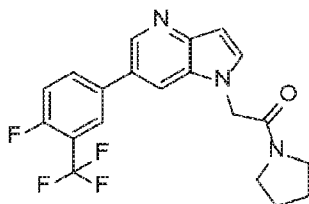
Exemplul 104: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

- 35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid 4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 - 8,07 (m, 1H), 7,98

- 7,90 (m, 2H), 7,56 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,45 - 7,39 (m, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,05 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,40 - 2,30 (m, 2H).

Exemplul 105: 2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.

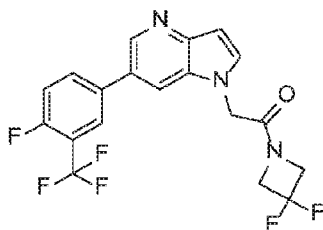
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 10) și acid (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (35 mg, 27%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{17}F_4N_3O$, 391,1; m/z găsit, 392,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,13 - 8,11 (m, 1H), 8,01 - 7,94 (m, 2H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,48 - 7,40 (m, 1H), 6,68 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,65 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,46 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,12 - 2,02 (m, 2H), 1,97 - 1,87 (m, 2H).

15

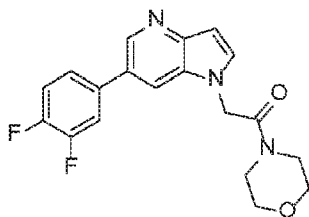
Exemplul 106: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 12) și acid (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}F_6N_3O$, 413,1; m/z găsit, 414,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,62 - 8,59 (m, 1H), 8,16 - 8,13 (m, 1H), 8,03 - 7,96 (m, 2H), 7,61 - 7,58 (m, 1H), 7,50 - 7,42 (m, 1H), 6,71 - 6,68 (m, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,67 (t, $J = 12,0$ Hz, 2H), 4,41 (t, $J = 12,2$ Hz, 2H).

25

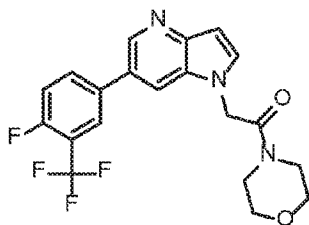
Exemplul 107: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (21 mg, 38%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O_2$, 357,1; m/z găsit, 358,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,07 - 8,05 (m, 1H), 7,63 (ddd, $J = 12,0, 7,6, 2,3$ Hz, 1H), 7,55 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,52 - 7,47 (m, 1H), 7,41 - 7,32 (m, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,80 - 3,74 (m, 2H), 3,72 - 3,63 (m, 4H), 3,61 - 3,55 (m, 2H).

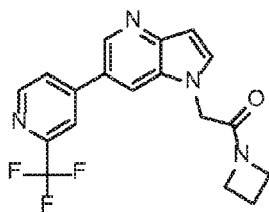
35

Exemplul 108: 2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



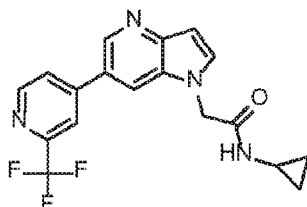
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11) și acid (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{17}F_4N_3O_2$, 407,1; m/z găsit, 408,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,58 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,13 - 8,10 (m, 1H), 8,01 - 7,95 (m, 2H), 7,57 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,49 - 7,41 (m, 1H), 6,69 (dd, J = 3,3, 0,8 Hz, 1H), 5,31 (s, 2H), 3,81 - 3,75 (m, 2H), 3,72 - 3,64 (m, 4H), 3,61 - 3,55 (m, 2H).

Exemplul 109: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



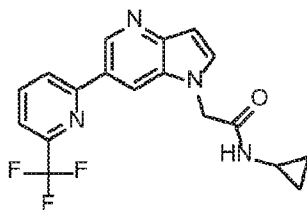
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (2-(trifluorometil)piridin-4-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,79 - 8,73 (m, 2H), 8,35 - 8,32 (m, 1H), 8,21 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,03 (dd, J = 5,2, 1,7 Hz, 1H), 7,66 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,71 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,32 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 4,07 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,44 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 110: N-Ciclorpropil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclorpropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (2-(trifluorometil)piridin-4-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,80 - 8,74 (m, 2H), 8,33 - 8,30 (m, 1H), 8,21 - 8,19 (m, 1H), 8,03 (dd, J = 5,1, 1,7 Hz, 1H), 7,67 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,72 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 4,97 (s, 2H), 2,74 - 2,67 (m, 1H), 0,77 - 0,70 (m, 2H), 0,56 - 0,50 (m, 2H).

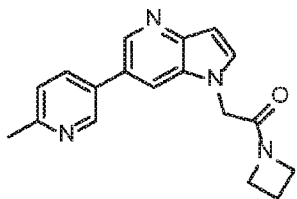
Exemplul 111: N-Ciclorpropil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclorpropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CD₃OD) δ 9,06 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,53 - 8,50 (m, 1H), 8,21 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 8,07 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 7,74 - 7,69 (m, 1H),

7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,68 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 2,74 - 2,67 (m, 1H), 0,76 - 0,70 (m, 2H), 0,58 - 0,53 (m, 2H).

Exemplul 112: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-metil-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

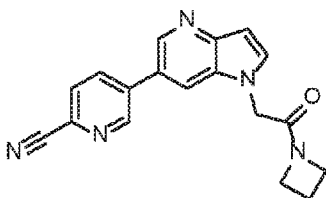


5

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (6-metilpiridin-3-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}N_4O$, 306,1; m/z găsit, 307,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,75 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,60 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,14 - 8,12 (m, 1H), 8,08 (dd, $J = 8,1, 2,5$ Hz, 1H), 7,59 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 7,43 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,60 (s, 3H), 2,42 - 2,32 (m, 2H).

10

Exemplul 113: 5-[1-[2-(Azetidin-1-il)-2-oxo-etil]pirolo[3,2-b]piridin-6-il]piridin-2-carbonitril.

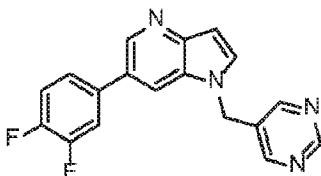


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și 5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)picolinonitril. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}N_5O$, 317,1; m/z găsit, 318,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 9,10 - 9,07 (m, 1H), 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,36 - 8,30 (m, 1H), 8,26 - 8,21 (m, 1H), 7,99 - 7,93 (m, 1H), 7,67 - 7,63 (m, 1H), 6,72 - 6,69 (m, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,31 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,9$ Hz, 2H), 2,44 - 2,32 (m, 2H).

20

Exemplul 114: 6-(3,4-Difluorofenil)-1-(pirimidin-5-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.

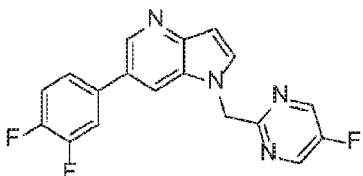


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 115 înlocuind metansulfonatul de (5-fluoropirimidin-2-il)metil cu metansulfonat de pirimidin-5-ilmetil (Intermediar 3). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}F_2N_4$, 322,1; m/z găsit, 323,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,07 (s, 1H), 8,66 (s, 2H), 8,61 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,20 - 8,18 (m, 1H), 7,77 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 1H), 7,50 - 7,46 (m, 1H), 7,39 - 7,33 (m, 1H), 6,74 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,62 (s, 2H).

30

Exemplul 115: 6-(3,4-Difluorofenil)-1-[(5-fluoropirimidin-2-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină.



35

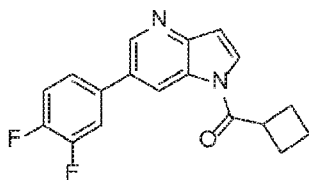
Etapa A: 6-(3,4-Difluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106, Etapa B, înlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{13}H_8F_2N_2$, 230,1; m/z găsit, 231,1 $[M+H]^+$.

Etapa B: 6-(3,4-Difluorofenil)-1-[(5-fluoropirimidin-2-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106 Etapa A înlocuind 2-bromo-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanona cu metansulfonat de (5-fluoropirimidin-2-il)metil (Intermediar 3).

40

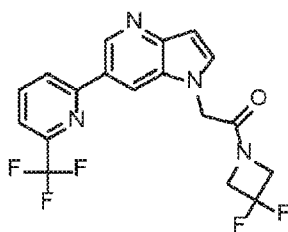
MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{11}F_3N_4$, 340,1; m/z găsit, 341,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,66 (d, $J = 0,8$ Hz, 2H), 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,13 - 8,11 (m, 1H), 7,72 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,62 - 7,56 (m, 1H), 7,49 - 7,43 (m, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,70 (s, 2H).

5 **Exemplul 116: Ciclobutil-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metanonă.**



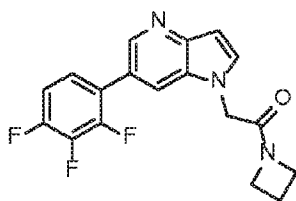
La o soluție de 6-(3,4-difluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină (50 mg, 0,22 mmol) în DMF (1 mL) s-a adăugat acid ciclobutancarboxilic (25 μ L, 0,26 mmol), DIPEA (0,11 mL, 0,65 mmol) și HATU (91 mg, 0,24 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la temperatura camerei timp de 1 oră și s-a adăugat apă. Faza apoasă a fost extrasă de 3 ori cu DCM și straturile organice combinate au fost uscate ($MgSO_4$), filtrate și evaporate. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (28 mg, 41%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_2N_2O$, 312,1; m/z găsit, 313,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,93 - 8,90 (m, 1H), 8,68 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,97 (d, $J = 3,8$ Hz, 1H), 7,65 - 7,59 (m, 1H), 7,51 - 7,46 (m, 1H), 7,43 - 7,36 (m, 1H), 6,79 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 4,10 - 4,01 (m, 1H), 2,57 - 2,39 (m, 4H), 2,24 - 2,12 (m, 1H), 2,04 - 1,94 (m, 1H).

15 **Exemplul 117: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil-2-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



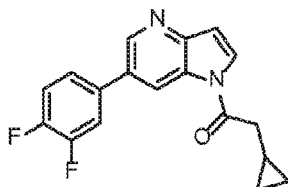
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106 înlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-6-(trifluorometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_5N_4O$, 396,1; m/z găsit, 397,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,10 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,58 - 8,56 (m, 1H), 8,23 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 8,12 - 8,07 (m, 1H), 7,73 (dd, $J = 7,7, 0,8$ Hz, 1H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,72 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,17 (s, 2H), 4,69 (t, $J = 11,9$ Hz, 2H), 4,42 (t, $J = 12,1$ Hz, 2H).

25 **Exemplul 118: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,49 - 8,46 (m, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,62 (dd, $J = 3,4, 1,0$ Hz, 1H), 7,42 - 7,35 (m, 1H), 7,29 - 7,21 (m, 1H), 6,71 - 6,68 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,27 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,41 - 2,31 (m, 2H).

35 **Exemplul 119: 2-Ciclopropil-1-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**

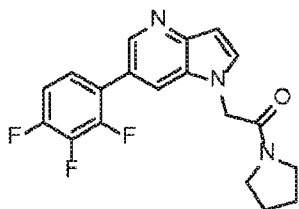


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 116. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_2N_2O$, 312,1; m/z găsit, 313,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,88

(d, $J = 2,5$ Hz, 1H), 8,67 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,09 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,64 - 7,55 (m, 1H), 7,50 - 7,43 (m, 1H), 7,42 - 7,30 (m, 1H), 6,79 (dd, $J = 3,8$, 0,7 Hz, 1H), 2,97 (d, $J = 6,8$ Hz, 2H), 1,28 - 1,17 (m, 1H), 0,68 - 0,61 (m, 2H), 0,35 - 0,29 (m, 2H).

Exemplul 120: 1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

5

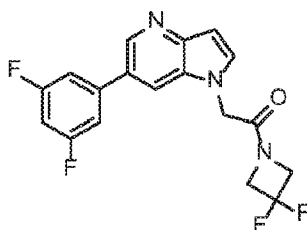


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 10) și acid (2,3,4-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,47 - 8,43 (m, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,40 - 7,31 (m, 1H), 7,26 - 7,18 (m, 1H), 6,68 (dd, $J = 3,3$, 1,0 Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 3,62 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,44 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 2,09 - 2,00 (m, 2H), 1,95 - 1,85 (m, 2H).

10

Exemplul 121: 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

15

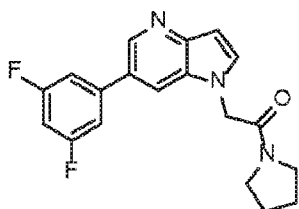


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 12) și acid (3,5-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,60 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 - 8,12 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 2H), 6,98 - 6,91 (m, 1H), 6,68 (dd, $J = 3,4$, 0,9 Hz, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,66 (t, $J = 12,0$ Hz, 2H), 4,41 (t, $J = 12,2$ Hz, 2H).

20

Exemplul 122: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.

25

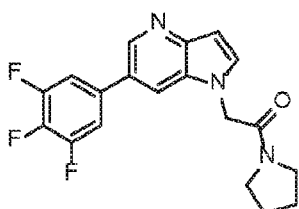


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 10) și acid (3,5-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,12 - 8,10 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 2H), 6,96 - 6,91 (m, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,64 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,46 (t, $J = 7,0$ Hz, 2H), 2,10 - 2,02 (m, 2H), 1,95 - 1,87 (m, 2H).

30

Exemplul 123: 1-Pirolidin-1-il-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

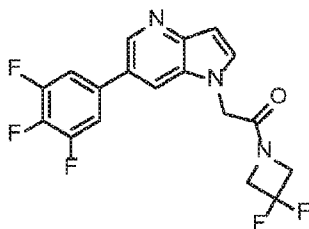
35



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 10) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,2

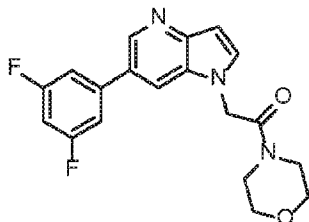
[M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,55 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,09 - 8,06 (m, 1H), 7,57 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,53 - 7,44 (m, 2H), 6,65 (dd, *J* = 3,4, 0,9 Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 3,64 (t, *J* = 6,8 Hz, 2H), 3,45 (t, *J* = 6,9 Hz, 2H), 2,11 - 2,02 (m, 2H), 1,96 - 1,87 (m, 2H).

Exemplul 124: 1-(3,3-Difluoroazetidină-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



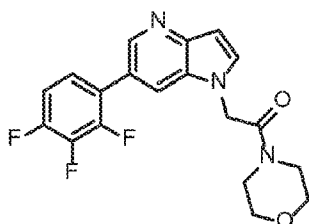
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidină-1-il)etanonă (Intermediar 12) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₂F₅N₃O, 381,1; m/z găsit, 382,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,60 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,15 - 8,13 (m, 1H), 7,60 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,58 - 7,49 (m, 2H), 6,69 (dd, *J* = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 4,68 (t, *J* = 11,9 Hz, 2H), 4,41 (t, *J* = 12,2 Hz, 2H).

Exemplul 125: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



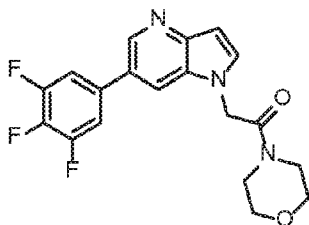
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11) și acid (3,5-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇F₂N₃O₂, 357,1; m/z găsit, 358,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,54 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,06 - 8,02 (m, 1H), 7,53 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,31 - 7,23 (m, 2H), 6,96 - 6,88 (m, 1H), 6,65 (d, *J* = 3,2 Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,77 - 3,73 (m, 2H), 3,69 - 3,64 (m, 2H), 3,63 - 3,53 (m, 4H).

Exemplul 126: 1-Morfolino-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



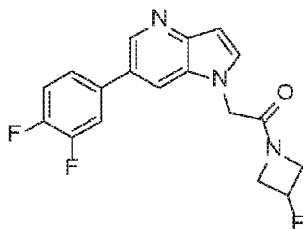
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11) și acid (2,3,4-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₆F₃N₃O₂, 375,1; m/z găsit, 376,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,47 (t, *J* = 1,8 Hz, 1H), 8,04 - 7,99 (m, 1H), 7,60 (d, *J* = 3,4 Hz, 1H), 7,43 - 7,35 (m, 1H), 7,30 - 7,20 (m, 1H), 6,70 (dd, *J* = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,79 - 3,73 (m, 2H), 3,72 - 3,62 (m, 4H), 3,61 - 3,55 (m, 2H).

Exemplul 127: 1-Morfolino-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



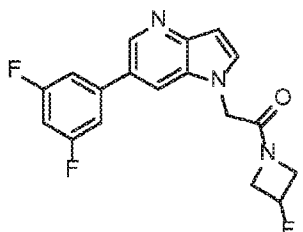
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 11) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O_2$, 375,1; m/z găsit, 376,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 - 8,04 (m, 1H), 7,55 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,52 - 7,41 (m, 2H), 6,66 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,80 - 3,74 (m, 2H), 3,71 - 3,66 (m, 2H), 3,66 - 3,60 (m, 2H), 3,60 - 3,53 (m, 2H).

Exemplul 128: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



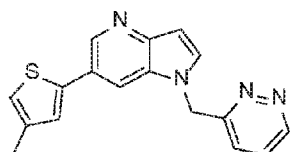
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 - 8,06 (m, 1H), 7,67 - 7,60 (m, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,52 - 7,48 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,47 - 5,30 (m, 1H), 5,05 (d, $J = 3,4$ Hz, 2H), 4,58 - 4,48 (m, 1H), 4,40 - 4,27 (m, 2H), 4,16 - 4,03 (m, 1H).

Exemplul 129: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (3,5-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,13 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 2H), 7,00 - 6,92 (m, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,48 - 5,31 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,2$ Hz, 2H), 4,60 - 4,50 (m, 1H), 4,40 - 4,30 (m, 2H), 4,15 - 4,05 (m, 1H).

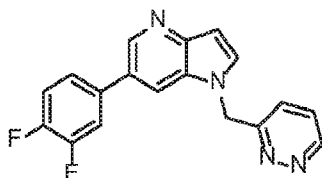
Exemplul 130: 6-(4-Metil-2-tienil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



Etapa A: 6-(4-Metiltiofen-2-il)-1H-pirololo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 115, Etapa A înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{12}H_{10}N_2S$, 214,1; m/z găsit, 215,1 $[M+H]^+$.

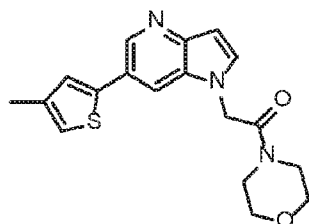
Etapa B: 6-(4-Metil-2-tienil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 115, Etapa B, utilizând 6-(4-metiltiofen-2-il)-1H-pirololo[3,2-b]piridină și clorhidrat de 3-(clorometil)piridazină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}N_4S$, 306,1; m/z găsit, 307,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,10 (dd, $J = 5,0, 1,6$ Hz, 1H), 8,58 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,74 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,65 (dd, $J = 8,6, 4,9$ Hz, 1H), 7,45 (dd, $J = 8,5, 1,6$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,4, 1,0$ Hz, 1H), 5,80 (s, 2H), 2,27 (s, 3H).

Exemplul 131: 6-(3,4-Difluorofenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



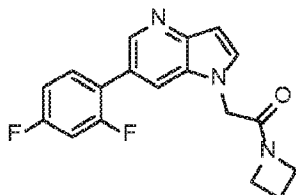
- 5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 115 inlocuind metansulfonatul de (5-fluoropirimidin-2-il)metil (Intermediar 2) cu clorhidrat de 3-(clorometil)piridazină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}F_2N_4$, 322,1; m/z găsit, 323,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,10 (dd, $J = 4,9, 1,6$ Hz, 1H), 8,58 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,17 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,79 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,65 (dd, $J = 8,5, 5,0$ Hz, 1H), 7,63 - 7,57 (m, 1H), 7,51 - 7,43 (m, 2H), 7,38 - 7,31 (m, 1H), 6,72 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,83 (s, 2H).

Exemplul 132: 2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



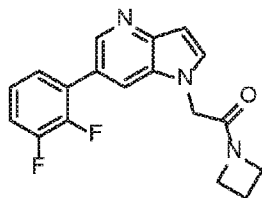
- 10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 85 inlocuind acidul fenilboronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3O_2S$, 341,1; m/z găsit, 342,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,00 - 7,97 (m, 1H), 7,49 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,26 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 6,98 - 6,96 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,22 (s, 2H), 3,78 - 3,73 (m, 2H), 3,70 - 3,66 (m, 2H), 3,65 - 3,61 (m, 2H), 3,59 - 3,55 (m, 2H), 2,29 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H).

Exemplul 133: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



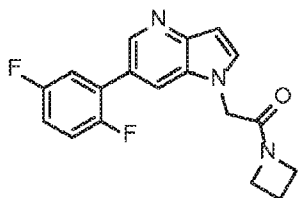
- 20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizand 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (2,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,46 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,63 - 7,55 (m, 2H), 7,14 - 7,07 (m, 2H), 6,68 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,05 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,39 - 2,30 (m, 2H).

Exemplul 134: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



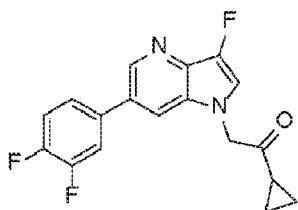
- 30 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizand 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (2,3-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,52 - 8,49 (m, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,40 - 7,35 (m, 1H), 7,34 - 7,25 (m, 2H), 6,70 (dd, $J = 3,4, 1,0$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,40 - 2,31 (m, 2H).

35 **Exemplul 135: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă (Intermediar 14) și acid (2,5-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CD₃OD) δ 8,53 - 8,51 (m, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,61 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 1H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 7,18 - 7,12 (m, 1H), 6,69 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,26 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 4,06 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,40 - 2,32 (m, 2H).

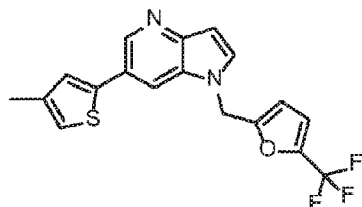
Exemplul 136: 1-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Etapă A: 2-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropiletanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 15, utilizând 2-bromo-1-ciclopropiletanonă și 6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridină (Intermediar 6). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{12}H_{10}BrFN_2O$, 296,0; m/z găsit, 297,0 [M+H]⁺.

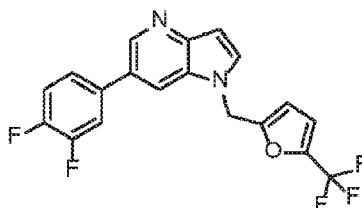
Etapă B: 1-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropiletanonă și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_3N_2O$, 330,1; m/z găsit, 331,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,72 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,28 - 8,24 (m, 1H), 7,88 (ddd, J = 12,3, 7,7, 2,2 Hz, 1H), 7,69 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 7,67 - 7,52 (m, 2H), 5,42 (s, 2H), 2,16 - 2,07 (m, 1H), 1,05 - 0,91 (m, 4H).

Exemplul 137: 6-(4-Metil-2-tienil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirol[3,2-b]piridină.

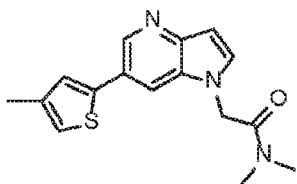


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 130. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_3N_2OS$, 362,1; m/z găsit, 363,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,60 (s, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,65 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,29 (s, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,93 - 6,90 (m, 1H), 6,65 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 6,52 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 5,55 (s, 2H), 2,30 (s, 3H).

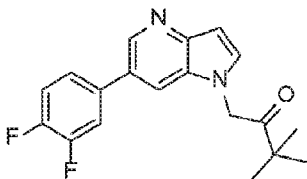
Exemplul 138: 6-(3,4-Difluorofenil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirol[3,2-b]piridină.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 115 înlocuind metansulfonatul de (5-fluoropirimidin-2-il)metil (Intermediar 2) cu 2-(bromometil)-5-(trifluorometil)furan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{11}F_5N_2O$, 378,1; m/z găsit, 379,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,58 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,23 - 8,20 (m, 1H), 7,69 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 7,66 - 7,59 (m, 1H), 7,52 - 7,46 (m, 1H), 7,41 - 7,33 (m, 1H), 6,92 - 6,89 (m, 1H), 6,68 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 6,53 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 5,57 (s, 2H).

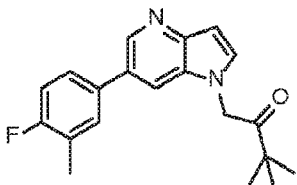
Exemplul 139: N,N-Dimetil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (Exemplul 375, Intermediar din etapa A) și 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{17}N_3OS$, 299,1; m/z găsit, 300,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,97 - 7,94 (m, 1H), 7,47 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 6,96 (s, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 2,28 (s, 3H).

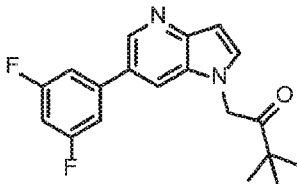
Exemplul 140: 1-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă.

Etapa A: 1-(6-Bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-3,3-dimetilbutan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 1-bromo-3,3-dimetilbutan-2-onă și 6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{13}H_{15}BrN_2O$, 294,0; m/z găsit, 295,0 $[M+H]^+$.

Etapa B: 1-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-3,3-dimetilbutan-2-onă și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_2N_2O$, 328,1; m/z găsit, 329,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 1H), 7,50 - 7,43 (m, 2H), 7,39 - 7,32 (m, 1H), 6,66 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,44 (s, 2H), 1,32 (s, 9H).

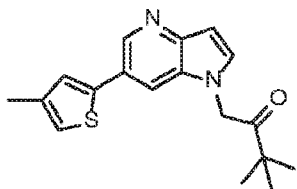
Exemplul 141: 1-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă.

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 140. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}FN_2O$, 324,2; m/z găsit, 325,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,51 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,52 - 7,49 (m, 1H), 7,47 - 7,42 (m, 2H), 7,14 - 7,09 (m, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,31 (s, 9H).

Exemplul 142: 1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă.

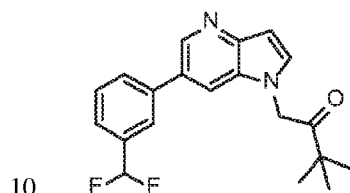
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 140. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_2N_2O$, 328,1; m/z găsit, 329,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,96 - 7,94 (m, 1H), 7,50 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,34 - 7,28 (m, 2H), 6,98 - 6,91 (m, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,45 (s, 2H), 1,32 (s, 9H).

Exemplul 143: 3,3-Dimetil-1-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



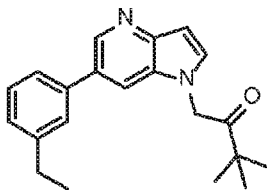
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 140 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{20}N_2OS$, 312,1; m/z găsit, 313,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,82 - 7,79 (m, 1H), 7,43 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,24 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 6,98 - 6,95 (m, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 2,28 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H), 1,32 (s, 9H).

Exemplul 144: 1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă.



- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 140. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}F_2N_2O$, 342,2; m/z găsit, 343,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (s, 1H), 7,92 (s, 1H), 7,83 - 7,77 (m, 2H), 7,62 - 7,53 (m, 2H), 7,48 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,84 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 1,31 (s, 9H).

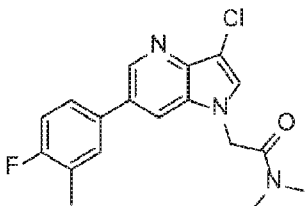
- Exemplul 145: 1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă.**



- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 140. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{24}N_2O$, 320,2; m/z găsit, 321,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,84 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,49 - 7,41 (m, 3H), 7,37 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,21 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,42 (s, 2H), 2,72 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,31 (s, 9H), 1,28 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 146: 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

25

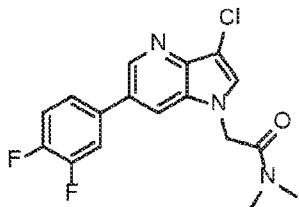


- Etapa A: 2-(6-Bromo-3-cloro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. La o soluție de 6-bromo-3-cloro-1H-pirolo[3,2-b]piridină (Intermediar 5, 500 mg, 2,16 mmol) în DMF (60 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (121 mg, 3,02 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute la rt, apoi răcit la 0 °C și s-a adăugat 2-bromo-N,N-dimetilacetamidă (430 mg, 2,59 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. Amestecul de reacție a fost concentrat pe silicagel. Purificarea (FCC, SiO_2 , 0-30% MeOH în DCM) a dat compusul din titlu (282 mg, 41%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{11}H_{11}BrClN_3O$, 315,0; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$.

- Etapa B: 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă. La o soluție 2-(6-bromo-3-cloro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă (100 mg, 0,31 mmol) în dioxan (2,9 mL) s-a adăugat acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic (73 mg, 0,47 mmol), $Pd(dppf)Cl_2$ (16 mg, 0,02 mmol), Cs_2CO_3 (205 mg, 0,63 mmol) și apă (0,6 mL). După 3 ore la 90 °C amestecul de reacție s-a răcit și s-a adăugat $NaHCO_3$ (aq). Amestecul de reacție a fost extras cu

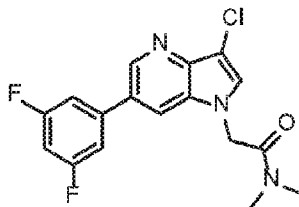
EtOAc (3 x 60 mL). Organicele combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate, și concentrate sub presiune redusă. Purificarea (HPLC bazică ACN 5-95%) a dat compusul din titlu (36 mg, 33%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₇ClFN₃O, 345,1; m/z găsit, 346,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,69 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,62 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,41 - 7,33 (m, 2H), 7,31 (s, 1H), 7,09 (t, *J* = 8,9 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 3,00 (s, 3H), 2,35 (d, *J* = 2,0 Hz, 3H).

Exemplul 147: 2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



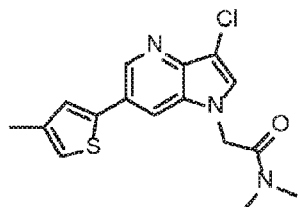
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₇H₁₄ClF₂N₃O, 349,1; m/z găsit, 350,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,71 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,64 (d, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,43 - 7,38 (m, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,35 - 7,30 (m, 1H), 7,29 - 7,23 (m, 1H), 4,93 (s, 2H), 3,15 (s, 3H), 3,02 (s, 3H).

Exemplul 148: 2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



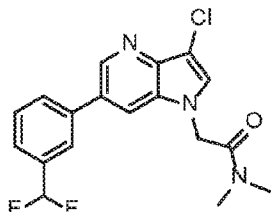
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₇H₁₄ClF₂N₃O, 349,1; m/z găsit, 350,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,73 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,67 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,17 - 7,11 (m, 2H), 6,86 - 6,79 (m, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,15 (s, 3H), 3,03 (s, 3H).

Exemplul 149: 2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146 înlocuind acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₆H₁₆ClN₃OS, 333,1; m/z găsit, 334,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,78 (d, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,63 (d, *J* = 1,8 Hz, 1H), 7,30 (s, 1H), 7,15 (d, *J* = 1,4 Hz, 1H), 6,90 (s, 1H), 4,88 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,30 (d, *J* = 1,1 Hz, 3H).

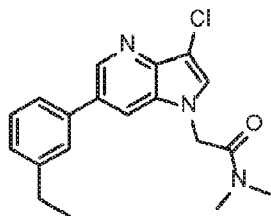
Exemplul 150: 2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₆ClF₂N₃O, 363,1; m/z găsit, 364,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,76

(d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,76 - 7,67 (m, 3H), 7,60 - 7,49 (m, 2H), 7,35 (s, 1H), 6,73 (t, $J = 56,4$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 3,14 (s, 3H), 3,01 (s, 3H).

Exemplul 151: 2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

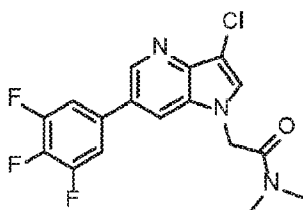


5

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}ClN_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,63 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,61 - 7,47 (m, 3H), 7,40 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,74 (q, $J = 7,5$ Hz, 2H), 1,30 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

10

Exemplul 152: 2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

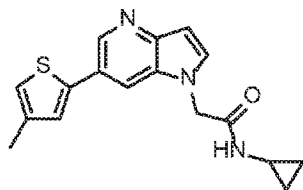


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}ClF_3N_3O$, 367,1; m/z găsit, 368,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,63 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,38 (s, 1H), 7,25 - 7,20 (m, 2H), 4,94 (s, 2H), 3,16 (s, 3H), 3,03 (s, 3H).

Exemplul 153: N-Ciclopropil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă sare trifluoroacetat de.

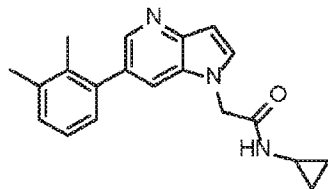
20



25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}N_3OS$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,88 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,41 (d, $J = 4,3$ Hz, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,27 (s, 1H), 6,79 - 6,75 (m, 1H), 5,04 (s, 2H), 2,69 - 2,62 (m, 1H), 2,29 (t, $J = 1,3$ Hz, 3H), 0,68 - 0,62 (m, 2H), 0,49 - 0,44 (m, 2H).

Exemplul 154: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

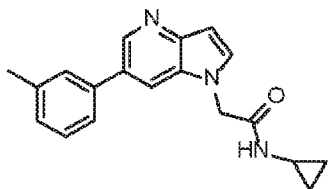


30

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,67 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,56 (s, 1H), 8,38 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,14 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,33 - 7,29 (m, 1H), 7,25 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,21 - 7,18 (m, 1H), 6,86 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,06 (s, 2H), 2,66 - 2,59 (m, 1H), 2,35 (s, 3H), 2,16 (s, 3H), 0,66 - 0,60 (m, 2H), 0,45 - 0,40 (m, 2H).

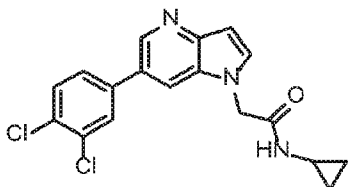
35

Exemplul 155: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



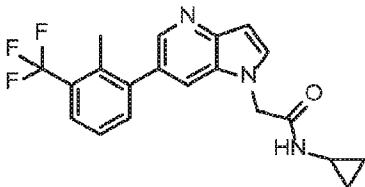
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,00 (s, 1H), 8,92 (s, 1H), 8,43 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,16 - 8,12 (m, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,66 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,49 - 7,44 (m, 1H), 7,31 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,87 - 6,83 (m, 1H), 5,13 (s, 2H), 2,69 - 2,62 (m, 1H), 2,43 (d, $J = 1,7$ Hz, 3H), 0,68 - 0,61 (m, 2H), 0,49 - 0,43 (m, 2H).

Exemplul 156: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



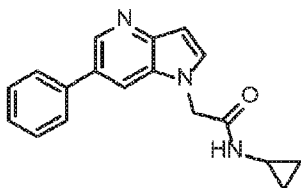
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,99 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,40 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,17 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,89 - 7,82 (m, 2H), 6,81 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,06 (s, 2H), 2,69 - 2,62 (m, 1H), 0,67 - 0,62 (m, 2H), 0,48 - 0,44 (m, 2H).

Exemplul 157: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)penil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



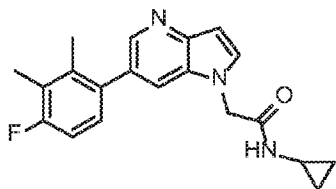
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 - 8,64 (m, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,37 - 8,33 (m, 1H), 8,08 - 8,04 (m, 1H), 7,85 - 7,81 (m, 1H), 7,66 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,56 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 6,84 - 6,81 (m, 1H), 5,01 (s, 2H), 2,66 - 2,59 (m, 1H), 2,34 (s, 3H), 0,65 - 0,59 (m, 2H), 0,45 - 0,39 (m, 2H).

Exemplul 158: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă.



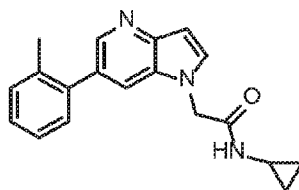
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}N_3O$, 291,1; m/z găsit, 292,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,03 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,42 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,16 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,90 - 7,85 (m, 2H), 7,62 - 7,57 (m, 2H), 7,53 - 7,48 (m, 1H), 6,87 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 2,68 - 2,62 (m, 1H), 0,67 - 0,61 (m, 2H), 0,48 - 0,43 (m, 2H).

Exemplul 159: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



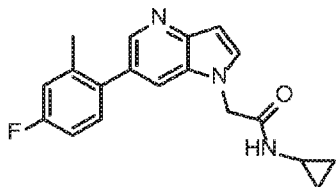
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,37 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,11 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,27 - 7,15 (m, 2H), 6,84 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,04 (s, 2H), 2,65 - 2,59 (m, 1H), 2,25 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H), 2,19 (s, 3H), 0,66 - 0,60 (m, 2H), 0,45 - 0,40 (m, 2H).

Exemplul 160: N-Ciclopropil-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



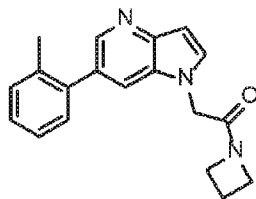
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,35 - 8,27 (m, 2H), 7,78 (s, 1H), 7,67 - 7,58 (m, 1H), 7,39 - 7,24 (m, 4H), 6,60 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 4,82 (s, 2H), 2,66 - 2,60 (m, 1H), 2,27 (s, 3H), 0,66 - 0,58 (m, 2H), 0,45 - 0,37 (m, 2H).

Exemplul 161: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



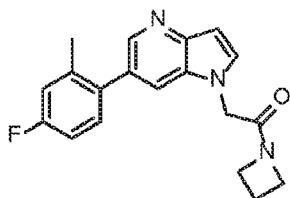
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,38 (d, $J = 4,4$ Hz, 1H), 8,16 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,42 (dd, $J = 8,4, 5,9$ Hz, 1H), 7,30 (dd, $J = 10,2, 3,0$ Hz, 1H), 7,27 - 7,18 (m, 1H), 6,87 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,07 (s, 2H), 2,67 - 2,61 (m, 1H), 2,30 (d, $J = 2,2$ Hz, 3H), 0,69 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,39 (m, 2H).

Exemplul 162: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



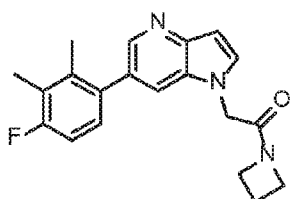
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71 utilizând 1-(azetidin-1-il)-2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă și acid o-tolilboronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (s, 1H), 8,66 (s, 1H), 8,11 - 8,07 (m, 1H), 7,43 - 7,34 (m, 4H), 6,88 - 6,84 (m, 1H), 5,18 (s, 2H), 4,30 - 4,22 (m, 2H), 3,94 - 3,86 (m, 2H), 2,32 - 2,24 (m, 5H).

Exemplul 163: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



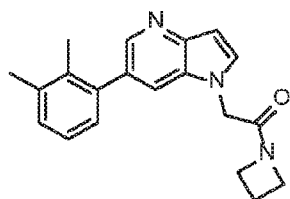
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,06 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,41 (dd, $J = 8,5, 6,0$ Hz, 1H), 7,29 (dd, $J = 10,1, 2,8$ Hz, 1H), 7,21 (td, $J = 8,5, 2,9$ Hz, 1H), 6,85 (dd, $J = 3,3, 0,7$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,24 (m, 5H).

Exemplul 164: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



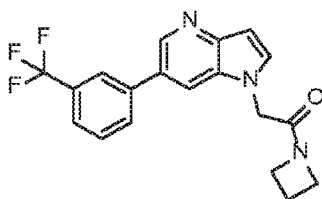
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,57 (s, 1H), 8,42 (s, 1H), 7,99 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,25 - 7,13 (m, 2H), 6,81 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,31 - 2,22 (m, 5H), 2,17 (s, 3H).

Exemplul 165: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



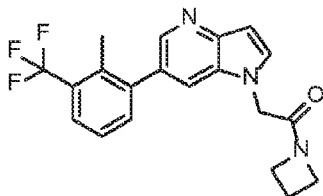
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,07 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,31 (dd, $J = 7,6, 1,5$ Hz, 1H), 7,25 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,19 (dd, $J = 7,7, 1,6$ Hz, 1H), 6,86 (d, $J = 3,1$ Hz, 1H), 5,17 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,33 - 2,24 (m, 2H), 2,15 (s, 3H).

Exemplul 166: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



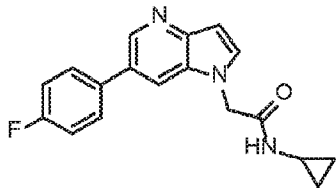
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,05 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 8,18 - 8,14 (m, 1H), 8,05 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,88 - 7,79 (m, 2H), 6,85 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,36 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 167: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



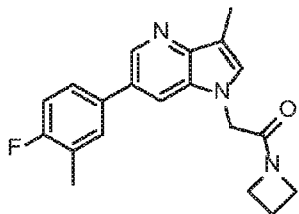
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,07 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,85 (dd, $J = 8,0, 1,3$ Hz, 1H), 7,67 (d, $J = 7,2$ Hz, 1H), 7,58 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 6,87 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,33 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 168: N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



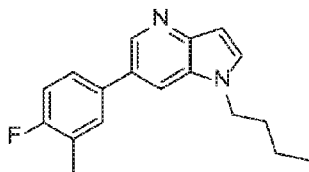
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,35 - 8,32 (m, 1H), 8,07 - 8,05 (m, 1H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,63 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 2H), 6,60 - 6,57 (m, 1H), 4,86 (s, 2H), 2,68 - 2,65 (m, 1H), 0,65 - 0,60 (m, 2H), 0,46 - 0,41 (m, 2H).

- Exemplul 169: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



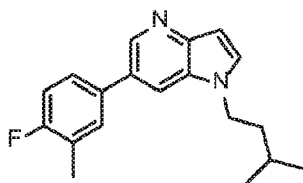
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO) δ 8,59 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,65 (d, $J = 7,2$ Hz, 1H), 7,61 - 7,51 (m, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,32 - 7,19 (m, 1H), 4,92 (s, 2H), 4,18 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,31 - 2,18 (m, 5H).

Exemplul 170: Sare trifluoroacetat de 1-butil-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină.



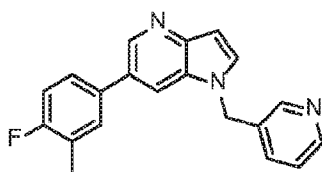
- La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină (60 mg, 0,26 mmol) în DMF (1,5 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (14,8 mg, 0,37 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost agitat timp de 30 minute, apoi răcit la 0 °C și s-a adăugat 1-bromobutan (0,22 mL, 0,278 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și s-a agitat timp de 12 ore. Masa de reacție a fost diluată cu metanol până la 3 mL, filtrat, și purificat prin HPLC Metoda C. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}FN_2$, 282,2; m/z găsit, 283,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,95 - 8,88 (m, 2H), 8,19 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,83 (dd, $J = 7,6, 2,5$ Hz, 1H), 7,77 - 7,71 (m, 1H), 7,35 (dd, $J = 9,6, 8,5$ Hz, 1H), 6,80 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,43 (t, $J = 7,1$ Hz, 2H), 2,36 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,86 - 1,75 (m, 2H), 1,33 - 1,20 (m, 2H), 0,89 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 171: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-izopentil-pirol[3,2-b]piridină.



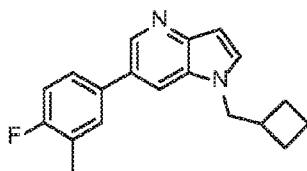
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 1-bromo-3-metilbutane și 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}FN_2$, 296,2; m/z găsit, 297,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,94 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,92 (s, 1H), 8,22 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,86 - 7,81 (m, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 1H), 7,36 (dd, J = 9,6, 8,6 Hz, 1H), 6,82 (dd, J = 3,3, 0,8 Hz, 1H), 4,50 - 4,41 (m, 2H), 2,36 (d, J = 1,9 Hz, 3H), 1,78 - 1,70 (m, 2H), 1,58 - 1,48 (m, 1H), 0,94 (d, J = 6,6 Hz, 6H).

Exemplul 172: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(3-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



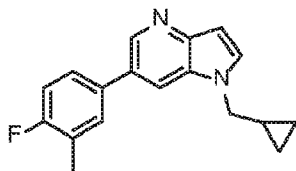
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 3-(bromometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{16}FN_3$, 317,1; m/z găsit, 318,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,03 (s, 1H), 8,99 - 8,96 (m, 1H), 8,72 - 8,69 (m, 1H), 8,58 - 8,53 (m, 1H), 8,32 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 7,86 - 7,79 (m, 2H), 7,75 - 7,69 (m, 1H), 7,49 - 7,45 (m, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 1H), 6,89 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 5,77 (s, 2H), 2,35 (s, 3H).

Exemplul 173: Sare trifluoroacetat de 1-(ciclobutilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină.



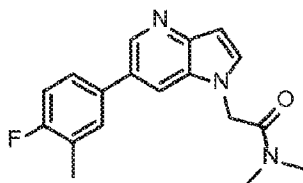
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și (bromometil)ciclobutan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}FN_2$, 294,2; m/z găsit, 295,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,98 (s, 1H), 8,95 (d, J = 1,6 Hz, 1H), 8,20 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,84 (dd, J = 7,3, 2,5 Hz, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 1H), 6,81 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 4,47 (d, J = 7,5 Hz, 2H), 2,91 - 2,81 (m, 1H), 2,36 (d, J = 1,9 Hz, 3H), 1,99 - 1,77 (m, 6H).

Exemplul 174: Sare trifluoroacetat de 1-(ciclopropilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină.



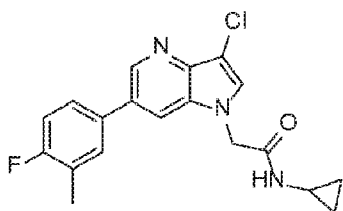
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și (bromometil)ciclopropan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}FN_2$, 280,1; m/z găsit, 281,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,95 - 8,90 (m, 2H), 8,22 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 7,84 (dd, J = 7,7, 2,5 Hz, 1H), 7,77 - 7,71 (m, 1H), 7,35 (dd, J = 9,6, 8,5 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 4,30 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,36 (d, J = 1,8 Hz, 3H), 1,41 - 1,33 (m, 1H), 0,58 - 0,52 (m, 2H), 0,49 - 0,44 (m, 2H).

Exemplul 175: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,99 (s, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,09 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,82 - 7,78 (m, 1H), 7,74 - 7,68 (m, 1H), 7,37 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 6,86 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,48 (s, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,87 (s, 3H), 2,36 (s, 3H).

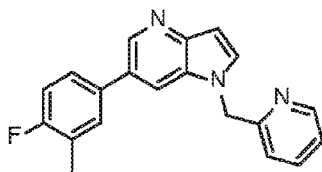
Exemplul 176: Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



Etapă A: 3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-piolo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-piolo[3,2-b]piridină (Exemplul 66, intermediar din Etapa A, 500 mg, 2,2 mmol) în DMF (5 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat încet NCS (384 mg, 2,9 mmol). Amestecul de reacție a fost lăsat să se încălzească la temperatura camerei și agitat la temperatura camerei timp de 12 ore. S-a adăugat apă și s-a lăsat să se agite timp de 20 minute. Compusul din titlu a fost colectat prin filtrare și spălat cu apă (472 mg, 82%). Brutul a fost utilizat fără nici o purificare suplimentară în etapa următoare. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 11,68 (s, 1H), 8,67 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,88 - 7,81 (m, 1H), 7,67 (d, $J = 7,0$ Hz, 1H), 7,61 - 7,52 (m, 1H), 7,26 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 2,33 (s, 3H).

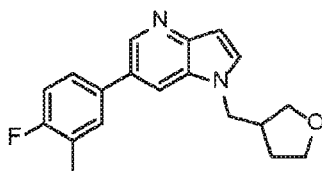
Etapă B: Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136, Etapa A înlocuind 2-bromo-1-ciclopropiletanona cu 2-bromo-N-ciclopropilacetamidă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClFN_3O$, 357,1; m/z găsit, 358,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 - 8,71 (m, 1H), 8,35 - 8,32 (m, 1H), 8,22 - 8,20 (m, 1H), 7,86 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 7,70 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,63 - 7,57 (m, 1H), 7,32 - 7,25 (m, 1H), 4,90 (s, 2H), 2,68 - 2,62 (m, 1H), 2,34 (s, 3H), 0,66 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 177: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-piridil)metilpirolo[3,2-b]piridină.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-piolo[3,2-b]piridină și 2-(bromometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{16}FN_3$, 317,1; m/z găsit, 318,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,92 (s, 1H), 8,89-8,85 (m, 1H), 8,50 - 8,47 (m, 1H), 8,21 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,70 - 7,65 (m, 1H), 7,36 - 7,26 (m, 3H), 6,84 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,79 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H).

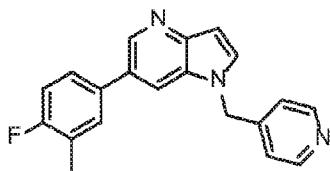
Exemplul 178: Sare trifluoroacetat de (R/S)6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-piolo[3,2-b]piridină și 3-(bromometil)tetrahidrofuran. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}FN_2O$, 310,1; m/z găsit, 311,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,97 - 8,92 (m, 2H), 8,22 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,83 (dd, $J = 7,4, 2,5$ Hz, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 1H), 7,39 -

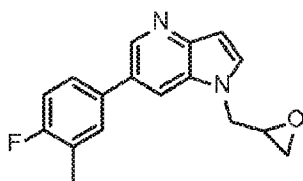
7,31 (m, 1H), 6,83 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 4,50 - 4,37 (m, 2H), 3,88 - 3,80 (m, 1H), 3,70 - 3,60 (m, 2H), 3,51 - 3,43 (m, 1H), 2,92 - 2,81 (m, 1H), 2,36 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H), 1,94 - 1,83 (m, 1H), 1,69 - 1,56 (m, 1H).

5 **Exemplul 179: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(4-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.**



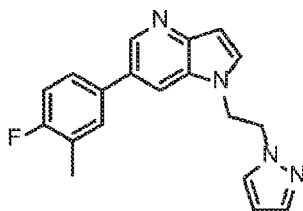
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 2-(clorometil)piridină și 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{16}FN_3$, 317,1; m/z găsit, 318,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,96 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,63 - 8,58 (m, 2H), 8,24 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,77 (dd, $J = 7,5, 2,4$ Hz, 1H), 7,70 - 7,65 (m, 1H), 7,36 - 7,29 (m, 3H), 6,91 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,84 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

15 **Exemplul 180: Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.**



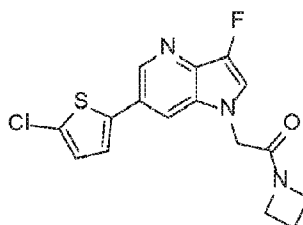
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}FN_2O$, 282,1; m/z găsit, 283,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,93 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,84 (s, 1H), 8,10 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,83 - 7,79 (m, 1H), 7,74 - 7,69 (m, 1H), 7,35 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,83 - 6,79 (m, 1H), 4,54 (dd, $J = 14,5, 3,5$ Hz, 1H), 4,42 - 4,36 (m, 1H), 3,88 - 3,82 (m, 1H), 3,41 (dd, $J = 10,9, 5,2$ Hz, 1H), 3,27 (dd, $J = 10,9, 6,4$ Hz, 1H), 2,36 (s, 3H).

25 **Exemplul 181: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-pirazol-1-iletil)pirolo[3,2-b]piridină.**



30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 1-(2-cloroetil)-1H-pirazol și 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}FN_4$, 320,1; m/z găsit, 321,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,87 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 7,81 - 7,72 (m, 2H), 7,70 - 7,63 (m, 1H), 7,42 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,39 - 7,32 (m, 2H), 6,73 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 6,08 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 4,85 (t, $J = 5,6$ Hz, 2H), 4,59 (dd, $J = 6,5, 4,5$ Hz, 2H), 2,36 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

35 **Exemplul 182: 1-(Azetidin-1-il-2-[6-(5-cloro-2-tienil-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.**

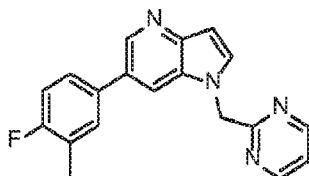


Etapă A: 1-(Azetidin-1-il-2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29, Etapă A. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6)

δ 8,43 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,28 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,66 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,23 (m, 2H).

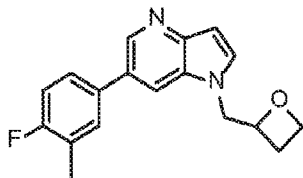
Etapa B: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29, Etapa B, înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu acid (5-clorotiofen-2-il)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$, 349,0; m/z găsit, 349,9 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,49 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,33 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,04 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,36 - 4,28 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,44 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 183: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(pirimidin-2-ilmetil)pirol[3,2-b]piridină.



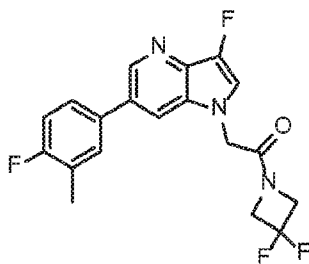
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 2-(clorometil)pirimidină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}FN_4$, 318,1; m/z găsit, 319,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,86 - 8,82 (m, 2H), 8,73 (d, $J = 5,0$ Hz, 2H), 8,19 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,67 (dd, $J = 7,2, 2,5$ Hz, 1H), 7,62 - 7,57 (m, 1H), 7,39 (t, $J = 4,9$ Hz, 1H), 7,21 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 6,92 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,93 (s, 2H), 2,37 (d, $J = 2,0$ Hz, 3H).

Exemplul 184: Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil-1-(oxetan-2-ilmetil)pirol[3,2-b]piridină.



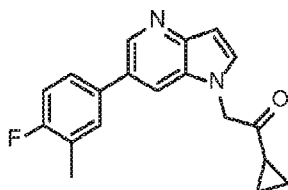
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}FN_3O$, 296,1; m/z găsit, 297,2 $[M+H]^+$.

Exemplul 185: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



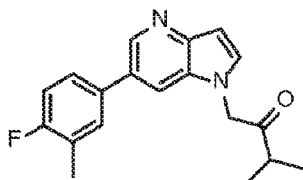
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 16) și acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,67 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,16 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,70 - 7,65 (m, 1H), 7,63 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,62 - 7,56 (m, 1H), 7,32 - 7,21 (m, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,73 (t, $J = 12,3$ Hz, 2H), 4,37 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Exemplul 186: Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



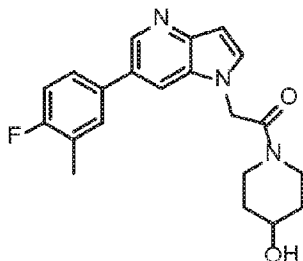
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 2-bromo-1-ciclopropiletanonă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}FN_2O$, 308,1; m/z găsit, 309,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 13,05 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,33 - 8,28 (m, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 1H), 7,72 - 7,66 (m, 1H), 7,38 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 7,02 (s, 1H), 6,12 (s, 2H), 2,41 - 2,31 (m, 4H), 1,18 - 1,11 (m, 2H), 1,08 - 1,00 (m, 2H).

Exemplul 187: Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



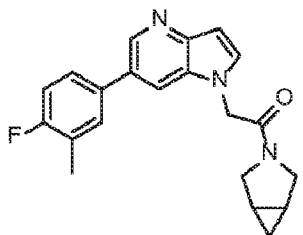
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 1-bromo-3-metilbutan-2-onă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}FN_2O$, 310,1; m/z găsit, 311,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 13,03 (s, 1H), 9,01 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,87 - 8,84 (m, 1H), 8,32 (t, $J = 3,1$ Hz, 1H), 7,78 (dd, $J = 7,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,73 - 7,66 (m, 1H), 7,43 - 7,36 (m, 1H), 7,00 - 6,96 (m, 1H), 6,05 (s, 2H), 3,05 - 2,97 (m, 1H), 2,36 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,21 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 188: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-1-piperidil)etanonă.



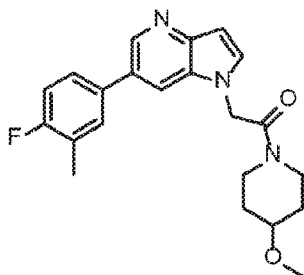
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O_2$, 367,2; m/z găsit, 368,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,97 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,11 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,79 (dd, $J = 7,4, 2,5$ Hz, 1H), 7,73 - 7,68 (m, 1H), 7,37 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,86 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,51 (s, 2H), 3,87 - 3,74 (m, 4H), 3,12 - 3,04 (m, 2H), 2,35 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H), 1,92 - 1,85 (m, 1H), 1,76 - 1,68 (m, 1H), 1,58 - 1,50 (m, 1H), 1,35 - 1,26 (m, 1H).

Exemplul 189: Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



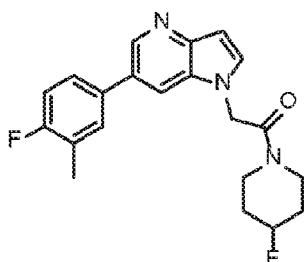
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{20}FN_3O$, 349,2; m/z găsit, 350,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,92 (s, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,01 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,76 (dd, $J = 7,2, 2,4$ Hz, 1H), 7,71 - 7,65 (m, 1H), 7,35 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,81 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,37 (d, $J = 17,3$ Hz, 1H), 5,24 (d, $J = 17,2$ Hz, 1H), 3,77 - 3,68 (m, 2H), 3,57 (d, $J = 11,6$ Hz, 2H), 2,35 (s, 3H), 1,77 - 1,70 (m, 1H), 1,62 - 1,55 (m, 1H), 0,81 - 0,73 (m, 1H), 0,24 - 0,19 (m, 1H).

Exemplul 190: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-metoxi-1-piperidil)etanonă.



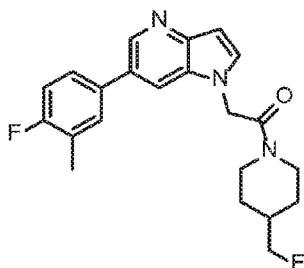
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{24}FN_3O_2$, 381,2; m/z găsit, 382,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,38 - 7,35 (m, 1H), 7,34 - 7,29 (m, 1H), 7,10 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 6,86 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,22 (d, $J = 16,9$ Hz, 1H), 5,14 (d, $J = 16,9$ Hz, 1H), 3,80 - 3,72 (m, 2H), 3,56 - 3,49 (m, 2H), 3,48 - 3,41 (m, 1H), 3,38 (s, 3H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,99 - 1,90 (m, 1H), 1,88 - 1,80 (m, 1H), 1,80 - 1,72 (m, 1H), 1,70 - 1,62 (m, 1H).

Exemplul 191: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-fluoro-1-piperidil)etanonă.



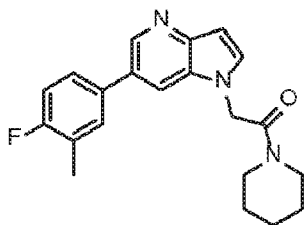
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{21}F_2N_3O$, 369,2; m/z găsit, 370,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,66 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,56 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,38 (dd, $J = 7,0, 2,4$ Hz, 1H), 7,36 - 7,31 (m, 1H), 7,12 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 6,94 - 6,91 (m, 1H), 5,23 (d, $J = 16,8$ Hz, 1H), 5,16 (d, $J = 16,8$ Hz, 1H), 5,04 - 4,87 (m, 1H), 4,04 - 3,96 (m, 1H), 3,77 - 3,68 (m, 1H), 3,67 - 3,59 (m, 1H), 3,50 - 3,40 (m, 1H), 2,35 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,11 - 2,02 (m, 1H), 2,01 - 1,87 (m, 2H), 1,86 - 1,78 (m, 1H).

Exemplul 192: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[4-(fluorometil)-1-piperidil]etanonă.



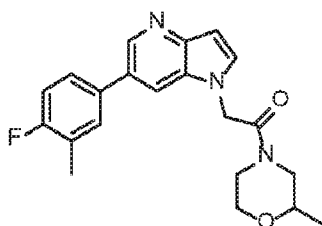
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{23}F_2N_3O$, 383,2; m/z găsit, 384,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,57 (s, 1H), 8,25 (s, 1H), 7,57 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,37 - 7,34 (m, 1H), 7,34 - 7,29 (m, 1H), 7,10 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 6,82 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,24 (d, $J = 17,0$ Hz, 1H), 5,19 (d, $J = 17,0$ Hz, 1H), 4,58 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 4,43 - 4,34 (m, 1H), 4,33 - 4,24 (m, 1H), 3,97 (d, $J = 13,8$ Hz, 1H), 3,33 - 3,23 (m, 1H), 2,77 - 2,67 (m, 1H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,09 - 1,91 (m, 2H), 1,80 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 1,49 - 1,38 (m, 1H), 1,37 - 1,26 (m, 1H).

Exemplul 193: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(1-piperidil)etanonă.



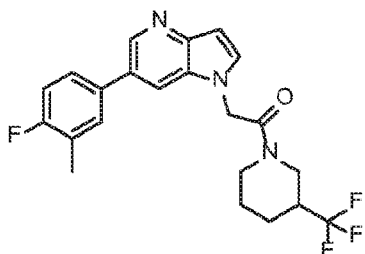
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O$, 351,2; m/z găsit, 352,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,95 min la 254 nm.

Exemplul 194: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(2-metilmorfolin-4-il)etanonă.



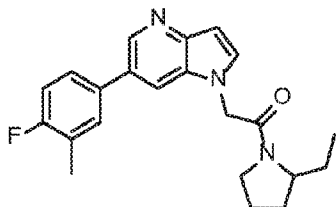
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O_2$, 367,2; m/z găsit, 368,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,89 min. la 254 nm.

Exemplul 195: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(trifluorometil)-1-piperidil]etanonă.



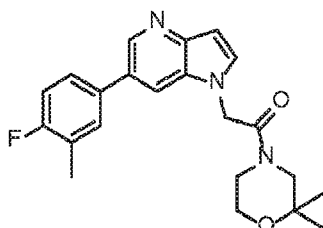
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{21}F_4N_3O$, 419,2; m/z găsit, 420,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 1,03 min la 254 nm.

Exemplul 196: Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(2-etilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



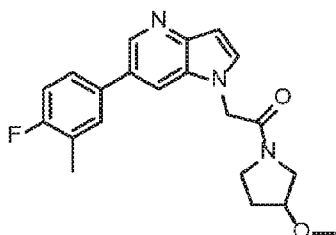
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{24}FN_3O$, 365,2; m/z găsit, 366,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,99 min la 254 nm.

Exemplul 197: Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilmorfolin-4-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



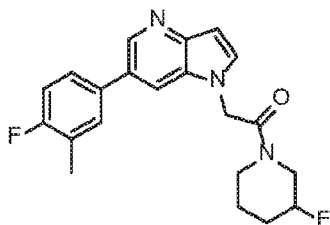
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{24}FN_3O_2$, 381,2; m/z găsit, 382,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3μm, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,91 min la 254 nm.

Exemplul 198: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxipirolidin-1-il)etanonă.



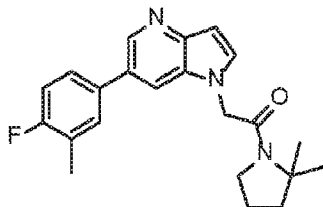
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O_2$, 367,2; m/z găsit, 368,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3μm, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,88 min la 254 nm.

Exemplul 199: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoro-1-piperidil)etanonă.

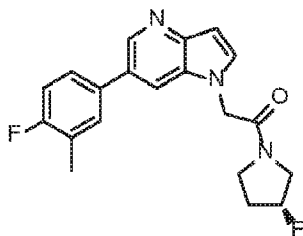


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{21}F_2N_3O$, 369,2; m/z găsit, 370,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3μm, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,92 min la 254 nm.

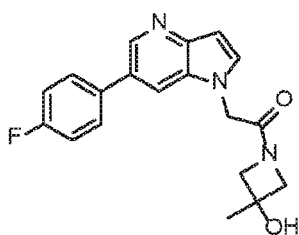
Exemplul 200: Sare trifluoroacetat de 1,2,2-dimetilpirolidin-1-il-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



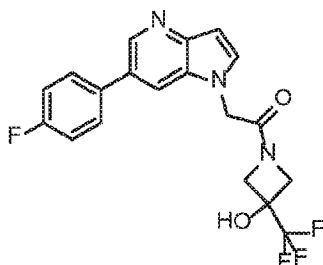
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{24}FN_3O$, 365,2; m/z găsit, 366,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3μm, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 1,00 min la 254 nm.

Exemplul 201: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă.

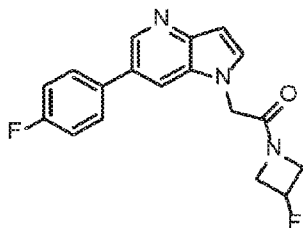
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 coloană (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 1,31 min la 254 nm.

Exemplul 202: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-3-metil-azetidin-1-il)etanonă.

15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,11 - 8,08 (m, 1H), 7,82 - 7,75 (m, 2H), 7,61 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,39 - 7,30 (m, 2H), 6,61 (dd, J = 3,2, 1,0 Hz, 1H), 5,69 (s, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,07 - 3,99 (m, 2H), 3,80 - 3,69 (m, 2H), 1,40 (s, 3H).

Exemplul 203: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-hidroxi-3-(trifluorometil)azetidin-1-il]etanonă.

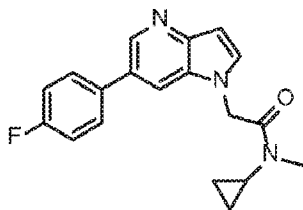
25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O_2$, 393,1; m/z găsit, 394,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,11 - 8,08 (m, 1H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,63 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 6,62 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,47 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 4,24 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 4,14 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,91 (d, J = 10,8 Hz, 1H).

Exemplul 204: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,12 - 8,08 (m, 1H), 7,81 - 7,74 (m, 2H), 7,60 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 6,62 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,47 (d, J = 10,0 Hz, 1H), 4,24 (d, J = 9,9 Hz, 1H), 4,14 (d, J = 10,8 Hz, 1H), 3,91 (d, J = 10,8 Hz, 1H).

(m, 2H), 6,61 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,55 - 5,35 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 2,3$ Hz, 2H), 4,61 - 4,45 (m, 1H), 4,38 - 4,17 (m, 2H), 4,04 - 3,88 (m, 1H).

Exemplul 205: N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.

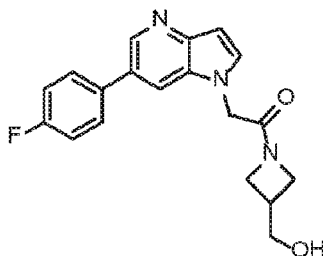


5

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,82 - 7,74 (m, 2H), 7,62 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 2H), 6,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 3,00 - 2,95 (m, 1H), 2,83 (s, 3H), 1,02 - 0,95 (m, 2H), 0,93 (dd, $J = 7,0, 4,6$ Hz, 2H).

10

Exemplul 206: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(hidroximetil)azetidin-1-il]etanonă.

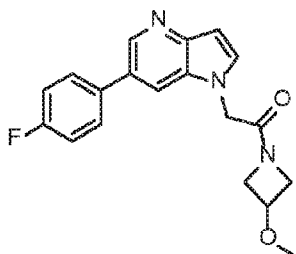


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 - 8,61 (m, 1H), 8,10 - 8,06 (m, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,61 - 7,58 (m, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,83 (t, $J = 5,1$ Hz, 1H), 4,20 (t, $J = 8,3$ Hz, 1H), 3,96 - 3,86 (m, 2H), 3,65 - 3,60 (m, 1H), 3,57 - 3,51 (m, 2H), 2,77 - 2,67 (m, 1H).

20

Exemplul 207: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă.

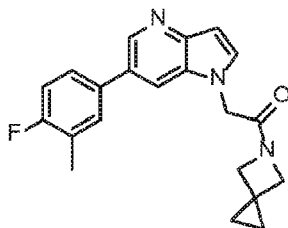


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 - 8,61 (m, 1H), 8,11 - 8,06 (m, 1H), 7,82 - 7,74 (m, 2H), 7,62 - 7,57 (m, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,61 - 6,58 (m, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,41 - 4,34 (m, 1H), 4,29 - 4,22 (m, 1H), 4,11 - 4,02 (m, 2H), 3,75 - 3,68 (m, 1H), 3,23 (s, 3H).

Exemplul 208: Sare trifluoroacetat de 1-(5-azaspiro[2.3]hexan-5-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

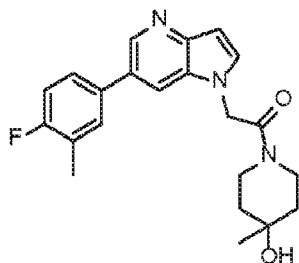
30



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{20}FN_3O$, 349,2; m/z găsit, 350,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,00 (s, 1H), 8,96 (s, 1H), 8,11 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,83 - 7,79 (m, 1H), 7,75 - 7,69 (m, 1H), 7,38 (t, $J =$

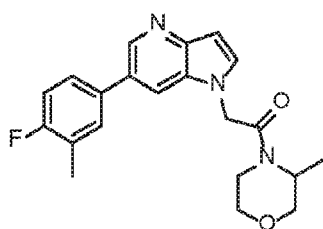
9,1 Hz, 1H), 6,87 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,35 (s, 2H), 3,99 (s, 2H), 2,36 (s, 3H), 0,74 - 0,65 (m, 4H).

Exemplul 209: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-4-metil-1-piperidil)etanonă.



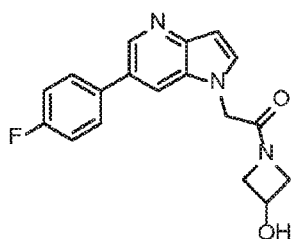
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{24}FN_3O_2$, 381,2; m/z găsit, 382,2 $[M+H]^+$.

Exemplul 210: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilmorfolin-4-il)etanonă.



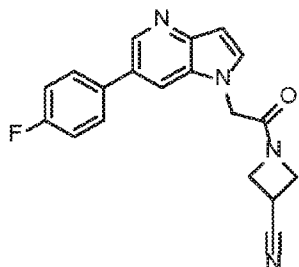
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O_2$, 367,2; m/z găsit, 368,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3μm, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,88$ min la 254 nm.

Exemplul 211: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiazetidin-1-il)etanonă.

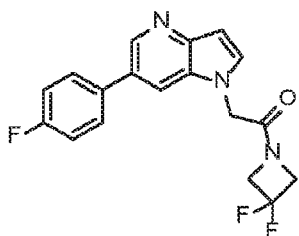


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O_2$, 325,1; m/z găsit, 326,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,10 - 8,08 (m, 1H), 7,80 - 7,76 (m, 2H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,36 - 7,31 (m, 2H), 6,61 - 6,59 (m, 1H), 5,78 (d, $J = 5,7$ Hz, 1H), 5,03 (d, $J = 2,8$ Hz, 2H), 4,55 - 4,47 (m, 1H), 4,38 - 4,33 (m, 1H), 4,12 - 4,07 (m, 1H), 3,96 - 3,91 (m, 1H), 3,65 - 3,61 (m, 1H).

Exemplul 212: 1-[2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]azetidin-3-carbonitril.

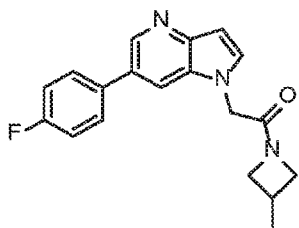


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}FN_4O$, 334,1; m/z găsit, 335,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,11 - 8,08 (m, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 2H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,05 (s, 2H), 4,52 - 4,36 (m, 1H), 4,23 - 4,16 (m, 1H), 4,12 - 4,01 (m, 2H), 3,91 - 3,81 (m, 1H).

Exemplul 213: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

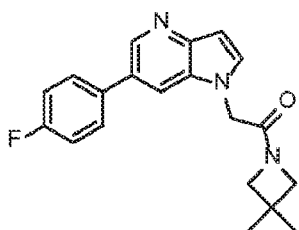
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,12 - 8,10 (m, 1H), 7,80 - 7,75 (m, 2H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 2H), 6,62 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,14 (s, 2H), 4,75 - 4,68 (m, 2H), 4,41 - 4,33 (m, 2H).

10 **Exemplul 214: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilazetidin-1-il)etanonă.**



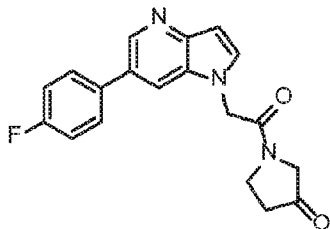
15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,10 - 8,08 (m, 1H), 7,80 - 7,76 (m, 2H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 2H), 6,60 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,30 (t, $J = 8,4$ Hz, 1H), 4,01 (t, $J = 8,9$ Hz, 1H), 3,76 (dd, $J = 8,4$, 5,6 Hz, 1H), 3,46 (dd, $J = 9,5$, 5,6 Hz, 1H), 2,77 - 2,68 (m, 1H), 1,21 (d, $J = 6,9$ Hz, 3H).

20 **Exemplul 215: 1-(3,3-Dimetilazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**

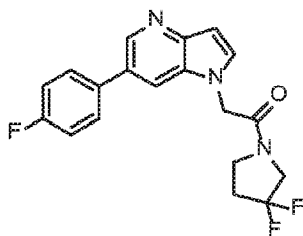


25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 3,88 (s, 2H), 3,59 (s, 2H), 1,25 (s, 6H).

Exemplul 216: Sare trifluoroacetat de 1-[2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]pirolidin-3-onă.

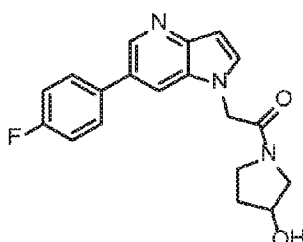


30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}FN_3O_2$, 337,1; m/z găsit, 338,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,75 min la 254 nm.

Exemplul 217: 1-(3,3-Difluoropirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

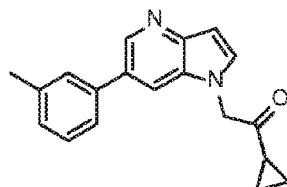
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,60 - 7,56 (m, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,62 - 6,58 (m, 1H), 5,26 (s, 1H), 5,19 (s, 1H), 4,13 (t, $J = 13,2$ Hz, 1H), 3,90 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 3,74 (t, $J = 13,2$ Hz, 1H), 3,57 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 2,64 - 2,53 (m, 1H), 2,46 - 2,38 (m, 1H).

10 **Exemplul 218: (R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxipirolidin-1-il)etanonă.**



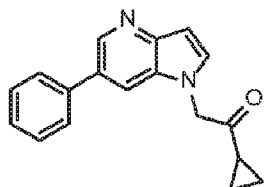
15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O_2$, 339,1; m/z găsit, 340,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN pentru 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,72$ min la 254 nm.

20 **Exemplul 219: 1-Ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



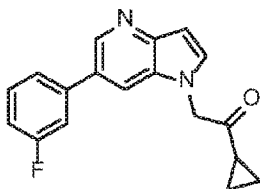
25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}N_2O$, 290,1; m/z găsit, 291,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 - 8,05 (m, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,52 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,37 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,19 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,48 (s, 2H), 2,40 (s, 3H), 2,13 - 2,06 (m, 1H), 1,01 - 0,91 (m, 4H).

Exemplul 220: 1-Ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



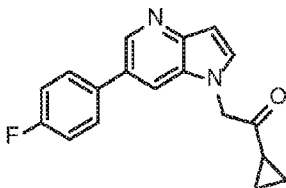
30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}N_2O$, 276,1; m/z găsit, 277,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,10 - 8,08 (m, 1H), 7,77-7,71 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,53 - 7,47 (m, 2H), 7,41 - 7,35 (m, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,48 (s, 2H), 2,14 - 2,06 (m, 1H), 1,02 - 0,91 (m, 4H).

35 **Exemplul 221: 1-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



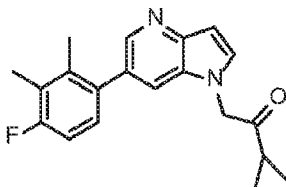
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}FN_2O$, 294,1; m/z găsit, 295,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,19 - 8,17 (m, 1H), 7,65 - 7,59 (m, 3H), 7,56 - 7,50 (m, 1H), 7,23 - 7,17 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,48 (s, 2H), 2,14 - 2,07 (m, 1H), 1,02 - 0,96 (m, 2H), 0,96 - 0,91 (m, 2H).

Exemplul 222: 1-Ciclopripil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



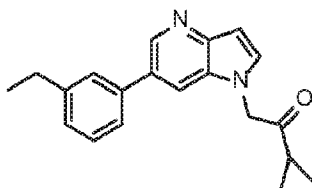
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}FN_2O$, 294,1; m/z găsit, 295,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,10 - 8,07 (m, 1H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,35 - 7,30 (m, 2H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,47 (s, 2H), 2,13 - 2,06 (m, 1H), 1,01 - 0,96 (m, 2H), 0,96 - 0,92 (m, 2H).

Exemplul 223: 1-[6-(4-Fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



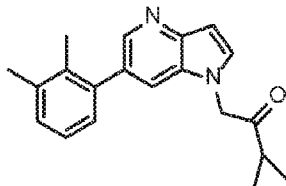
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}FN_2O$, 324,2; m/z găsit, 325,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,24 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,70 - 7,67 (m, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,15 - 7,05 (m, 2H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,36 (s, 2H), 2,84 - 2,75 (m, 1H), 2,22 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H), 2,15 (s, 3H), 1,10 (d, $J = 7,0$ Hz, 6H).

Exemplul 224: 1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{22}N_2O$, 306,2; m/z găsit, 307,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,02 - 8,00 (m, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,56 - 7,54 (m, 1H), 7,54 - 7,50 (m, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,24 - 7,20 (m, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,42 (s, 2H), 2,88 - 2,79 (m, 1H), 2,69 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,24 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H), 1,13 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

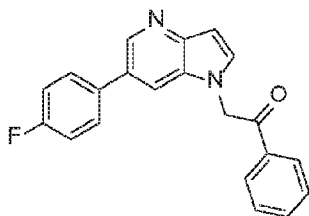
Exemplul 225: 1-[6-(2,3-Dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{22}N_2O$, 306,2; m/z găsit, 307,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,28

(d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,23 - 7,14 (m, 2H), 7,09 (dd, $J = 7,3$, 1,8 Hz, 1H), 6,64 - 6,62 (m, 1H), 5,38 (s, 2H), 2,84 - 2,75 (m, 1H), 2,31 (s, 3H), 2,12 (s, 3H), 1,10 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

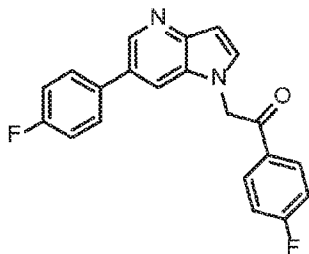
Exemplul 226: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-fenil-etanonă.



Etapa A: 6-(4-Fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridină (5 g, 25 mmol) în dioxan (100 mL) s-a adăugat acid 4-fluorofenilboronic (4,26 g, 30,5 mmol), Pd(dppf)Cl₂ (1,86 g, 2,54 mmol), CS₂CO₃ (24,8 g, 76,1 mmol) și apă (10 mL). După 16 ore la 90 °C amestecul de reacție a fost răcit și concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (5,3 g, 98%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₃H₉FN₂, 212,1; m/z găsit, 213,1 [M+H]⁺.

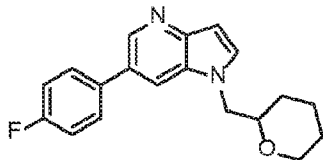
Etapa B: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-fenil-etanonă. La o soluție de 6-(4-fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină (100 mg, 0,471 mmol) în DMF anhidră (5 mL) s-a adăugat NaH (dispersie 60%, 26 mg, 0,66 mmol) la 0 °C în porții mici, sub argon. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 min. Amestecul de reacție a fost răcit la 0 °C și la amestec s-a adăugat 2-bromoacetofenonă (98 mg, 0,495 mmol) în porții mici. Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitare a fost continuată timp de 12 h. La amestecul de reacție s-a adăugat apă și masa de reacție a fost extrasă cu EtOAc. Straturile organice au fost combinate, uscate, filtrate, și concentrate. Purificarea prin HPLC Metoda C a furnizat compusul din titlu. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₁H₁₅FN₂O, 330,1; m/z găsit, 331,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,70 - 8,60 (s, 1H), 8,28 - 8,18 (s, 1H), 8,14 - 7,98 (m, 2H), 7,83 - 7,70 (m, 3H), 7,70 - 7,57 (m, 3H), 7,36 - 7,19 (m, 2H), 6,72 - 6,57 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 6,11 - 5,94 (s, 1H).

Exemplul 227: 1-(4-Fluorofenil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



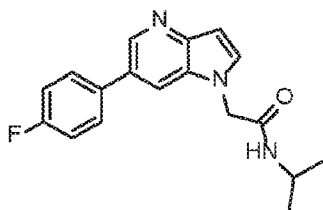
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 226. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₁H₁₄F₂N₂O, 348,1; m/z găsit, 349,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,66 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,22 - 8,20 (m, 1H), 8,20 - 8,17 (m, 2H), 7,79 - 7,75 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,49 - 7,44 (m, 2H), 7,32 - 7,27 (m, 2H), 6,65 (dd, $J = 3,2$, 0,9 Hz, 1H), 6,02 (s, 2H).

Exemplul 228: Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluorofenil-1-(tetrahidropiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



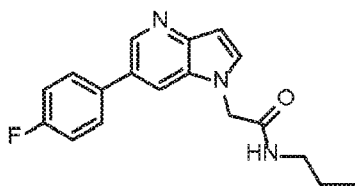
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 226. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₉FN₂O, 310,1; m/z găsit, 311,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 9,01 (br. s, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,95 - 7,89 (m, 2H), 7,47 - 7,39 (m, 2H), 6,80 (s, 1H), 4,50 (dd, $J = 14,6$, 3,5 Hz, 1H), 4,41 (dd, $J = 14,6$, 7,8 Hz, 1H), 3,84 - 3,79 (m, 1H), 3,70 - 3,63 (m, 1H), 3,30 - 3,22 (m, 1H), 1,78 (d, $J = 12,2$ Hz, 1H), 1,70 - 1,64 (m, 1H), 1,52 - 1,36 (m, 3H), 1,25 - 1,13 (m, 1H).

Exemplul 229: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izopropil-acetamidă.



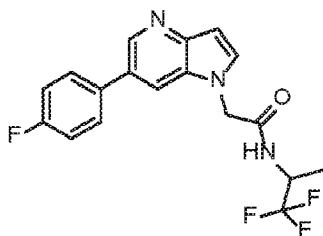
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (s, 1H), 8,16 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,81 - 7,72 (m, 2H), 7,63 (s, 1H), 7,34 (t, $J = 8,4$ Hz, 2H), 6,59 (s, 1H), 4,87 (s, 2H), 3,88 - 3,79 (m, 1H), 1,08 (d, $J = 6,6$ Hz, 6H).

Exemplul 230: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-propil-acetamidă.



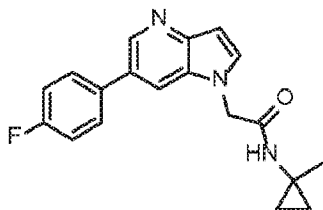
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (t, $J = 5,6$ Hz, 1H), 8,08 - 8,06 (m, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,31 (m, 2H), 6,59 (d, $J = 3,2$, 0,9 Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 3,05 (q, $J = 6,6$ Hz, 2H), 1,47 - 1,38 (m, 2H), 0,83 (t, $J = 7,4$ Hz, 3H).

Exemplul 231: (R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2,2,2-trifluoro-1-metil-etil)acetamidă.



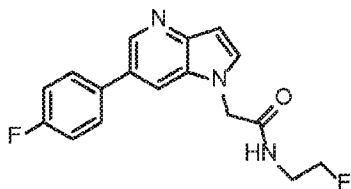
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_4N_3O$, 365,1; m/z găsit, 366,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,91 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,05 - 8,03 (m, 1H), 7,79 - 7,73 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 6,60 (dd, $J = 3,3$, 0,8 Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,65 - 4,53 (m, 1H), 1,28 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H).

Exemplul 232: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(1-metilciclopropil)acetamidă.



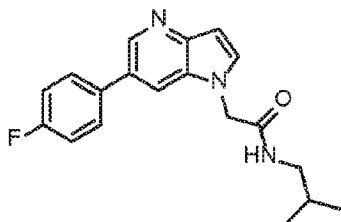
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,05 - 8,02 (m, 1H), 7,79 - 7,73 (m, 2H), 7,62 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,38 - 7,31 (m, 2H), 6,59 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 4,82 (s, 2H), 1,26 (s, 3H), 0,65 - 0,60 (m, 2H), 0,55 - 0,51 (m, 2H).

Exemplul 233: N-(2-Fluoroetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



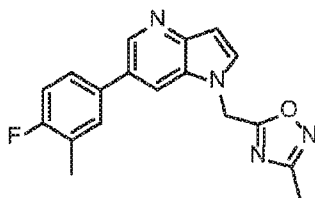
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (s, 1H), 8,50 (t, $J = 5,7$ Hz, 1H), 8,10 - 8,06 (m, 1H), 7,81 - 7,74 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,62 - 6,59 (m, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,50 (t, $J = 5,0$ Hz, 1H), 4,39 (t, $J = 4,9$ Hz, 1H), 3,47 - 3,41 (m, 2H).

Exemplul 234: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izobutil-acetamidă.



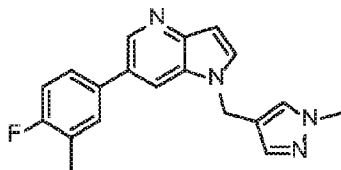
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_5O$, 325,2; m/z găsit, 326,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,19 (t, $J = 5,8$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 1,9, 0,8$ Hz, 1H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 6,59 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 2,92 (t, $J = 6,3$ Hz, 2H), 1,75 - 1,63 (m, 1H), 0,83 (d, $J = 6,7$ Hz, 6H).

Exemplul 235: 5-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol.



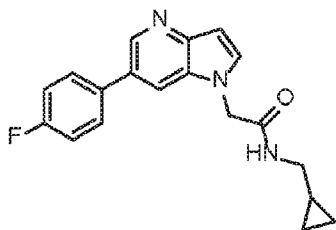
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 5-(clorometil)-3-metil-1,2,4-oxadiazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}FN_4O$, 322,1; m/z găsit, 323,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,29 - 8,25 (m, 1H), 7,79 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 7,71 - 7,66 (m, 1H), 7,62 - 7,55 (m, 1H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,68 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,96 (s, 2H), 2,32 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,27 (s, 3H).

Exemplul 236: 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină.



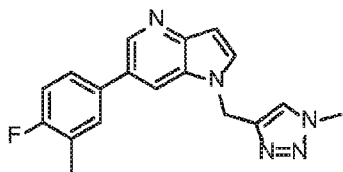
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 4-(clorometil)-1-metil-1H-pirazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}FN_4$, 320,1; m/z găsit, 321,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,61 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,22 - 8,19 (m, 1H), 7,72 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,70 - 7,66 (m, 1H), 7,61 - 7,55 (m, 2H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,57 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 6,14 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 3,77 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 2,0$ Hz, 3H).

Exemplul 237: N-(Ciclopropilmetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



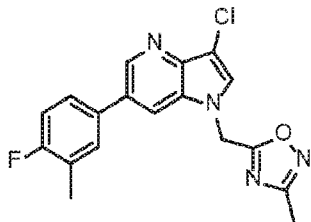
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 - 8,62 (m, 1H), 8,31 (t, $J = 5,8$ Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,81 - 7,74 (m, 2H), 7,66 - 7,63 (m, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,61 - 6,58 (m, 1H), 4,93 (s, 2H), 3,00 - 2,95 (m, 2H), 0,95 - 0,86 (m, 1H), 0,42 - 0,36 (m, 2H), 0,17 - 0,12 (m, 2H).

Exemplul 238: 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metiltriazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină.



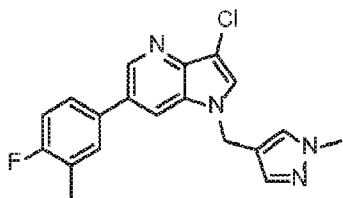
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 4-(clorometil)-1-metil-1H-1,2,3-triazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_5$, 321,1; m/z găsit, 322,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,29 - 8,26 (m, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,75 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,72 - 7,67 (m, 1H), 7,63 - 7,57 (m, 1H), 7,27 (dd, $J = 9,7$, 8,5 Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,2$, 0,9 Hz, 1H), 5,56 (s, 2H), 3,97 (s, 3H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Exemplul 239: 5-[[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol.



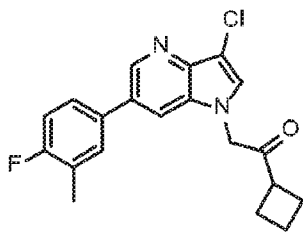
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 176. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClFN_4O$, 356,1; m/z găsit, 357,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,39 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,73 - 7,69 (m, 1H), 7,64 - 7,57 (m, 1H), 7,28 (dd, $J = 9,7$, 8,5 Hz, 1H), 5,96 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,26 (s, 3H).

Exemplul 240: 3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină.



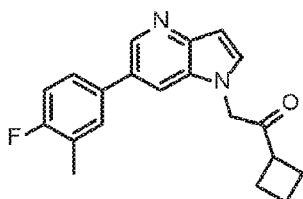
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 176. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClFN_4$, 354,1; m/z găsit, 355,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,31 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,72 - 7,68 (m, 1H), 7,63 - 7,57 (m, 2H), 7,28 (t, $J = 9,7$, 8,5 Hz, 1H), 6,19 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 3,77 (s, 3H), 2,34 (d, $J = 2,0$ Hz, 3H).

Exemplul 241: 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclobutil-etanonă.



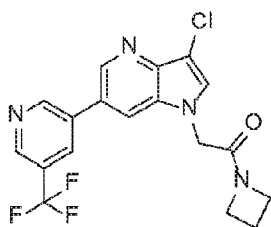
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 176. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}ClFN_2O$, 356,1; m/z găsit, 357,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 1,28 min la 254 nm.

Exemplul 242: 1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 2-bromo-1-ciclobutiletanonă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}FN_2O$, 322,1; m/z găsit, 323,2 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,99 min la 254 nm.

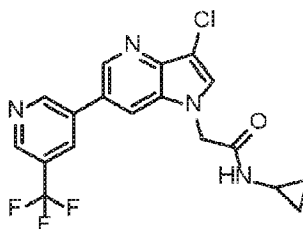
Exemplul 243: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Etapa A: 3-Cloro-6-(5-(trifluorometil)piridin-3-il)-1H-pirol[3,2-b]piridină. Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27, Etapa A, inlocuind acidul (4-fluorofenil)boronic cu acid (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 11,87 (s, 1H), 9,29 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,01 - 8,97 (m, 1H), 8,84 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,60 - 8,56 (m, 1H), 8,26 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 7,95 (s, 1H).

Etapa B: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă. Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 68, etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_3N_4O$, 394,1; m/z găsit, 395,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9,33 (s, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,90 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,59 (t, J = 2,2 Hz, 1H), 8,48 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 7,88 (s, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,25 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 3,91 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 2,34 - 2,25 (m, 2H).

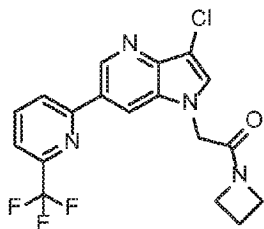
Exemplul 244: Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 243. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_3N_4O$, 394,1; m/z găsit, 395,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ

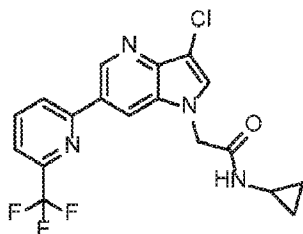
9,33 (s, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,92 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,61 - 8,57 (m, 1H), 8,49 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 7,94 (s, 1H), 4,93 (s, 2H), 2,69 - 2,61 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,49 - 0,41 (m, 2H).

5 **Exemplul 245: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



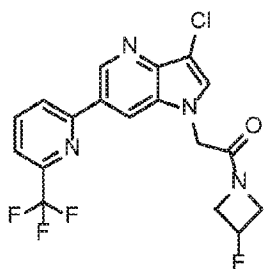
10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 243, inlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-6-(trifluorometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_3N_4O$, 394,1; m/z găsit, 395,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,17 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,40 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 8,24 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,90 (s, 2H), 5,07 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,35 - 2,25 (m, 2H).

15 **Exemplul 246: 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă.**



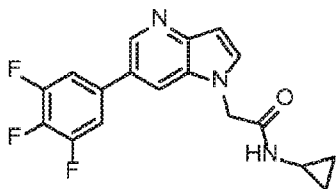
20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 243 inlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-6-(trifluorometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_3N_4O$, 394,1; m/z găsit, 395,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,18 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,44 - 8,39 (m, 2H), 8,23 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,89 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 2,69 - 2,61 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,49 - 0,43 (m, 2H).

25 **Exemplul 247: 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.**



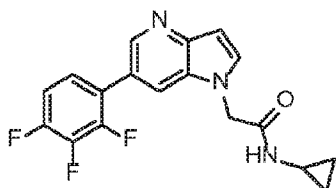
30 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 243 inlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-6-(trifluorometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_4N_4O$, 412,1; m/z găsit, 413,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 9,16 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,60 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,25 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 8,12 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,76 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,71 (s, 1H), 5,54 - 5,32 (m, 1H), 5,11 (s, 2H), 4,70 - 4,56 (m, 1H), 4,51 - 4,27 (m, 2H), 4,19 - 4,04 (m, 1H).

35 **Exemplul 248: N-Ciclopropil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.**



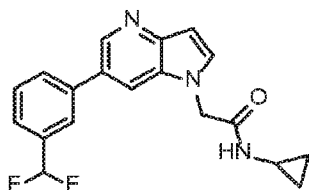
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-piolo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,32 (d, $J = 4,3$ Hz, 1H), 8,23 - 8,20 (m, 1H), 7,84 - 7,76 (m, 2H), 7,68 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,88 (s, 2H), 2,69 - 2,61 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 249: N-Ciclopropil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)piolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



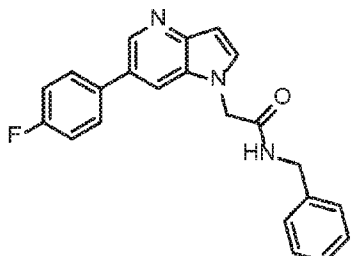
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-piolo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (2,3,4-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 4,1$ Hz, 1H), 8,01 - 7,98 (m, 1H), 7,70 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,51 - 7,45 (m, 2H), 6,63 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 2,67 - 2,60 (m, 1H), 0,63 (td, $J = 7,0, 4,7$ Hz, 2H), 0,46 - 0,40 (m, 2H).

Exemplul 250: N-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]piolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



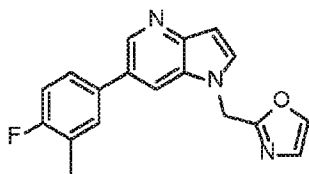
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-piolo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (3-(difluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,35 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,15 - 8,13 (m, 1H), 7,95 - 7,90 (m, 2H), 7,69 - 7,63 (m, 2H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,12 (t, $J = 55,8$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 4,89 (s, 2H), 2,70 - 2,61 (m, 1H), 0,66 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,42 (m, 2H).

Exemplul 251: N-Benzil-2-[6-(4-fluorofenil)piolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



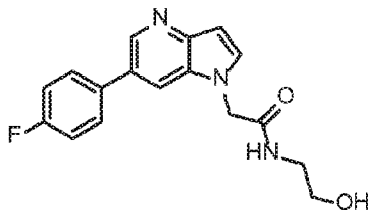
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{22}H_{18}FN_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (t, $J = 5,9$ Hz, 1H), 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,71 (m, 2H), 7,68 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 7,28 - 7,19 (m, 5H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,31 (d, $J = 5,9$ Hz, 2H).

Exemplul 252: 2-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)piolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]oxazol.



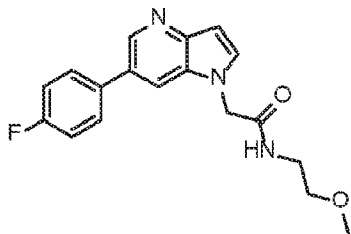
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 170 utilizand 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 2-(clorometil)oxazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}FN_3O$, 307,1; m/z găsit, 308,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,21 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 8,06 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 7,77 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,69 - 7,65 (m, 1H), 7,60 - 7,54 (m, 1H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 7,17 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,74 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Exemplul 253: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-hidroxietyl)acetamidă.



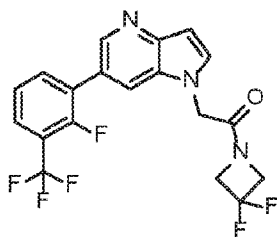
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3O_2$, 313,1; m/z găsit, 314,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,25 - 8,20 (m, 1H), 8,12 - 8,09 (m, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 2H), 7,66 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,74 - 4,70 (m, 1H), 3,46 - 3,40 (m, 2H), 3,19 - 3,13 (m, 2H).

Exemplul 254: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-metoxietil)acetamidă.



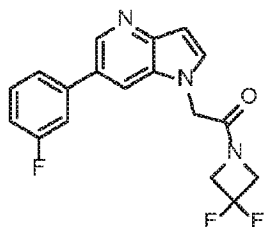
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O_2$, 327,1; m/z găsit, 328,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,32 (t, $J = 5,5$ Hz, 1H), 8,09 - 8,07 (m, 1H), 7,81 - 7,74 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,30 (m, 2H), 6,59 (dd, $J = 3,4, 0,8$ Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,38 - 3,31 (m, 2H), 3,28 - 3,23 (m, 2H), 3,21 (s, 3H).

Exemplul 255: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}F_6N_3O$, 413,1; m/z găsit, 414,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,82 (s, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,04 - 7,98 (m, 2H), 7,92 (t, $J = 6,8$ Hz, 1H), 7,62 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 4,76 (t, $J = 12,3$ Hz, 2H), 4,38 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H).

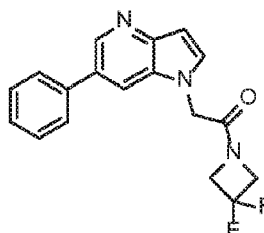
Exemplul 256: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 9,01 - 8,93 (m, 2H), 8,09 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,68 - 7,57 (m, 3H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 6,94 (dd, $J = 3,3$, 1,0 Hz, 1H), 5,38 (s, 2H), 4,84 - 4,77 (m, 2H), 4,50 - 4,39 (m, 2H).

5

Exemplul 257: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-yl)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-yl)etanonă.

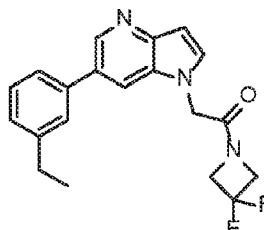


10

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,97 (s, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,07 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,85 - 7,79 (m, 2H), 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,54 - 7,49 (m, 1H), 6,94 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,38 (s, 2H), 4,81 (t, $J = 11,9$ Hz, 2H), 4,45 (t, $J = 12,1$ Hz, 2H).

15

Exemplul 258: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-yl)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-yl]etanonă.

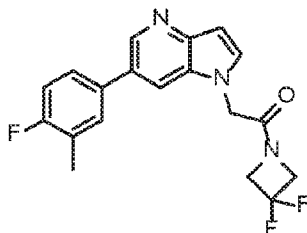


20

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,96 - 8,94 (m, 1H), 8,90 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,06 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,67 - 7,65 (m, 1H), 7,63 - 7,58 (m, 1H), 7,49 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,39 - 7,35 (m, 1H), 6,93 (dd, $J = 3,3$, 0,8 Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 4,81 (t, $J = 12,0$ Hz, 2H), 4,45 (t, $J = 12,1$ Hz, 2H), 2,78 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,32 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

25

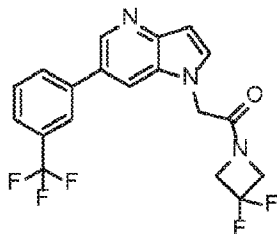
Exemplul 259: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-yl)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-yl]etanonă.



30

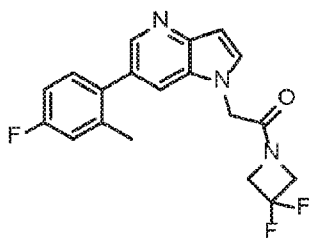
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,99 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,06 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,79 (dd, $J = 7,3$, 2,4 Hz, 1H), 7,73 - 7,67 (m, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 1H), 6,87 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 4,79 (t, $J = 12,4$ Hz, 2H), 4,39 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 2,36 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Exemplul 260: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-yl)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-yl]etanonă.



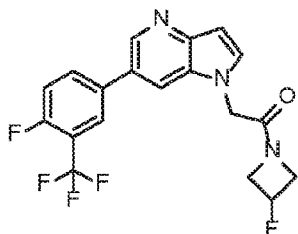
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,97 (s, 2H), 8,15 (s, 1H), 8,10 - 8,09 (m, 1H), 8,08 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,85 - 7,76 (m, 2H), 6,94 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,38 (s, 2H), 4,80 (t, $J = 11,8$ Hz, 2H), 4,45 (t, $J = 12,1$ Hz, 2H).

Exemplul 261: Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



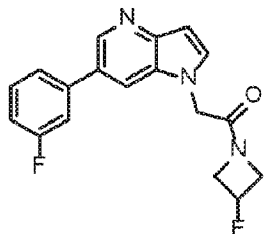
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,68 - 8,65 (m, 1H), 8,63 - 8,60 (m, 1H), 8,09 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,39 (dd, $J = 8,5, 5,8$ Hz, 1H), 7,17 (dd, $J = 9,8, 2,7$ Hz, 1H), 7,13 - 7,07 (m, 1H), 6,96 (dd, $J = 3,4, 1,0$ Hz, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,77 (t, $J = 11,9$ Hz, 2H), 4,42 (t, $J = 12,1$ Hz, 2H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 262: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μm , 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,93$ min la 254 nm.

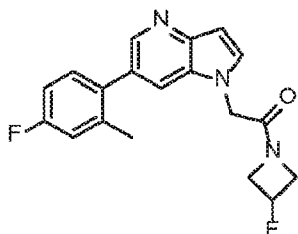
Exemplul 263: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,96 - 8,91 (m, 2H), 8,08 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,69 - 7,56

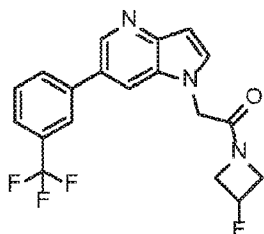
(m, 3H), 7,29 - 7,21 (m, 1H), 6,93 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,57 - 5,37 (m, 1H), 5,32 (d, $J = 3,5$ Hz, 2H), 4,78 - 4,64 (m, 1H), 4,56 - 4,44 (m, 1H), 4,44 - 4,32 (m, 1H), 4,20 - 4,07 (m, 1H).

Exemplul 264: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo][3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



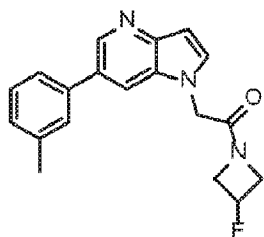
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (4-fluoro-2-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,65 (t, $J = 1,2$ Hz, 1H), 8,61 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 8,09 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,39 (dd, $J = 8,5, 5,7$ Hz, 1H), 7,17 (dd, $J = 9,8, 2,7$ Hz, 1H), 7,13 - 7,06 (m, 1H), 6,95 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,54 - 5,34 (m, 1H), 5,28 (d, $J = 4,2$ Hz, 2H), 4,74 - 4,62 (m, 1H), 4,53 - 4,41 (m, 1H), 4,41 - 4,30 (m, 1H), 4,17 - 4,05 (m, 1H), 2,32 (s, 3H).

Exemplul 265: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-(trifluorometil)fenil)pirolo][3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



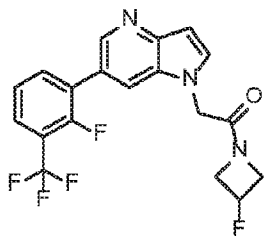
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9,04 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,21 - 8,12 (m, 2H), 8,03 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,88 - 7,79 (m, 2H), 6,85 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,58 - 5,41 (m, 1H), 5,27 (s, 2H), 4,67 - 4,56 (m, 1H), 4,43 - 4,32 (m, 1H), 4,31 - 4,21 (m, 1H), 4,04 - 3,93 (m, 1H).

Exemplul 266: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo][3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



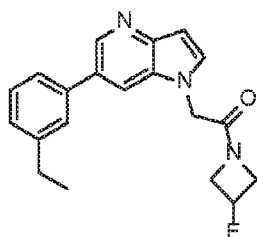
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid m-tolilboronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 9,00 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,93 - 8,91 (m, 1H), 8,08 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,67 - 7,63 (m, 1H), 7,51 - 7,44 (m, 1H), 7,35 - 7,28 (m, 1H), 6,89 - 6,86 (m, 1H), 5,61 - 5,40 (m, 1H), 5,30 (s, 2H), 4,70 - 4,56 (m, 1H), 4,46 - 4,33 (m, 1H), 4,32 - 4,20 (m, 1H), 4,07 - 3,92 (m, 1H), 2,44 (s, 3H).

Exemplul 267: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo][3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



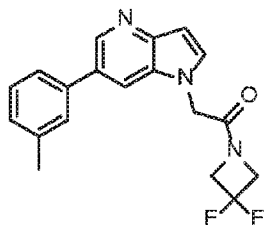
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,04 - 7,97 (m, 1H), 7,95 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 7,93 - 7,87 (m, 1H), 7,61 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 5,59 - 5,37 (m, 1H), 5,20 (d, J = 2,6 Hz, 2H), 4,66 - 4,52 (m, 1H), 4,42 - 4,30 (m, 1H), 4,30 - 4,18 (m, 1H), 4,03 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 268: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(3-etilfenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



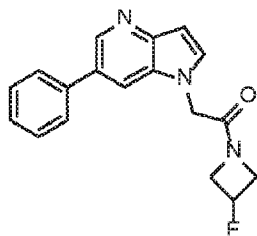
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid (3-etilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,96 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,80 (s, 1H), 8,02 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,72 - 7,61 (m, 2H), 7,49 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 3,2 Hz, 1H), 5,61 - 5,39 (m, 1H), 5,27 (d, J = 1,9 Hz, 2H), 4,68 - 4,54 (m, 1H), 4,47 - 4,32 (m, 1H), 4,33 - 4,20 (m, 1H), 4,04 - 3,91 (m, 1H), 2,73 (q, J = 7,6 Hz, 2H), 1,27 (t, J = 7,6 Hz, 3H).

Exemplul 269: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



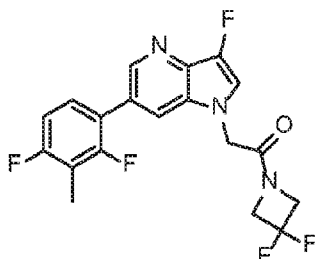
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 12) și acid m-tolilboronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,88 min la 254 nm.

Exemplul 270: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



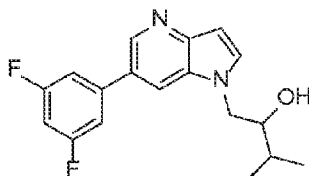
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 13) și acid fenil boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,1 $[M+H]^+$.

Exemplul 271: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)-3-fluoropirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



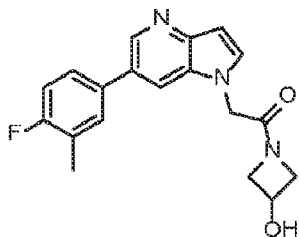
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 16) și acid (2,4-difluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 - 8,47 (m, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,68 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,50 - 7,42 (m, 1H), 7,27 - 7,18 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,72 (t, J = 12,3 Hz, 2H), 4,42 - 4,30 (m, 2H), 2,25 (s, 3H).

Exemplul 272: (R/S)-1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-ol.



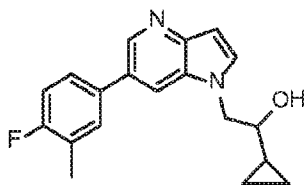
La o soluție de compus 1-[6-(3,5-difluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă (Exemplul 364, 60 mg, 0,19 mmol) într-un amestec de THF (2,5 mL) și MeOH (2,5 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat $NaBH_4$ (14 mg, 0,38 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la 0 °C timp de 30 minute. Volatilele au fost evaporate și reziduul a fost preluat în EtOAc și apă. Faza apoasă a fost extrasă de 2 ori cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost spălate cu apă, uscate ($MgSO_4$), filtrate și evaporate pentru a da compusul din titlu (39 mg, 64%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}F_2N_2O$, 316,1; m/z găsit, 317,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la 99% ACN timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). R_t = 0,93 min la 254 nm.

Exemplul 273: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiacetidin-1-il)etanonă.



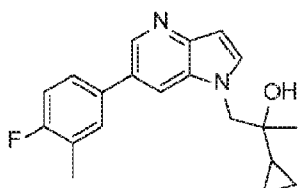
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O_2$, 339,1; m/z găsit, 340,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 1,9, 0,9 Hz, 1H), 7,42 - 7,38 (m, 1H), 7,39 - 7,34 (m, 1H), 7,28 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,08 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,70 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 4,76 (s, 2H), 4,59 - 4,53 (m, 1H), 4,28 - 4,20 (m, 1H), 3,94 - 3,85 (m, 2H), 3,69 - 3,64 (m, 1H), 2,35 (d, J = 1,9 Hz, 3H), 2,16 (br. s, 1H).

Exemplul 274: (R/S)-1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanol.



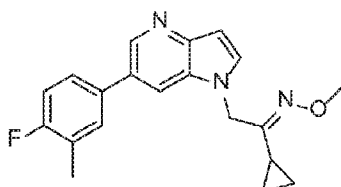
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 272. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}FN_2O$, 310,1; m/z găsit, 311,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,59 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,13 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,71 - 7,65 (m, 2H), 7,62 - 7,55 (m, 1H), 7,29 - 7,22 (m, 1H), 6,55 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 4,92 (d, $J = 5,0$ Hz, 1H), 4,33 (dd, $J = 14,2, 4,3$ Hz, 1H), 4,24 (dd, $J = 14,3, 7,1$ Hz, 1H), 3,29 - 3,24 (m, 1H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 0,84 - 0,75 (m, 1H), 0,37 - 0,22 (m, 3H), 0,18 - 0,11 (m, 1H).

Exemplul 275: Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-ciclopropil-1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]propan-2-ol.



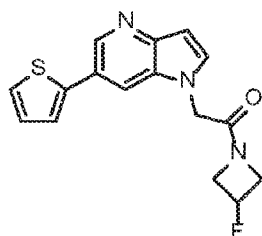
La o soluție de compus 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă (Exemplul 186, 35 mg, 0,11 mmol) în THF (4 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat încet o soluție de CH_3MgBr 3M în Et_2O (114 μL , 0,34 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la 0 °C timp de 3 ore și s-a adăugat apă. Faza apoasă a fost extrasă de 2 ori cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate ($MgSO_4$), filtrate și evaporate. Purificarea prin HPLC Metoda C a dat compusul din titlu (4 mg, 8%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}FN_2O$, 324,2; m/z găsit, 325,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,90 (s, 2H), 8,08 - 8,02 (m, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 1H), 7,73 - 7,66 (m, 1H), 7,35 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 6,79 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 4,44 (s, 2H), 2,35 (s, 3H), 1,09 (s, 3H), 0,94 - 0,84 (m, 1H), 0,29 - 0,14 (m, 2H), 0,06 - -0,09 (m, 2H).

Exemplul 276: 1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metoxi-etanimină.



La o soluție de compus 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă (Exemplul 186, 35 mg, 0,11 mmol) în EtOH (5,7 mL) s-a adăugat clorhidrat de O-metilhidroxilamină (19 mg, 0,23 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la temperatura camerei timp de 10 minute și s-a adăugat $NaHCO_3$ (19 mg, 0,23 mmol). După 2 ore, s-a adăugat apă și faza apoasă a fost extrasă cu EtOAc. Faza organică a fost apoi uscată pe $MgSO_4$, filtrată și evaporată. Purificarea (FCC, SiO_2 , EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (6 mg, 15%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,15 - 8,11 (m, 1H), 7,73 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,71 - 7,68 (m, 1H), 7,63 - 7,58 (m, 1H), 7,30 - 7,22 (m, 1H), 6,65 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 0,88 - 0,83 (m, 1H), 0,56 - 0,50 (m, 2H), 0,40 - 0,34 (m, 2H).

Exemplul 277: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

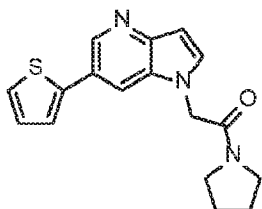


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}FN_3OS$, 315,1; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67

(d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,58 - 7,53 (m, 2H), 7,18 (dd, $J = 5,1, 3,7$ Hz, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 1,0$ Hz, 1H), 5,57 - 5,36 (m, 1H), 5,06 (d, $J = 2,5$ Hz, 2H), 4,61 - 4,49 (m, 1H), 4,37 - 4,20 (m, 2H), 4,04 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 278: 1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

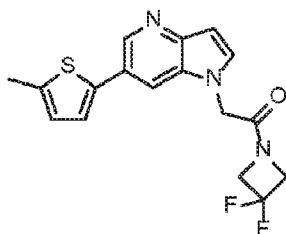
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 105. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}N_3OS$, 311,1; m/z găsit, 312,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 - 8,06 (m, 1H), 7,54 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,47 (dd, $J = 3,6, 1,2$ Hz, 1H), 7,42 (dd, $J = 5,1, 1,2$ Hz, 1H), 7,13 (dd, $J = 5,1, 3,6$ Hz, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,66 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,47 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,13 - 2,04 (m, 2H), 1,98 - 1,89 (m, 2H).

10

Exemplul 279: 1-(3,3-Difluoroazetidina-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

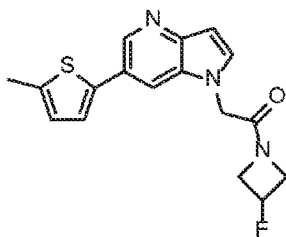


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106 înlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,87$ min la 254 nm.

20

Exemplul 280: 1-(3-Fluoroazetidina-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

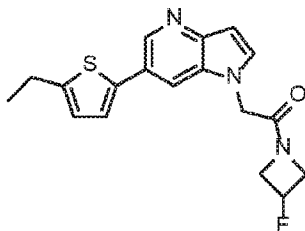


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3OS$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,01 - 7,97 (m, 1H), 7,52 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,82 - 6,77 (m, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,49 - 5,28 (m, 1H), 5,04 (d, $J = 2,0$ Hz, 2H), 4,58 - 4,46 (m, 1H), 4,42 - 4,26 (m, 2H), 4,17 - 4,03 (m, 1H), 2,52 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H).

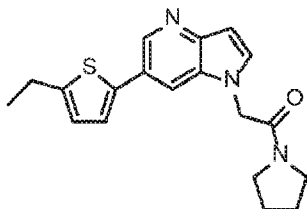
30

Exemplul 281: 2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidina-1-il)etanonă.



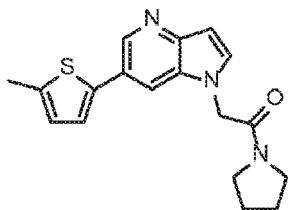
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128 înlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu acid 5-etiltiofen-2-boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3OS$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,01 - 7,99 (m, 1H), 7,52 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,27 (d, $J = 3,7$ Hz, 1H), 6,83 (dd, $J = 3,7, 1,0$ Hz, 1H), 6,66 - 6,62 (m, 1H), 5,48 - 5,28 (m, 1H), 5,04 (d, $J = 1,8$ Hz, 2H), 4,59 - 4,45 (m, 1H), 4,41 - 4,26 (m, 2H), 4,11 (dd, $J = 24,7, 11,6$ Hz, 1H), 2,89 (q, $J = 7,5$ Hz, 2H), 1,38 - 1,31 (m, 3H).

Exemplul 282: 2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



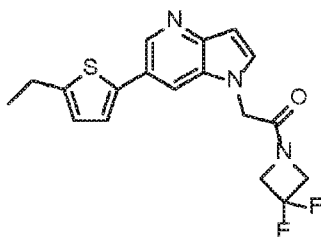
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 105 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu acid 5-etiltiofen-2-boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3OS$, 339,1; m/z găsit, 340,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,01 - 7,99 (m, 1H), 7,52 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,26 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,85 - 6,81 (m, 1H), 6,63 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,66 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,47 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,93 - 2,84 (m, 2H), 2,13 - 2,03 (m, 2H), 1,97 - 1,89 (m, 2H), 1,34 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 283: 2-[6-(5-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



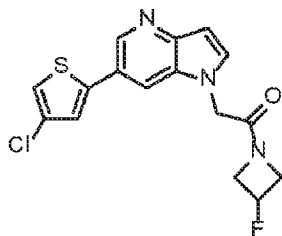
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 105 înlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,00 - 7,97 (m, 1H), 7,51 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,24 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,81 - 6,77 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,15 (s, 2H), 3,66 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,47 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,51 (s, 3H), 2,12 - 2,03 (m, 2H), 1,99 - 1,89 (m, 2H).

Exemplul 284: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



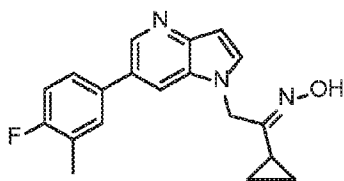
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3OS$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,02 - 7,99 (m, 1H), 7,56 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,35 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,89 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,72 (t, $J = 11,5$ Hz, 2H), 4,42 - 4,34 (m, 2H), 2,89 - 2,81 (m, 2H), 1,28 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 285: 2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



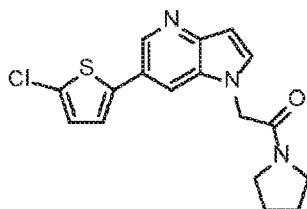
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 128 inlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$, 349,0; m/z găsit, 350,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,12 - 8,10 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,42 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,31 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,49 - 5,32 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,2$ Hz, 2H), 4,62 - 4,52 (m, 1H), 4,41 - 4,31 (m, 2H), 4,16 - 4,05 (m, 1H).

Exemplul 286: Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanon oximă.



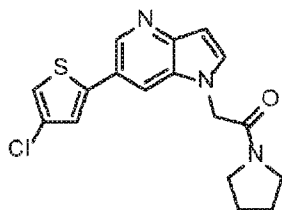
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 276 inlocuind clorhidratul de O-metilhidroxilamină cu clorhidrat de hidroxilamină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,89 - 8,85 (m, 2H), 8,17 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,71 - 7,67 (m, 1H), 7,65 - 7,58 (m, 1H), 7,29 - 7,18 (m, 1H), 6,91 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,43 (s, 2H), 2,39 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H), 1,23 - 1,14 (m, 1H), 0,60 - 0,47 (m, 4H).

Exemplul 287: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



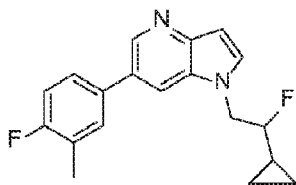
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 105 inlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu acid 5-clorotiofen-2-boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3OS$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,04 - 8,00 (m, 1H), 7,56 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,28 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,01 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 6,65 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,66 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,47 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,13 - 2,03 (m, 2H), 1,98 - 1,88 (m, 2H).

Exemplul 288: 2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



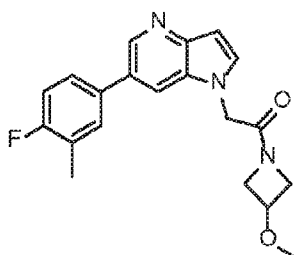
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 105 inlocuind acidul (4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3OS$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,58 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,30 (s, 1H), 6,66 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,67 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,47 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,13 - 2,04 (m, 2H), 1,98 - 1,89 (m, 2H).

Exemplul 289: (R/S)-1-(2-Ciclopropil-2-fluoro-etil)-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridină.



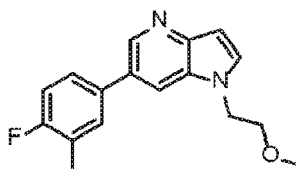
La o soluție de compus (R/S)-1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanol (Exemplul 274, 14 mg, 0,05 mmol) în DCM (1 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat DAST (29 μL, 0,22 mmol). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și după 30
 5 minute s-a adăugat o soluție apoasă saturată de NaHCO₃. Faza organică a fost separată, uscată pe MgSO₄, filtrată și evaporată pentru a da compusul din titlu (6,5 mg, 47%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₈F₂N₂, 312,1; m/z găsit, 313,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,62 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,19 - 8,15 (m, 1H), 7,72 - 7,66 (m, 2H), 7,62 - 7,56 (m, 1H), 7,26 (dd, *J* = 9,7, 8,5 Hz, 1H), 6,61 (dd, *J* = 3,2, 0,8 Hz, 1H), 4,66 - 4,56 (m, 2H), 4,32 - 4,15 (m, 1H), 2,33 (d, *J* = 1,9
 10 Hz, 3H), 1,05 - 0,96 (m, 1H), 0,57 - 0,48 (m, 2H), 0,45 - 0,34 (m, 2H).

Exemplul 290: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidina-1-il)etanonă.



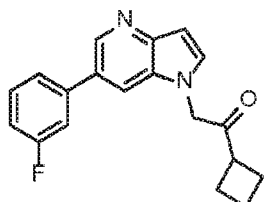
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O₂, 353,2; m/z găsit, 354,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,64 - 8,60 (m, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,66 (dd, *J* = 7,7, 2,4 Hz, 1H), 7,61 - 7,54 (m, 2H), 7,26 (t, *J* = 9,1 Hz, 1H), 6,59 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,41 - 4,35 (m, 1H), 4,31 - 4,22 (m, 1H), 4,13 - 4,00 (m, 2H), 3,75 - 3,68 (m, 1H), 3,23 (s, 3H), 2,33 (s, 3H).

Exemplul 291: Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-metoxietil)pirolo[3,2-b]piridină.

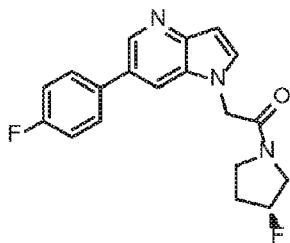


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 1-bromo-2-metoxietan. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₇H₁₇FN₂O, 284,1; m/z găsit, 285,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,88 (s, 1H), 8,76 (s, 1H), 8,04 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 7,81 (dd, *J* = 7,6, 2,4 Hz, 1H), 7,74 - 7,68 (m, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 1H), 6,76 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 4,58 (t, *J* = 5,1 Hz, 2H), 3,71 (t, *J* = 5,1 Hz, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,35 (d, *J* = 1,9 Hz, 3H).

Exemplul 292: 1-Ciclobutil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

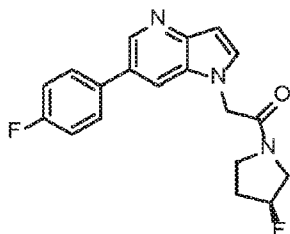


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(3-fluorofenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 2-bromo-1-ciclobutiletanonă. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇FN₂O, 308,1; m/z găsit, 309,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,61 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,58 - 7,42 (m, 4H), 7,15 - 7,08 (m, 1H), 6,69 (d, *J* = 3,3 Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,58 - 3,45 (m, 1H), 2,38 - 2,25 (m, 2H), 2,24 - 2,13 (m, 2H), 2,10 - 1,97 (m, 1H), 1,92 - 1,80 (m, 1H).

Exemplul 293: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă.

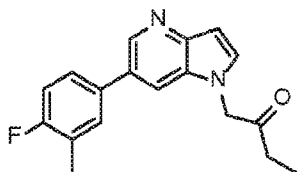
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană XBridge C18 (4,6 x 100mm, 5 μ m), fază mobilă de ACN 10-100% în NH_4OH 20mM în timp de 8 min și apoi s-a menținut la ACN 100% timp de 3 min, la un debit de 1 mL/min (temperatură = 45 °C). R_t = 5,62 min la 254 nm.

10 **Exemplul 294: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3S)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă.**



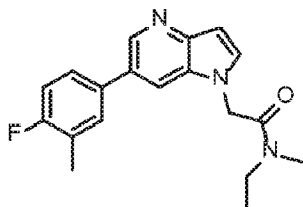
15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană XBridge C18 (4,6 x 100mm, 5 μ m), fază mobilă de ACN 10-100% în NH_4OH 20mM în timp de 8 min și apoi s-a menținut la ACN 100% timp de 3 min, la un debit de 1 mL/min (temperatură = 45 °C). R_t = 5,63 min la 254 nm.

20 **Exemplul 295: Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.**

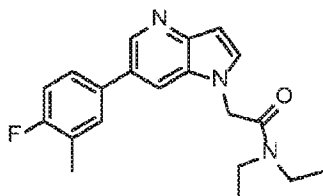


25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 1-bromobutan-2-onă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}FN_2O$, 296,1; m/z găsit, 297,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,86 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,00 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,72 - 7,67 (m, 1H), 7,65 - 7,59 (m, 1H), 7,26 - 7,20 (m, 1H), 6,91 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,49 (s, 2H), 2,72 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 2,39 (d, J = 2,1 Hz, 3H), 1,13 (t, J = 7,3 Hz, 3H).

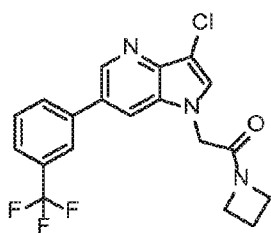
30 **Exemplul 296: N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.**



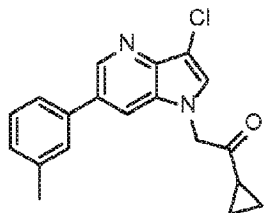
35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană XBridge C18 (4,6 x 100mm, 5 μ m), fază mobilă de ACN 10-100% în NH_4OH 20mM în timp de 8 min și apoi s-a menținut la ACN 100% timp de 3 min, la un debit de 1 mL/min (temperatură = 45 °C). R_t = 6,12 min la 254 nm.

Exemplul 297: N,N-Dietil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

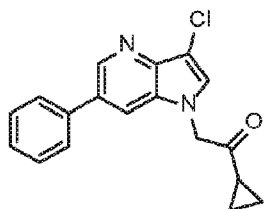
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{22}FN_3O$, 339,2; m/z găsit, 340,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,60 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,02 - 8,00 (m, 1H), 7,65 (dd, $J = 7,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,60 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,58 - 7,53 (m, 1H), 7,28 - 7,23 (m, 1H), 6,57 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,47 (q, $J = 7,1$ Hz, 2H), 3,30 - 3,26 (m, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 1,24 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H), 1,03 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H).

Exemplul 298: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$, 393,1; m/z găsit, 394,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,80 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,12 - 8,06 (m, 2H), 7,83 (s, 1H), 7,79 - 7,75 (m, 2H), 5,04 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 299: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropiletanonă.

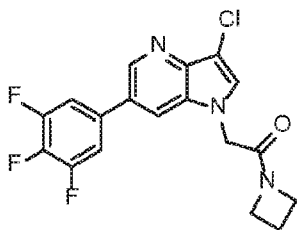
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClN_2O$, 324,1; m/z găsit, 325,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,39 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,50 (s, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,16 - 2,09 (m, 1H), 1,04 - 0,98 (m, 2H), 0,97 - 0,92 (m, 2H).

Exemplul 300: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropiletanonă.

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClN_2O$, 310,1; m/z găsit, 311,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,22 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,78 - 7,73 (m, 2H), 7,55 - 7,47 (m, 2H), 7,45 - 7,37 (m, 1H), 5,50 (s, 2H), 2,18 - 2,09 (m, 1H), 1,04 - 0,97 (m, 2H), 0,97 - 0,92 (m, 2H).

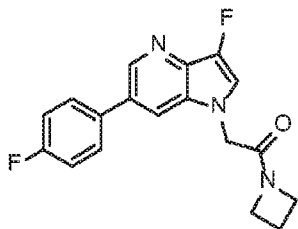
Exemplul 301: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

35



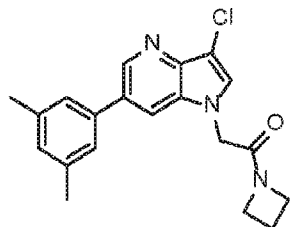
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,80 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,87 - 7,79 (m, 3H), 5,01 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,33 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 302: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



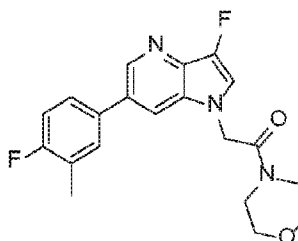
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,18 - 8,16 (m, 1H), 7,83 - 7,77 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,39 - 7,33 (m, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 303: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



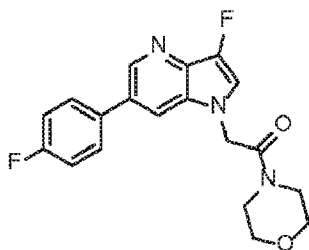
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}ClN_3O$, 353,1; m/z găsit, 354,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD $_3$ OD) δ 8,61 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,29 (s, 2H), 7,04 (s, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,30 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,09 - 4,01 (m, 2H), 2,44 - 2,31 (m, 8H).

Exemplul 304: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolinoetanonă.



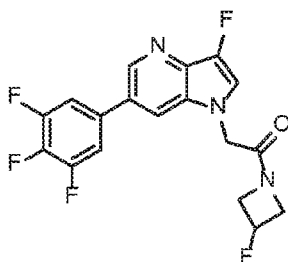
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 19) și acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O_2$, 371,1; m/z găsit, 372,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,69 - 7,66 (m, 1H), 7,63 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,61 - 7,55 (m, 1H), 7,31 - 7,24 (m, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,72 - 3,67 (m, 2H), 3,62 - 3,53 (m, 4H), 3,45 - 3,40 (m, 2H), 2,33 (s, 3H).

Exemplul 305: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolinoetanonă.



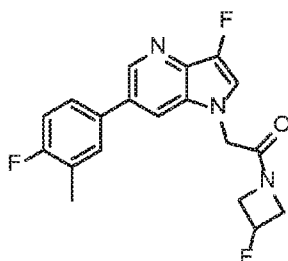
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolinoetanonă (Intermediar 19) și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O_2$, 357,1; m/z găsit, 358,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,67 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,19 - 8,16 (m, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 2H), 7,63 (d, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 2H), 5,24 (s, 2H), 3,72 - 3,67 (m, 2H), 3,61 - 3,53 (m, 4H), 3,45 - 3,41 (m, 2H).

Exemplul 306: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



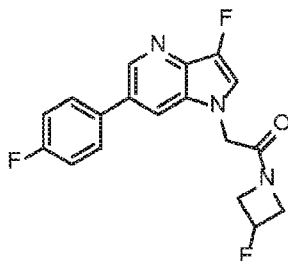
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}F_5N_3O$, 381,1; m/z găsit, 382,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CDCl₃) δ 8,66 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 7,64 (t, *J* = 2,0 Hz, 1H), 7,25 - 7,20 (m, 3H), 5,40 - 5,19 (m, 1H), 4,73 (s, 2H), 4,42 - 4,29 (m, 1H), 4,27 - 4,03 (m, 3H).

Exemplul 307: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



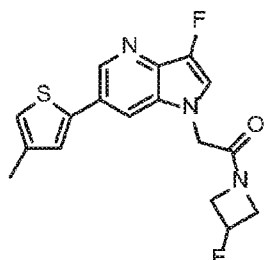
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, DMSO-*d*₆) δ 8,67 (d, *J* = 1,9 Hz, 1H), 8,15 (t, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,68 (dd, *J* = 7,5, 2,4 Hz, 1H), 7,64 (d, *J* = 2,1 Hz, 1H), 7,62 - 7,56 (m, 1H), 7,31 - 7,25 (m, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,01 (d, *J* = 3,4 Hz, 2H), 4,60 - 4,49 (m, 1H), 4,38 - 4,18 (m, 2H), 4,03 - 3,91 (m, 1H), 2,33 (d, *J* = 1,9 Hz, 3H).

Exemplul 308: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



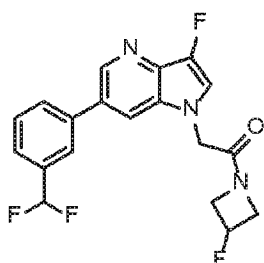
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92, utilizand 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,82 - 7,77 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 2H), 5,54 - 5,38 (m, 1H), 5,01 (d, $J = 3,1$ Hz, 2H), 4,60 - 4,50 (m, 1H), 4,37 - 4,19 (m, 2H), 4,02 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 309: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



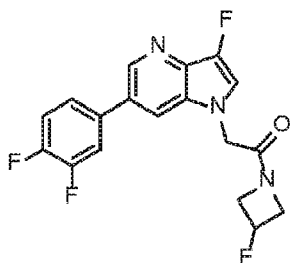
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92, utilizand 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,17 (s, 1H), 5,58 - 5,37 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,63 - 4,50 (m, 1H), 4,40 - 4,18 (m, 2H), 4,04 - 3,90 (m, 1H), 2,26 (s, 3H).

Exemplul 310: 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



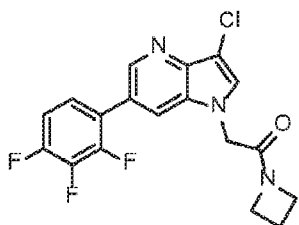
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92, utilizand 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și acid (3-(difluorometil)fenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,25 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,96 - 7,91 (m, 2H), 7,72 - 7,57 (m, 3H), 7,12 (t, $J = 55,8$ Hz, 1H), 5,58 - 5,36 (m, 1H), 5,04 (s, 2H), 4,62 - 4,49 (m, 1H), 4,39 - 4,18 (m, 2H), 4,04 - 3,87 (m, 1H).

Exemplul 311: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



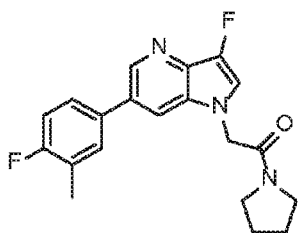
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92, utilizand 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 17) și acid (3,4-difluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,24 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,92 - 7,85 (m, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,65 - 7,54 (m, 2H), 5,57 - 5,36 (m, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,62 - 4,48 (m, 1H), 4,39 - 4,19 (m, 2H), 4,03 - 3,90 (m, 1H).

Exemplul 312: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



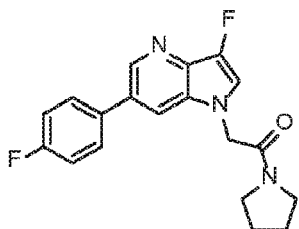
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$, 379,1; m/z găsit, 379,9 $[M+H]^+$, ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (s, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,69 (s, 1H), 7,46 - 7,35 (m, 1H), 7,33 - 7,22 (m, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,33 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,47 - 2,31 (m, 2H).

Exemplul 313: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



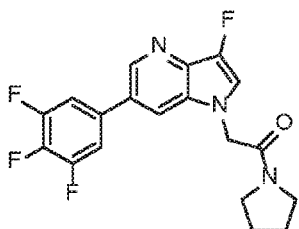
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 18) și acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 - 8,04 (m, 1H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,54 - 7,48 (m, 1H), 7,46 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 7,14 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,65 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 3,51 - 3,42 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,13 - 2,02 (m, 2H), 1,98 - 1,87 (m, 2H).

Exemplul 314: 2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 18) și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană XBridge C18 (4,6 x 100mm, 5 μ m), fază mobilă de ACN 10-100% în NH_4OH 20mM în timp de 8 min și apoi s-a menținut la ACN 100% timp de 3 min, la un debit de 1 mL/min (temperatură = 45 °C). $R_t = 5,92$ min la 254 nm.

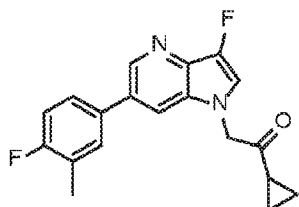
Exemplul 315: 2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(pirolidin-1-il)etanonă (Intermediar 18) și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,61 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,59 -

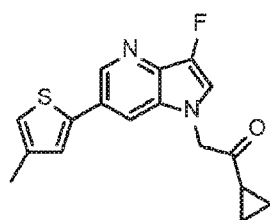
7,49 (m, 3H), 5,14 (s, 2H), 3,65 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,45 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,13 - 2,02 (m, 2H), 1,92 (p, $J = 6,9$ Hz, 2H).

Exemplul 316: 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



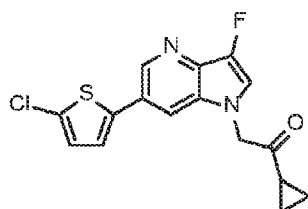
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_2N_2O$, 326,1; m/z găsit, 327,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,69 - 7,66 (m, 1H), 7,65 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,60 - 7,56 (m, 1H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,12 - 2,07 (m, 1H), 1,01 - 0,97 (m, 2H), 0,95 - 0,91 (m, 2H).

Exemplul 317: 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



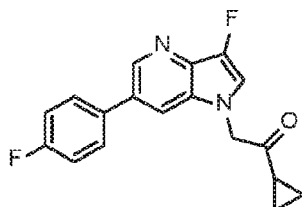
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}FN_2OS$, 314,1; m/z găsit, 315,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,64 (s, 1H), 7,42 (s, 1H), 7,16 (s, 1H), 5,41 (s, 2H), 2,26 (s, 3H), 2,16 - 2,06 (m, 1H), 1,09 - 0,90 (m, 4H).

Exemplul 318: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă.



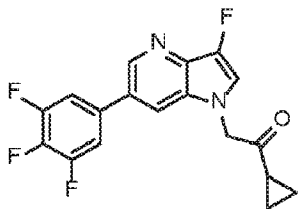
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{12}ClFN_2OS$, 334,0; m/z găsit, 335,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,47 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,21 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 5,41 (s, 2H), 2,15 - 2,06 (m, 1H), 1,04 - 0,97 (m, 2H), 0,97 - 0,90 (m, 2H).

Exemplul 319: 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



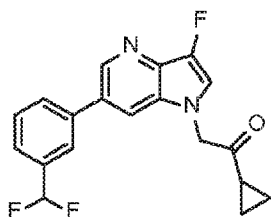
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_2N_2O$, 312,1; m/z găsit, 313,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,99 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,73 - 7,67 (m, 2H), 7,46 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,27 - 7,19 (m, 2H), 5,35 (s, 2H), 2,16 - 2,08 (m, 1H), 1,08 - 1,02 (m, 4H).

Exemplul 320: 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



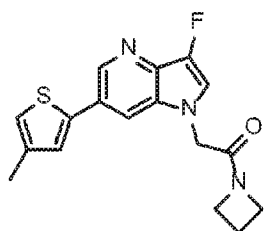
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}F_4N_2O$, 348,1; m/z găsit, 349,0 $[M+H]^+$.

5 **Exemplul 321:** 1-Ciclopil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil-3-fluoro-pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



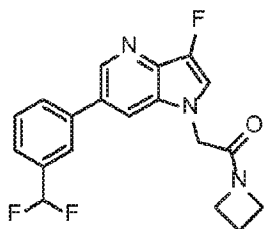
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 136. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_3N_2O$, 344,1; m/z găsit, 345,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,65 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,08 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,87 - 7,83 (m, 2H), 7,65 - 7,56 (m, 2H), 7,49 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 6,86 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 5,38 (s, 2H), 2,16 - 2,10 (m, 1H), 1,08 - 1,02 (m, 4H).

15 **Exemplul 322:** 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



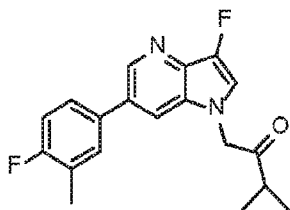
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182 înlocuind acidul (5-clorotiofen-2-il)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3OS$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,03 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,44 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,32 (d, $J = 1,3$ Hz, 1H), 7,02 (t, $J = 1,2$ Hz, 1H), 4,92 (s, 2H), 4,32 - 4,28 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,42 - 2,34 (m, 2H), 2,30 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H).

25 **Exemplul 323:** 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,65 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,15 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,90 - 7,85 (m, 2H), 7,66 - 7,57 (m, 2H), 7,51 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 6,87 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,31 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,43 - 2,34 (m, 2H).

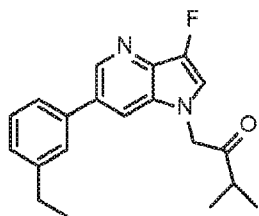
Exemplul 324: 1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



Etapa A: 1-(6-Bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-3-metilbutan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 15, utilizând 6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridină (Intermediar 6) și 1-bromo-3-metilbutan-2-onă.

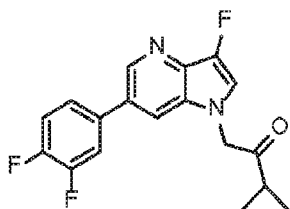
- 5 **Etapa B:** 1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92, utilizând 1-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-3-metilbutan-2-onă și acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_2N_2O$, 328,1; m/z găsit, 329,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,92 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,57 - 7,52 (m, 1H), 7,50 - 7,45 (m, 1H), 7,41 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,14 (dd, $J = 9,6, 8,4$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 2,90 - 2,82 (m, 1H), 2,35 (d, $J = 2,0$ Hz, 3H), 1,20 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 325: 1-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



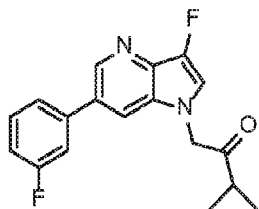
- 15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}FN_2O$, 324,2; m/z găsit, 325,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,96 - 7,92 (m, 1H), 7,51 - 7,48 (m, 1H), 7,48 - 7,44 (m, 1H), 7,41 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 7,39 - 7,35 (m, 1H), 7,26 - 7,22 (m, 1H), 5,28 (s, 2H), 2,92 - 2,81 (m, 1H), 2,73 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,29 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H), 1,20 (d, $J = 7,2$ Hz, 6H).

- 20 **Exemplul 326:** 1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



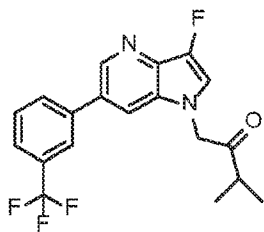
- 25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_2O$, 332,1; m/z găsit, 333,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,60 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,99 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,67 - 7,59 (m, 1H), 7,52 - 7,47 (m, 1H), 7,45 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,43 - 7,33 (m, 1H), 5,29 (s, 2H), 2,92 - 2,83 (m, 1H), 1,21 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 327: 1-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



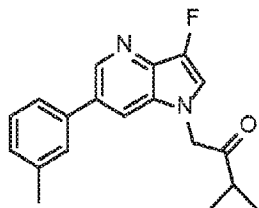
- 30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_2N_2O$, 314,1; m/z găsit, 315,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,54 - 7,47 (m, 2H), 7,48 - 7,40 (m, 2H), 7,18 - 7,08 (m, 1H), 5,29 (s, 2H), 2,93 - 2,81 (m, 1H), 1,21 (d, $J = 7,0$ Hz, 6H).

- 35 **Exemplul 328:** 1-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



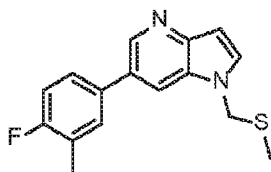
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_4N_2O$, 364,1; m/z găsit, 365,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,65 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,09 - 8,05 (m, 1H), 8,01 - 7,93 (m, 2H), 7,73 - 7,68 (m, 2H), 7,47 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 2,93 - 2,82 (m, 1H), 1,21 (d, $J = 6,8$ Hz, 6H).

Exemplul 329: 1-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il-3-metil-butan-2-onă.



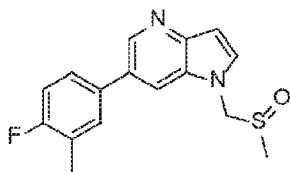
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}FN_2O$, 310,1; m/z găsit, 311,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,94 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,50 - 7,48 (m, 1H), 7,47 - 7,43 (m, 1H), 7,42 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,36 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,21 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 2,92 - 2,81 (m, 1H), 2,43 (s, 3H), 1,20 (d, $J = 7,0$ Hz, 6H).

Exemplul 330: 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfanilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



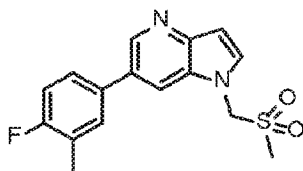
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridină și clorometil metil sulfură. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}FN_2S$, 286,1; m/z găsit, 287,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,66 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,30 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,78 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,71 - 7,68 (m, 1H), 7,63 - 7,58 (m, 1H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,49 (s, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

Exemplul 331: (R/S)-6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



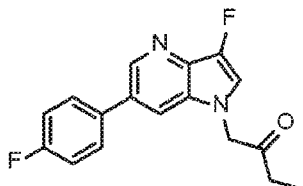
La o soluție de compus 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfanilmetil)pirolo[3,2-b]piridină (Exemplul 330, 155 mg, 0,54 mmol) în DCM (3 mL) răcită la 0 °C s-a adăugat HCl 4M (0,16 mL, 0,65 mmol). După 5 minute s-a adăugat MCPBA (140 mg, 0,81 mmol) și amestecul de reacție a fost agitat la 0 °C timp de 10 minute. La amestec s-a adăugat soluție apoasă saturată de $NaHCO_3$ și faza apoasă a fost extrasă de 2 ori cu DCM. Straturile organice combinate au fost uscate ($MgSO_4$), filtrate și evaporate. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (24 mg, 14%) împreună cu compusul 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină (Exemplul 332) (14 mg, 8%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}FN_2OS$, 302,1; m/z găsit, 303,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,68 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,34 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,71 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,69 - 7,66 (m, 1H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,27 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,70 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,69 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 5,45 (d, $J = 13,5$ Hz, 1H), 2,57 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H).

Exemplul 332: 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



Compusul din titlu a fost preparat cum s-a descris în Exemplul 331. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}FN_2O_2S$, 318,1; m/z găsit, 319,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,39 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,75 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,69 (dd, $J = 7,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,62 - 7,57 (m, 1H), 7,31 - 7,25 (m, 1H), 6,75 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,91 (s, 2H), 2,95 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H).

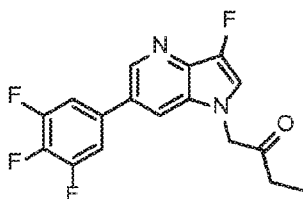
Exemplul 333: 1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



Etapă A: 1-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)butan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediar 15, utilizând 6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridină (Intermediar 6) și 1-bromobutan-2-onă.

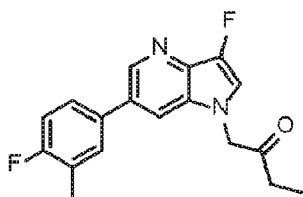
Etapă B: 1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 1-(6-bromo-3-fluoro-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)butan-2-onă și acid (4-fluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}F_2N_2O$, 300,1; m/z găsit, 301,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,16 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,38 - 7,30 (m, 2H), 5,22 (s, 2H), 2,60 - 2,53 (m, 2H), 0,98 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 334: 1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



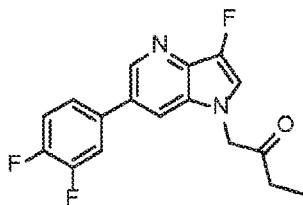
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{12}F_4N_2O$, 336,1; m/z găsit, 337,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,28 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,84 - 7,77 (m, 2H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 5,22 (s, 2H), 2,56 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 0,99 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 335: 1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



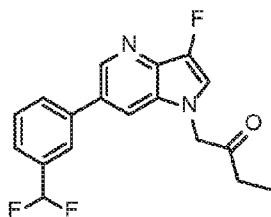
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_2N_2O$, 314,1; m/z găsit, 315,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,16 - 8,13 (m, 1H), 7,67 (dd, $J = 7,8, 2,1$ Hz, 1H), 7,63 - 7,54 (m, 2H), 7,27 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,22 (s, 2H), 2,55 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 0,98 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 336: 1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



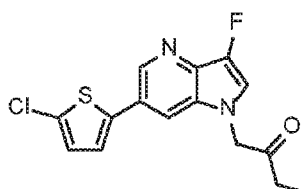
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}F_3N_2O$, 318,1; m/z găsit, 319,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,22 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,90 - 7,84 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,63 - 7,60 (m, 1H), 7,60 - 7,53 (m, 1H), 5,22 (s, 2H), 2,56 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 0,98 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 337: 1-[6-(3-(Difluorometil)fenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



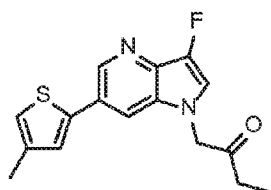
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_2O$, 332,1; m/z găsit, 333,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,65 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,09 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,88 - 7,82 (m, 2H), 7,65 - 7,55 (m, 2H), 7,46 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 6,85 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 2,62 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 1,09 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 338: 1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



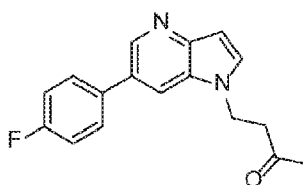
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{12}ClFN_2OS$, 322,0; m/z găsit, 323,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,98 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,43 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,30 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,02 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 2,61 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 1,10 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

Exemplul 339: 1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 333. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}FN_2OS$, 302,1; m/z găsit, 303,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,97 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,40 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,31 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,03 - 6,99 (m, 1H), 5,15 (s, 2H), 2,61 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 2,29 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H), 1,09 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H).

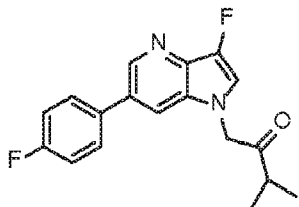
Exemplul 340: 4-[6-(4-Fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă.



La o soluție de compus 6-(4-fluorofenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină (Exemplul 27, etapa a, 30 mg, 0,14 mmol), clorură de aur (III) (2 mg, 0,007 mmol) și trifluorometansulfonat de argint (4 mg, 0,014 mmol) în DCE (1,5 mL) s-a adăugat metil vinil cetonă (35 μ L, 0,42 mmol). Amestecul

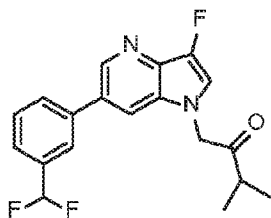
de reacție a fost încălzit la 100 °C. După 1 oră amestecul de reacție a fost răcit la temperatura camerei și solidele au fost filtrate. Solventul a fost apoi evaporat și brutul a fost purificat prin HPLC Metoda A pentru a da compusul din titlu (1 mg, 2%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}FN_2O$, 282,1; m/z găsit, 283,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,16 - 8,14 (m, 1H), 7,76 - 7,72 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,26 - 7,21 (m, 2H), 6,60 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 4,52 (t, $J = 6,5$ Hz, 2H), 3,09 (t, $J = 6,4$ Hz, 2H), 2,12 (s, 3H).

Exemplul 341: 1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



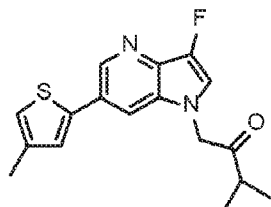
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_2N_2O$, 314,1; m/z găsit, 315,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,12 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 2H), 7,63 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 2H), 5,36 (s, 2H), 2,86 - 2,78 (m, 1H), 1,12 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 342: 1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



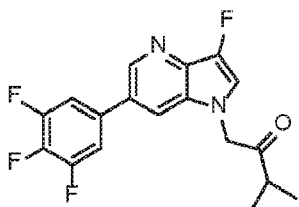
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_3N_2O$, 346,1; m/z găsit, 347,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,94 - 7,89 (m, 2H), 7,69 - 7,63 (m, 2H), 7,62 - 7,58 (m, 1H), 7,11 (t, $J = 55,8$ Hz, 1H), 5,38 (s, 2H), 2,87 - 2,77 (m, 1H), 1,12 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 343: 1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



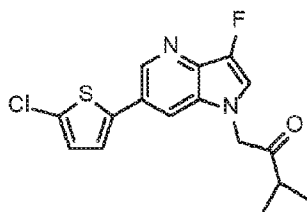
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}FN_2OS$, 316,1; m/z găsit, 317,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,65 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,61 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,40 (s, 1H), 7,16 (s, 1H), 5,35 (s, 2H), 2,87 - 2,78 (m, 1H), 2,26 (s, 3H), 1,13 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 344: 1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



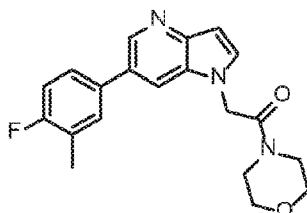
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_4N_2O$, 350,1; m/z găsit, 351,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,25 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,84 - 7,76 (m, 2H), 7,69 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 5,35 (s, 2H), 2,87 - 2,79 (m, 1H), 1,13 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 345: 1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



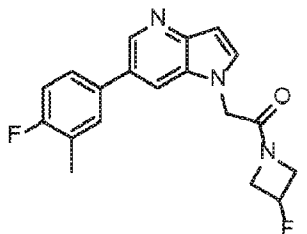
- Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 324. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}ClFN_2OS$, 336,0; m/z găsit, 337,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,92 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,44 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,30 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,02 (d, $J = 3,8$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 2,93 - 2,82 (m, 1H), 1,21 (d, $J = 7,0$ Hz, 6H).

Exemplul 346: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă.



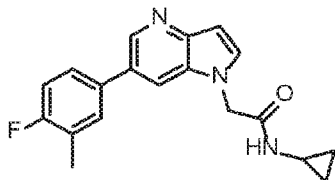
- Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O_2$, 353,2; m/z găsit, 354,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,61 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,69 - 7,62 (m, 1H), 7,61 - 7,52 (m, 2H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,74 - 3,66 (m, 2H), 3,63 - 3,56 (m, 4H), 3,48 - 3,42 (m, 2H), 2,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H).

- Exemplul 347: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



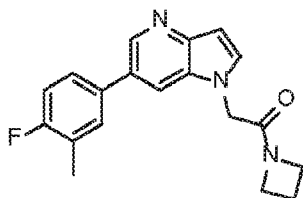
- Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,69 - 7,64 (m, 1H), 7,62 - 7,54 (m, 2H), 7,30 - 7,22 (m, 1H), 6,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,54 - 5,38 (m, 1H), 5,06 (d, $J = 5,3$ Hz, 2H), 4,59 - 4,47 (m, 1H), 4,36 - 4,19 (m, 2H), 4,03 - 3,91 (m, 1H), 2,33 (s, 3H).

Exemplul 348: N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



- Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (600 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,32 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,06 - 8,01 (m, 1H), 7,66 (dd, $J = 7,5, 2,5$ Hz, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,59 - 7,54 (m, 1H), 7,29 - 7,23 (m, 1H), 6,58 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 2,69 - 2,62 (m, 1H), 2,33 (s, 3H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,42 (m, 2H).

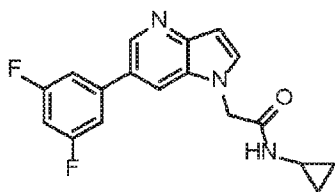
Exemplul 349: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,68 (dd, $J = 7,6, 2,3$ Hz, 1H), 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,27 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,20 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,31 - 2,21 (m, 2H).

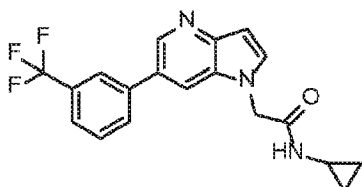
Compusul din Exemplul 349 poate fi de asemenea preparat din compusul din Exemplul 68 în prezență de Pd/C 10% în metanol la temperatura camerei sub atmosferă de H_2 .

Exemplul 350: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



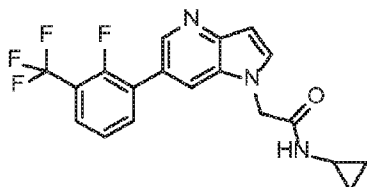
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,03 (s, 1H), 8,89 (s, 1H), 8,43 - 8,36 (m, 1H), 8,11 - 8,06 (m, 1H), 7,72 - 7,65 (m, 2H), 7,40 - 7,32 (m, 1H), 6,87 - 6,78 (m, 1H), 5,08 (s, 2H), 2,70 - 2,59 (m, 1H), 0,67 - 0,59 (m, 2H), 0,49 - 0,42 (m, 2H).

Exemplul 351: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



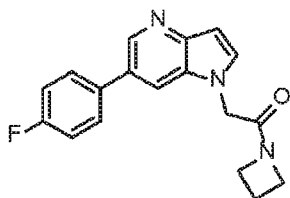
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,05 - 9,01 (m, 1H), 8,85 (s, 1H), 8,42 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,21 - 8,14 (m, 2H), 8,07 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,87 - 7,79 (m, 2H), 6,83 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,09 (s, 2H), 2,70 - 2,62 (m, 1H), 0,68 - 0,61 (m, 2H), 0,49 - 0,43 (m, 2H).

Exemplul 352: Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



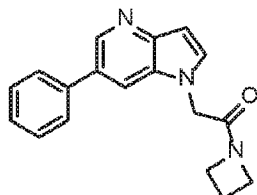
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 (s, 1H), 8,56 (s, 1H), 8,39 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,06 - 7,98 (m, 2H), 7,90 (t, $J = 6,8$ Hz, 1H), 7,61 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,81 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 2,68 - 2,60 (m, 1H), 0,67 - 0,60 (m, 2H), 0,47 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 353: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



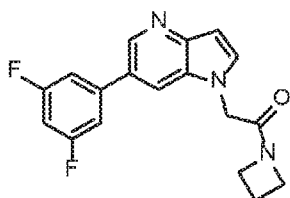
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,83 - 7,75 (m, 2H), 7,60 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,39 - 7,31 (m, 2H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,25 - 4,17 (m, 2H), 3,94 - 3,88 (m, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 354: 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



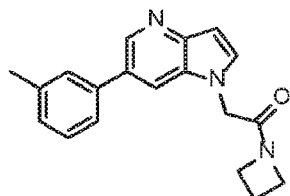
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}N_3O$, 291,1; m/z găsit, 292,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,66 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,11 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,73 (m, 2H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,54 - 7,48 (m, 2H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,32 - 2,20 (m, 2H).

Exemplul 355: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



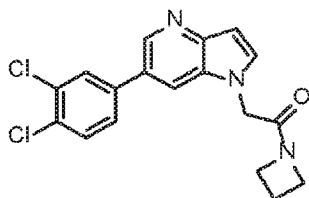
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,25 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,60 - 7,52 (m, 2H), 7,28 - 7,19 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 356: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



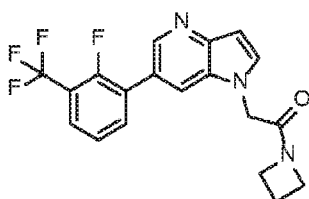
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}N_3O$, 305,2; m/z găsit, 306,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,97 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,06 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,69 - 7,61 (m, 2H), 7,47 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,31 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 5,23 (s, 2H), 4,29 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,93 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,44 (s, 3H), 2,37 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 357: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



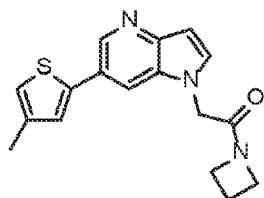
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,00 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,84 (s, 1H), 8,17 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,02 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,91 - 7,81 (m, 2H), 6,83 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,93 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,37 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 358: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



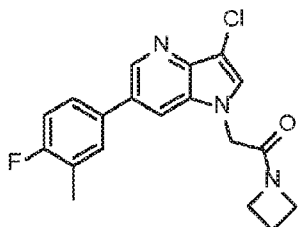
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,84 (s, 1H), 8,67 (s, 1H), 8,07 - 7,99 (m, 2H), 7,92 (t, $J = 7,2$ Hz, 1H), 7,62 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,17 (s, 2H), 4,27 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,36 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 359: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



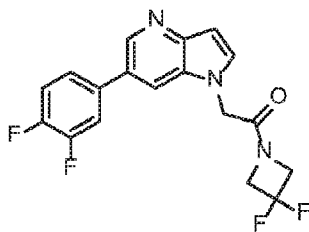
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 71 înlocuind acidul (2-fluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan pentru. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}N_3OS$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,86 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,56 - 7,50 (m, 1H), 7,29 - 7,23 (m, 1H), 6,76 (s, 1H), 5,15 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,93 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,37 - 2,25 (m, 5H).

Exemplul 360: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



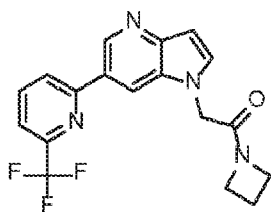
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 176. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClF_4N_3O$, 357,1; m/z găsit, 358,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,72 - 7,66 (m, 1H), 7,64 - 7,56 (m, 1H), 7,28 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 (d, $J = 1,9$ Hz, 3H), 2,32 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 361: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



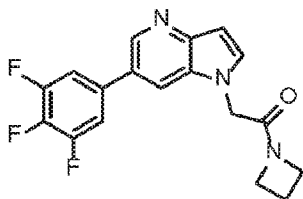
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 106. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,60 - 8,57 (m, 1H), 8,10 (dd, $J = 1,9, 1,0$ Hz, 1H), 7,68 - 7,61 (m, 1H), 7,58 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 7,54 - 7,48 (m, 1H), 7,42 - 7,33 (m, 1H), 6,70 - 6,66 (m, 1H), 5,12 (s, 2H), 4,66 (t, $J = 11,9$ Hz, 2H), 4,41 (t, $J = 12,2$ Hz, 2H).

Exemplul 362: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



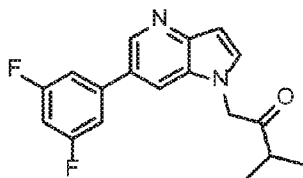
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102 înlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)-6-(trifluorometil)piridină. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_4O$, 360,1; m/z găsit, 361,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,08 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,22 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 8,08 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,72 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,63 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,2, 1,0$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,30 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,43 - 2,30 (m, 2H).

Exemplul 363: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



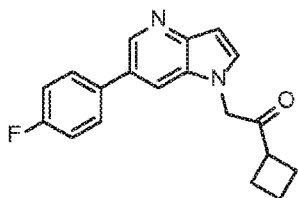
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_2N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,57 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,10 - 8,06 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,56 - 7,46 (m, 2H), 6,67 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,28 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,42 - 2,31 (m, 2H).

Exemplul 364: 1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă.



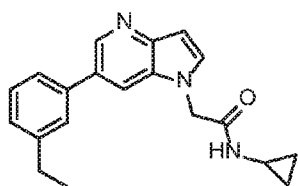
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 75. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_2N_2O$, 314,1; m/z găsit, 315,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,75 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,20 (dd, $J = 2,2, 0,9$ Hz, 1H), 7,63 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,60 - 7,51 (m, 2H), 7,28 - 7,19 (m, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,42 (s, 2H), 2,91 - 2,78 (m, 1H), 1,14 (d, $J = 6,9$ Hz, 6H).

Exemplul 365: 1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



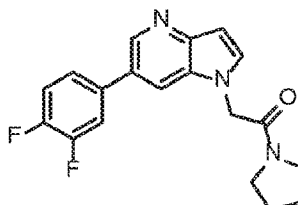
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 170 utilizând 6-(4-fluoro-fenil)-1H-pirol[3,2-b]piridină și 2-bromo-1-ciclobutiletanonă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}FN_2O$, 308,1; m/z găsit, 309,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,94 - 7,89 (m, 1H), 7,72 - 7,64 (m, 2H), 7,51 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,25 - 7,16 (m, 2H), 6,67 (dd, $J = 3,4, 1,0$ Hz, 1H), 5,21 - 5,13 (m, 2H), 3,55 - 3,43 (m, 1H), 2,37 - 2,23 (m, 2H), 2,22 - 2,11 (m, 2H), 2,09 - 1,95 (m, 1H), 1,91 - 1,79 (m, 1H).

Exemplul 366: N-Ciclopropil-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



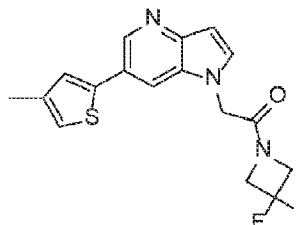
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropilacetamidă (intermediar din Etapa A, Exemplul 75) și acid (3-etilfenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,65 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,37 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 8,04 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,63 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,59 - 7,51 (m, 2H), 7,41 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,23 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,59 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 4,87 (s, 2H), 2,75 - 2,61 (m, 3H), 1,26 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H), 0,67 - 0,59 (m, 2H), 0,48 - 0,41 (m, 2H).

Exemplul 367: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 105. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,2 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,53 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,03 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,60 (ddd, $J = 12,0, 7,6, 2,3$ Hz, 1H), 7,54 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,49 - 7,43 (m, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 1H), 6,65 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,62 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,44 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 2,10 - 2,00 (m, 2H), 1,95 - 1,85 (m, 2H).

Exemplul 368: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



- Etapa A: 2-(6-Bromo-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetat de etil.** Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66 Etapa B. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{11}H_{11}BrN_2O_2$, 282,0; m/z găsit, 283,0 $[M+H]^+$.

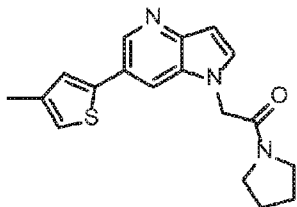
- Etapa B: Acid 2-(6-(4-metiltiofen-2-il)-1H-pirol[3,2-b]piridin-1-il)acetic.** Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66 Etapa A. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{14}H_{12}N_2O_2S$, 272,1; m/z găsit, 273,1 $[M+H]^+$.

- Etapa C: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.** Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 31 Etapa D. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz,

CD₃OD) δ 8,58 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,03 (dd, J = 2,0, 0,9 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,28 (d, J = 1,4 Hz, 1H), 6,99 - 6,97 (m, 1H), 6,64 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,64 (t, J = 11,9 Hz, 2H), 4,40 (t, J = 12,2 Hz, 2H), 2,29 (s, 3H).

Exemplul 369: 2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.

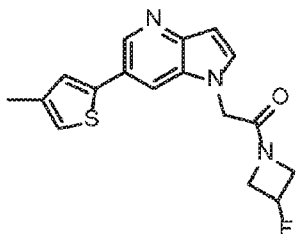
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 368. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₉N₃OS, 325,1; m/z găsit, 326,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,56 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,00 (dd, J = 1,9, 0,9 Hz, 1H), 7,51 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,27 (d, J = 1,3 Hz, 1H), 6,97 (s, 1H), 6,62 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,13 (s, 2H), 3,63 (t, J = 6,8 Hz, 2H), 3,46 (t, J = 6,9 Hz, 2H), 2,28 (s, 3H), 2,13 - 2,00 (m, 2H), 1,97 - 1,86 (m, 2H).

10

Exemplul 370: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

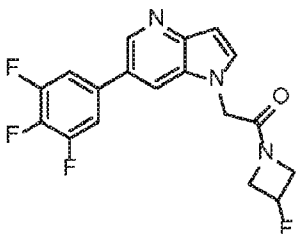


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 368. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₇H₁₆FN₃OS, 329,1; m/z găsit, 330,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,58 (d, J = 1,9 Hz, 1H), 8,01 (dd, J = 1,9, 0,9 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,28 (d, J = 1,4 Hz, 1H), 6,98 (s, 1H), 6,64 (dd, J = 3,4, 0,9 Hz, 1H), 5,51 - 5,26 (m, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,60 - 4,42 (m, 1H), 4,41 - 4,22 (m, 2H), 4,18 - 4,00 (m, 1H), 2,29 (s, 3H).

20

Exemplul 371: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

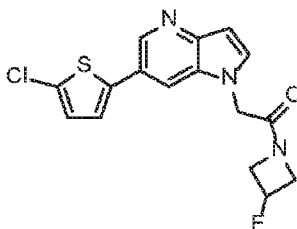


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₃F₄N₃O, 363,1; m/z găsit, 364,2 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CD₃OD) δ 8,59 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,60 (d, J = 3,3 Hz, 1H), 7,56 - 7,48 (m, 2H), 6,68 (dd, J = 3,3, 0,9 Hz, 1H), 5,51 - 5,29 (m, 1H), 5,07 (d, J = 3,5 Hz, 2H), 4,64 - 4,48 (m, 1H), 4,42 - 4,27 (m, 2H), 4,16 - 4,02 (m, 1H).

30

Exemplul 372: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



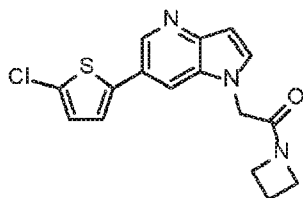
35

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 130. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₆H₁₃ClFN₃OS, 349,0; m/z găsit, 350,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, DMSO-*d*₆) δ

8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,06 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,43 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,20 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,4, 0,8$ Hz, 1H), 5,59 - 5,35 (m, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,65 - 4,47 (m, 1H), 4,40 - 4,16 (m, 2H), 4,07 - 3,88 (m, 1H).

Exemplul 373: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

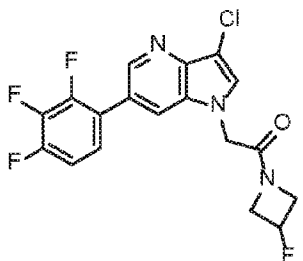
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}ClN_3OS$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,61 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,06 (dd, $J = 2,1, 0,8$ Hz, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,44 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,20 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,22 (m, 2H).

10

Exemplul 374: 2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

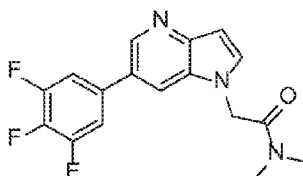


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}ClF_4N_3O$, 397,1; m/z găsit, 398,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,58 - 7,43 (m, 2H), 5,62 - 5,31 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,68 - 4,47 (m, 1H), 4,46 - 4,14 (m, 2H), 4,07 - 3,88 (m, 1H).

20

Exemplul 375: N,N-Dimetil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



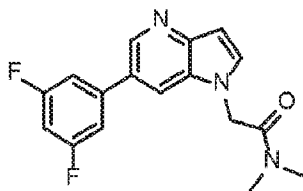
25

Etapă A: 2-(6-Bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridină și 2-bromo-N,N-dimetilacetamidă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{11}H_{12}BrN_3O$, 281,1; m/z găsit, 282,0 $[M+H]^+$.

30

Etapă B: N,N-dimetil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, Etapa A, utilizând 2-(6-bromo-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă și acid (3,4,5-trifluorofenil)boronic. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}F_3N_3O$, 333,1; m/z găsit, 334,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,55 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,53 - 7,46 (m, 2H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 376: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

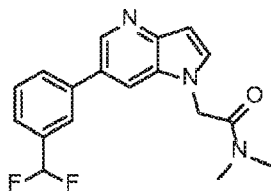


35

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58

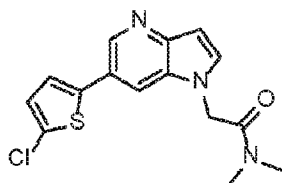
(d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,56 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 2H), 6,97 - 6,90 (m, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 377: 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



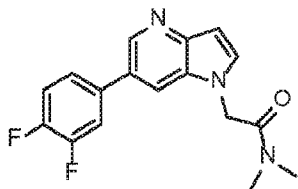
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,87 - 7,77 (m, 2H), 7,61 - 7,50 (m, 3H), 6,84 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,96 (s, 3H).

Exemplul 378: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



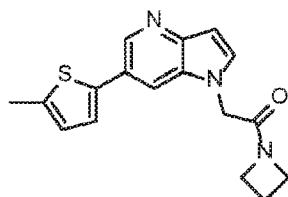
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}ClN_3OS$, 319,1; m/z găsit, 320,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,52 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,99 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,53 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,27 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,00 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 379: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



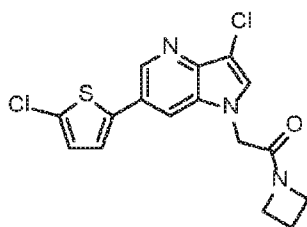
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,64 (ddd, $J = 11,9, 7,7, 2,3$ Hz, 1H), 7,54 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,53 - 7,47 (m, 1H), 7,40 - 7,32 (m, 1H), 6,66 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 380: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



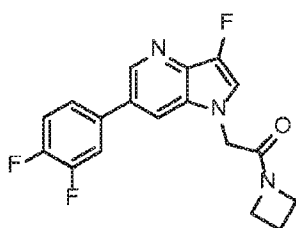
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 130. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}N_3OS$, 311,1; m/z găsit, 312,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,59 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,98 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,34 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,86 (dd, $J = 3,5, 1,3$ Hz, 1H), 6,57 (d, $J = 2,9$ Hz, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,49 (s, 3H), 2,39 - 2,17 (m, 2H).

Exemplul 381: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



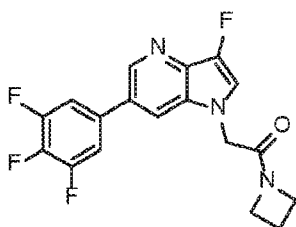
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}Cl_2N_3OS$, 365,0; m/z găsit, 365,8 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,16 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,49 (d, $J = 4,0$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 382: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoropirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



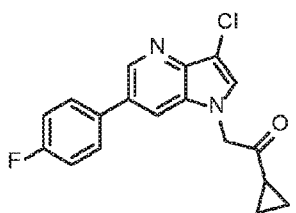
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,26 - 8,22 (m, 1H), 7,89 (ddd, $J = 12,4, 7,8, 2,2$ Hz, 1H), 7,71 - 7,53 (m, 3H), 4,95 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 383: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



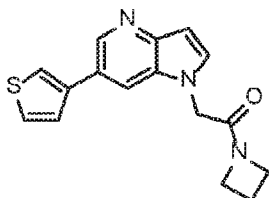
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,33 - 8,27 (m, 1H), 7,86 - 7,79 (m, 2H), 7,70 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 384: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă.



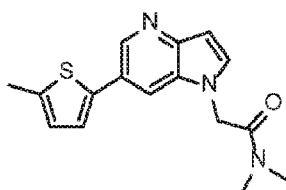
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 328,1; m/z găsit, 328,9 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,22 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,87 - 7,74 (m, 3H), 7,35 (t, $J = 8,9$ Hz, 2H), 5,49 (s, 2H), 2,19 - 2,08 (m, 1H), 1,07 - 0,89 (m, 4H).

Exemplul 385: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



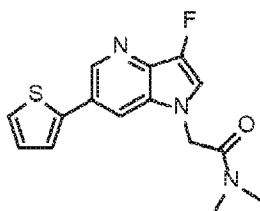
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}N_3OS$, 297,1; m/z găsit, 298,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,04 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,88 (s, 1H), 8,17 - 8,11 (m, 1H), 8,03 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,80 (dd, $J = 5,0$, 2,9 Hz, 1H), 7,76 (dd, $J = 5,0$, 1,4 Hz, 1H), 6,82 (dd, $J = 3,2$, 0,9 Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 4,29 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,94 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,37 - 2,28 (m, 2H).

Exemplul 386: Sare trifluoroacetat de N,N-dimetil-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



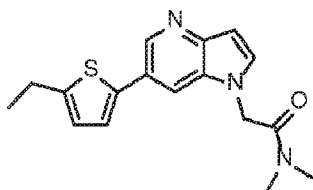
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375 înlocuind acidul (3,4,5-trifluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metil-2-tienil)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{17}N_3OS$, 299,1; m/z găsit, 300,0 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,79$ min la 254 nm.

Exemplul 387: 2-[3-Fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



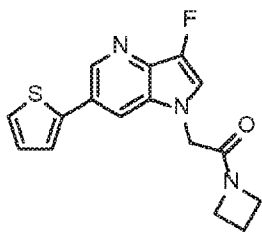
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}FN_3OS$, 303,1; m/z găsit, 304,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO) δ 8,69 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,14 (t, 1H), 7,61 - 7,57 (m, 3H), 7,21 - 7,16 (m, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 388: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



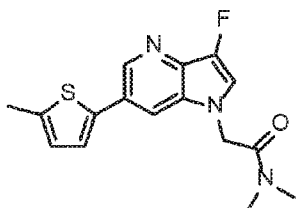
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{19}N_3OS$, 313,1; m/z găsit, 314,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,76 (s, 1H), 8,37 (br. s, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 1H), 7,45 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,93 (d, $J = 3,7$ Hz, 1H), 6,71 - 6,65 (m, 1H), 5,34 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,87 (d, $J = 6,1$ Hz, 5H), 1,29 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 389: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidina-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



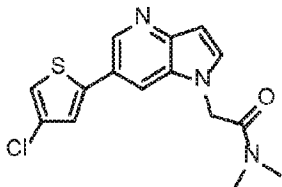
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}FN_3OS$, 315,1; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,71 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,63 - 7,59 (m, 2H), 7,22 - 7,15 (m, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,35 - 2,22 (m, 2H).

5 **Exemplul 390: 2-[3-Fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



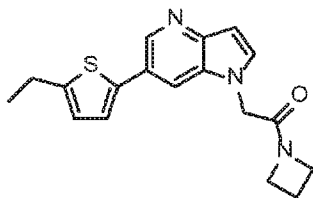
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92 înlocuind acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{16}FN_3OS$, 317,1; m/z găsit, 318,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,21 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 - 7,60 (m, 2H), 5,20 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,07 (s, 3H).

15 **Exemplul 391: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



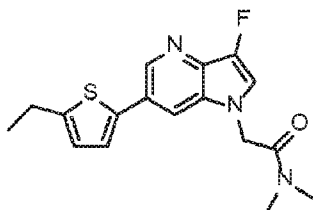
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375 înlocuind acidul (3,4,5-trifluorofenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}ClN_3OS$, 319,1; m/z găsit, 320,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,84 (s, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,85 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,68 (s, 2H), 6,73 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,36 (s, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,88 (s, 3H).

25 **Exemplul 392: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



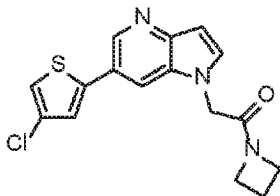
30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3OS$, 325,1; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,79 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,47 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,94 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,71 (d, $J = 3,1$ Hz, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,26 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,93 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,88 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,36 - 2,24 (m, 2H), 1,30 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 393: 2-[6-(5-Etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



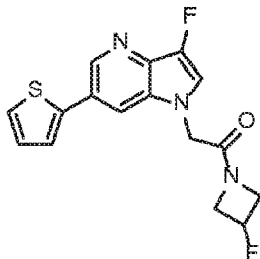
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{18}FN_3OS$, 331,1; m/z găsit, 332,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,58 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,39 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,90 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,91 - 2,80 (m, 5H), 1,28 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 394: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



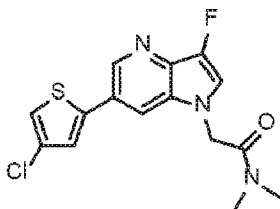
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 102 inlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}ClN_3OS$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,08 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,00 - 7,98 (m, 1H), 7,22 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,80 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 6,68 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 6,08 (dd, $J = 3,5, 1,0$ Hz, 1H), 4,42 (s, 2H), 3,61 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,29 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 1,69 - 1,59 (m, 2H).

Exemplul 395: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



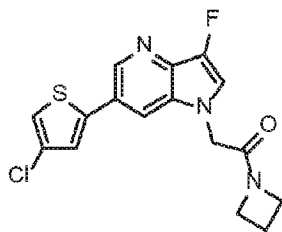
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}F_2N_3OS$, 333,1; m/z găsit, 334,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,66 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 - 7,57 (m, 2H), 7,19 (dd, $J = 5,1, 3,6$ Hz, 1H), 5,56 - 5,38 (m, 1H), 5,02 (d, $J = 2,8$ Hz, 2H), 4,65 - 4,50 (m, 1H), 4,41 - 4,18 (m, 2H), 4,05 - 3,92 (m, 1H).

Exemplul 396: 2-[6-(4-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



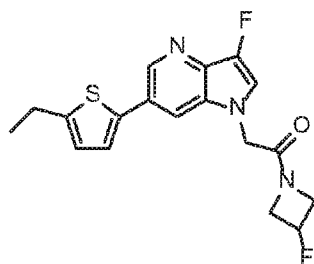
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182 inlocuind acidul (5-clorotiofen-2-il)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{13}ClFN_3OS$, 337,0; m/z găsit, 338,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,62 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,37 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,86 (dd, $J = 3,6, 1,2$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 397: Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



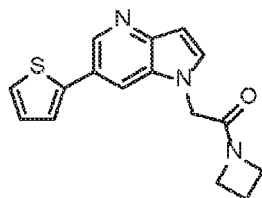
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182 înlocuind acidul (5-clorotiofen-2-il)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$, 349,0; m/z găsit, 350,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,21 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 (s, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 398: Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



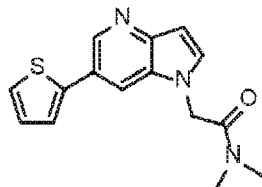
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3OS$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), faza mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 1,14$ min la 254 nm.

Exemplul 399: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



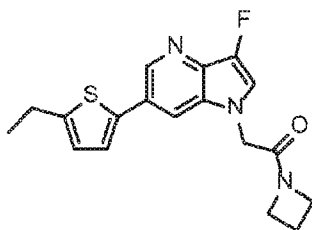
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}N_3OS$, 297,1; m/z găsit, 298,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,63 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 - 8,05 (m, 1H), 7,55 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,48 (dd, $J = 3,6, 1,2$ Hz, 1H), 7,43 (dd, $J = 5,1, 1,2$ Hz, 1H), 7,14 (dd, $J = 5,2, 3,6$ Hz, 1H), 6,68 - 6,62 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,27 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,43 - 2,31 (m, 2H).

Exemplul 400: N,N-Dimetil-2-[6-(2-tienil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



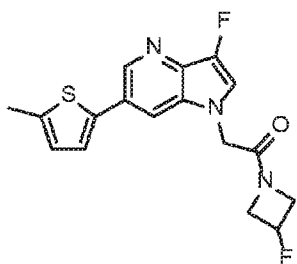
- Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{15}N_3OS$, 285,1; m/z găsit, 286,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 - 8,02 (m, 1H), 7,51 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,46 (dd, $J = 3,6, 1,1$ Hz, 1H), 7,42 (dd, $J = 5,1, 1,1$ Hz, 1H), 7,13 (dd, $J = 5,1, 3,6$ Hz, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,99 (s, 3H).

Exemplul 401: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



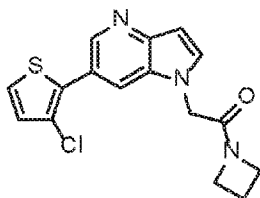
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3OS$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,60 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,01 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,44 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 7,30 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,87 - 6,83 (m, 1H), 4,92 (s, 2H), 4,34 - 4,26 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,94 - 2,84 (m, 2H), 2,44 - 2,33 (m, 2H), 1,35 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 402: Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



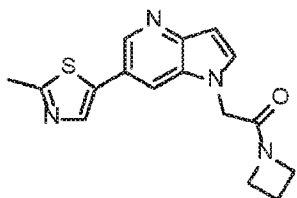
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182 înlocuind acidul (5-clorotiofen-2-il)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,71 (s, 1H), 8,34 (s, 1H), 7,67 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,36 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,85 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 5,54 - 5,31 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 3,1$ Hz, 2H), 4,71 - 4,55 (m, 1H), 4,49 - 4,28 (m, 2H), 4,19 - 4,02 (m, 1H), 2,54 (s, 3H).

Exemplul 403: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



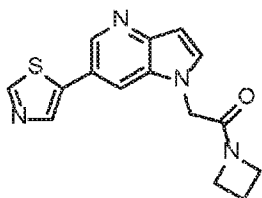
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}ClN_3OS$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,08 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,55 (d, $J = 5,4$ Hz, 1H), 7,11 (d, $J = 5,4$ Hz, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,31 - 4,24 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,41 - 2,31 (m, 2H).

Exemplul 404: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-metiltiazol-5-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



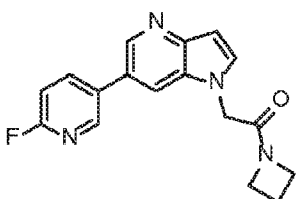
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102 înlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 2-metil-5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)tiazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{16}N_4OS$, 312,1; m/z găsit, 313,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,56 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 (dd, $J = 1,9, 0,9$ Hz, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,32 - 4,25 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,75 (s, 3H), 2,43 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 405: 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-tiazol-5-ilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102 înlocuind acidul (5-(trifluorometil)piridin-3-il)boronic cu 5-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)thiazol. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}N_4OS$, 298,1; m/z găsit, 299,0 $[M+H]^+$.

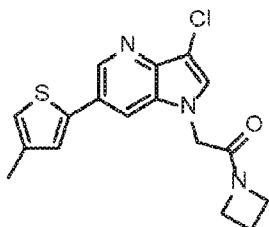
5 **Exemplul 406: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-fluoro-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}FN_4O$, 310,1; m/z găsit, 311,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,56 - 8,53 (m, 1H), 8,32 - 8,27 (m, 1H), 8,14 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 1H), 6,70 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,32 - 4,25 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,42 - 2,33 (m, 2H).

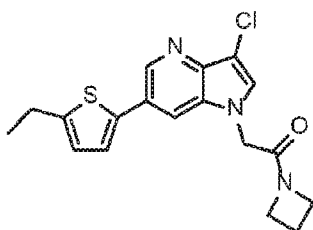
Exemplul 407: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

15



20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3OS$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,76 (s, 1H), 7,44 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,18 (t, $J = 1,3$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,95 - 3,89 (m, 2H), 2,33 - 2,25 (m, 5H).

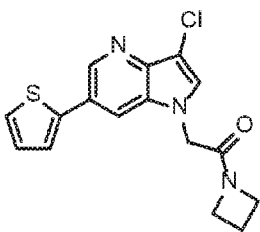
Exemplul 408: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}ClN_3OS$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,64 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,31 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,87 - 6,84 (m, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,36 - 4,29 (m, 2H), 4,08 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,94 - 2,86 (m, 2H), 2,45 - 2,35 (m, 2H), 1,35 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

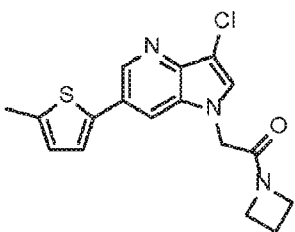
Exemplul 409: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

30



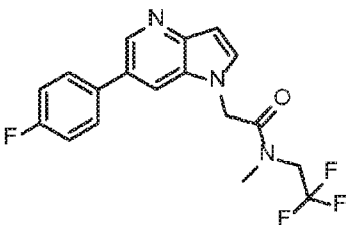
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClN_3OS$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 2H), 7,20 (dd, $J = 5,0, 3,6$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 410: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



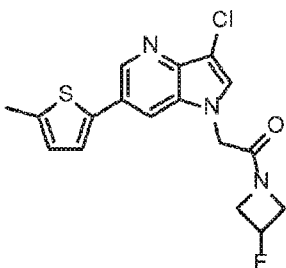
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3OS$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,03 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,29 (d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,84 - 6,79 (m, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,37 - 4,28 (m, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,53 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H), 2,44 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 411: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_4N_3O$, 365,1; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,01 - 7,99 (m, 1H), 7,71-7,66 (m, 2H), 7,54 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,24 - 7,18 (m, 2H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,37 (s, 2H), 4,16 (q, $J = 9,3$ Hz, 2H), 3,33 (s, 3H).

Exemplul 412: 2-[3-Cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

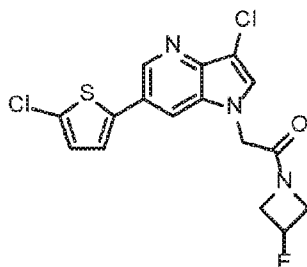


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146 înlocuind 2-bromo-N,N-dimetilacetamida cu 2-bromo-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 2) și acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClF_3N_3OS$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,63 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,59 (s, 1H), 7,29

(d, $J = 3,5$ Hz, 1H), 6,83 - 6,80 (m, 1H), 5,50 - 5,33 (m, 1H), 5,04 (d, $J = 3,5$ Hz, 2H), 4,64 - 4,54 (m, 1H), 4,45 - 4,30 (m, 2H), 4,16 - 4,06 (m, 1H), 2,52 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H).

Exemplul 413: 2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

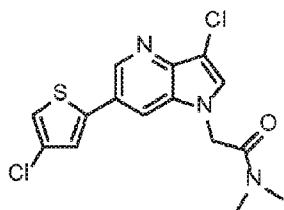
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{12}Cl_2FN_3OS$, 383,0; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,09 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,63 (s, 1H), 7,33 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,04 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 5,51 - 5,34 (m, 1H), 5,05 (d, $J = 4,0$ Hz, 2H), 4,66 - 4,57 (m, 1H), 4,46 - 4,31 (m, 2H), 4,16 - 4,06 (m, 1H).

10

Exemplul 414: 2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă.

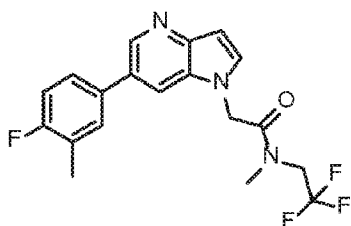


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146 înlocuind acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$, 353,0; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 7,84 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,33 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 6,80 (s, 1H), 6,62 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 6,52 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 4,46 (s, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,17 (s, 3H).

20

Exemplul 415: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă.

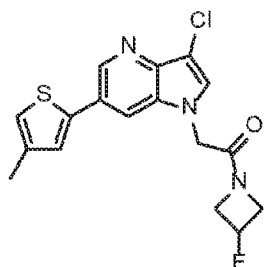


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_4N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,61 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,05 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,63 (dd, $J = 7,6, 2,4$ Hz, 1H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,57 - 7,53 (m, 1H), 7,26 (dd, $J = 9,7, 8,5$ Hz, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,39 (s, 2H), 4,19 (q, $J = 9,6$ Hz, 2H), 3,26 (s, 3H), 2,33 (d, $J = 1,8$ Hz, 3H).

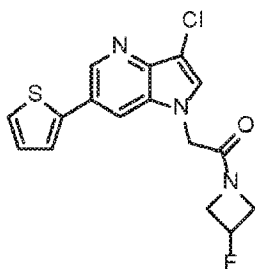
30

Exemplul 416: 2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



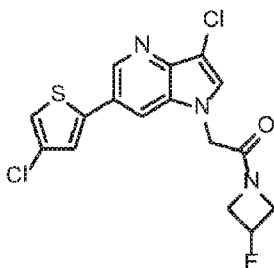
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146 înlocuind 2-bromo-N,N-dimetilacetamida cu 2-bromo-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 2) și acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(4-metiltiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3OS$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,77 (s, 1H), 7,43 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,18 (t, $J = 1,2$ Hz, 1H), 5,56 - 5,40 (m, 1H), 5,06 (d, $J = 3,2$ Hz, 2H), 4,63 - 4,54 (m, 1H), 4,40 - 4,31 (m, 1H), 4,31 - 4,21 (m, 1H), 4,04 - 3,93 (m, 1H), 2,27 (d, $J = 1,1$ Hz, 3H).

Exemplul 417: 2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



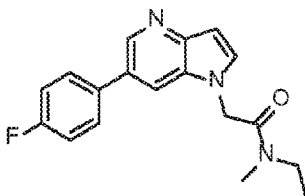
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}ClFN_3OS$, 349,0; m/z găsit, 350,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 9,58 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 9,01 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,47 - 8,39 (m, 2H), 8,03 (dd, $J = 5,1, 3,6$ Hz, 1H), 6,40 - 6,21 (m, 1H), 5,90 (d, $J = 2,9$ Hz, 2H), 5,48 - 5,35 (m, 1H), 5,28 - 5,14 (m, 1H), 5,14 - 5,03 (m, 1H), 4,88 - 4,75 (m, 1H).

Exemplul 418: 2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



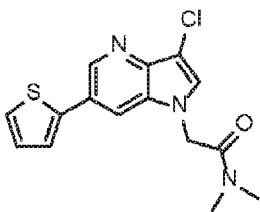
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146 înlocuind 2-bromo-N,N-dimetilacetamida cu 2-bromo-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă (Intermediar 2) și acidul (4-fluoro-3-metilfenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{12}Cl_2FN_3OS$, 383,0; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,75 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,24 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,67 - 7,61 (m, 2H), 5,59 - 5,39 (m, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,65 - 4,53 (m, 1H), 4,41 - 4,31 (m, 1H), 4,31 - 4,20 (m, 1H), 4,04 - 3,92 (m, 1H).

Exemplul 419: N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.



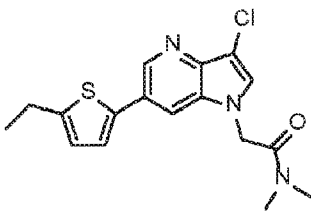
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. HPLC analitică a fost obținută pe Agilent Serie 1100 utilizând o coloană Inertsil ODS-3 (3 μ m, 50 x 3 mm), fază mobilă de ACN 5-99% cu TFA 0,05% în timp de 1,6 min și apoi s-a menținut la ACN 99% timp de 0,4 min, la un debit de 2,2 mL/min (temperatură = 50 °C). $R_t = 0,82$ min la 254 nm.

Exemplul 420: 2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



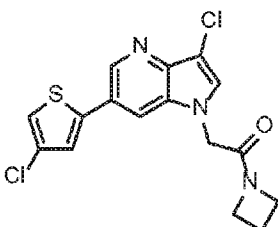
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}ClN_3OS$, 319,1; m/z găsit, 320,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,11 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,50 (dd, $J = 3,6, 1,2$ Hz, 1H), 7,45 (dd, $J = 5,2, 1,2$ Hz, 1H), 7,15 (dd, $J = 5,2, 3,6$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 421: 2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



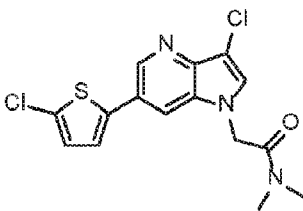
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{18}ClN_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,03 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,29 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,88 - 6,81 (m, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,93 - 2,85 (m, 2H), 1,35 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 422: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



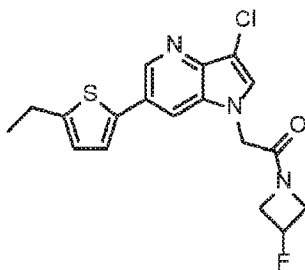
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 29 înlocuind acidul (3,4-difluorofenil)boronic cu 2-(4-clorotiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}Cl_2N_3OS$, 365,0; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,66 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,15 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,45 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,34 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,34 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,08 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,44 - 2,35 (m, 2H).

Exemplul 423: 2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



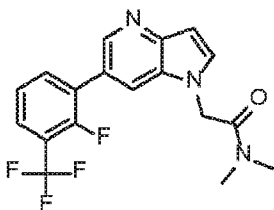
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$, 353,0; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,61 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,07 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,32 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,03 (d, $J = 4,0$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 424: 2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



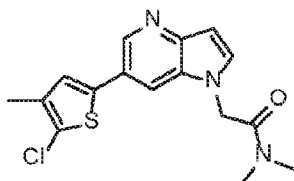
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}ClFN_3OS$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,64 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,06 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,30 (d, $J = 3,6$ Hz, 1H), 6,86 - 6,83 (m, 1H), 5,50 - 5,33 (m, 1H), 5,04 (d, $J = 3,5$ Hz, 2H), 4,65 - 4,55 (m, 1H), 4,45 - 4,29 (m, 2H), 4,18 - 4,05 (m, 1H), 2,94 - 2,85 (m, 2H), 1,35 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H).

Exemplul 425: 2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



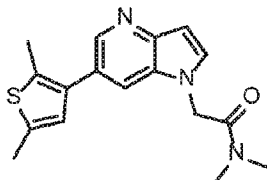
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_4N_3O$, 365,1; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 - 8,59 (m, 1H), 7,78 - 7,74 (m, 1H), 7,73 - 7,68 (m, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 1H), 7,39 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,34 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 6,81 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 3,00 (s, 3H).

Exemplul 426: 2-[6-(5-Cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



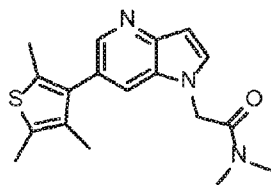
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375 inlocuind acidul (3,4,5-trifluorofenil)boronic cu 2-(5-cloro-4-metiltiofen-2-il)-4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{16}ClN_3OS$, 333,1; m/z găsit, 334,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,58 (s, 1H), 7,32 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,01 (s, 1H), 6,76 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 4,92 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,22 (s, 3H).

Exemplul 427: 2-[6-(2,5-Dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



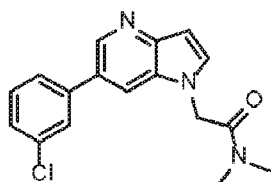
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{19}N_3OS$, 313,1; m/z găsit, 314,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,49 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,51 (s, 1H), 7,32 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 6,76 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 6,73 (s, 1H), 4,91 (s, 2H), 3,07 (s, 3H), 2,99 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,44 (s, 3H).

Exemplul 428: N,N-Dimetil-2-6-[2,4,5-trimetil-3-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



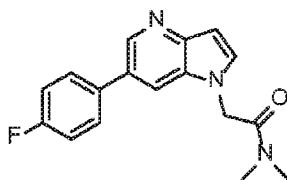
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375 inlocuind acidul (3,4,5-trifluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(2,4,5-trimetiltiofen-3-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{21}N_3OS$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,32 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,41 - 7,38 (m, 1H), 7,35 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,78 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,06 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,26 (s, 3H), 1,92 (s, 3H).

Exemplul 429: 2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



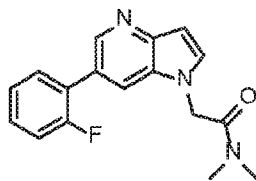
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3O$, 313,1; m/z găsit, 314,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,67 (s, 1H), 7,66 (dd, $J = 2,0$, 0,9 Hz, 1H), 7,59 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,52 - 7,46 (m, 1H), 7,38 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,35 - 7,31 (m, 2H), 6,78 (dd, $J = 3,4$, 0,9 Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 3,00 (s, 3H).

Exemplul 430: 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



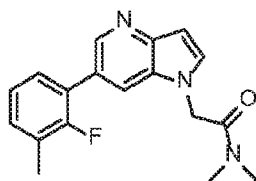
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3O$, 297,1; m/z găsit, 298,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,10 - 8,08 (m, 1H), 7,80-7,74 (m, 2H), 7,57 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,36 - 7,30 (m, 2H), 6,58 (dd, $J = 3,3$, 0,8 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 431: 2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3O$, 297,1; m/z găsit, 298,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,49 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,00 (s, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,58 (dd, $J = 8,1$, 1,8 Hz, 1H), 7,47 - 7,41 (m, 1H), 7,38 - 7,31 (m, 2H), 6,61 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

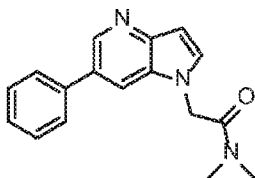
Exemplul 432: 2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,46 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,40 - 7,34 (m, 1H), 7,34 - 7,29 (m, 1H),

7,21 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,32 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H).

Exemplul 433: *N,N*-Dimetil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă.

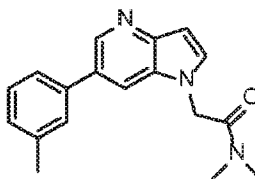


5

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{17}N_3O$, 279,1; m/z găsit, 280,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,11 - 8,09 (m, 1H), 7,76 - 7,72 (m, 2H), 7,56 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,50 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 7,40 - 7,35 (m, 1H), 6,58 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

10

Exemplul 434: *N,N*-Dimetil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

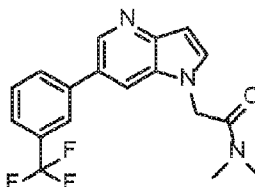


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3O$, 293,2; m/z găsit, 294,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,07 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,57 - 7,54 (m, 2H), 7,54 - 7,50 (m, 1H), 7,38 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,21 - 7,16 (m, 1H), 6,57 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,40 (s, 3H).

20

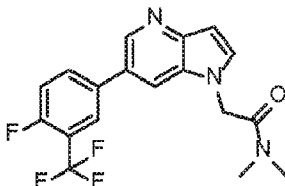
Exemplul 435: *N,N*-Dimetil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,22 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 8,09 - 8,05 (m, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,75 - 7,71 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,13 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 436: 2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-*N,N*-dimetil-acetamidă.

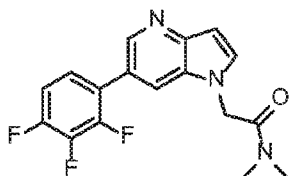


30

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_4N_3O$, 365,1; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,20 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 8,14 - 8,08 (m, 1H), 8,06 (dd, $J = 6,8, 2,4$ Hz, 1H), 7,68 - 7,63 (m, 1H), 7,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

35

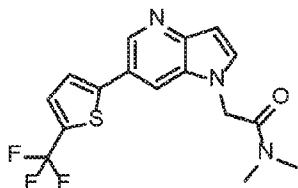
Exemplul 437: *N,N*-Dimetil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}F_3N_3O$, 333,1; m/z găsit, 334,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,48 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,64 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,49 - 7,42 (m, 2H), 6,62 (dd, $J = 3,3$, 0,8 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

5

Exemplul 438: *N,N*-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

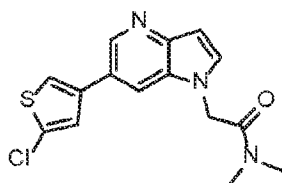


10

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375 înlocuind acidul (3,4,5-trifluorofenil)boronic cu 4,4,5,5-tetrametil-2-(5-(trifluorometil)tiofen-2-il)-1,3,2-dioxaborolan. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{14}F_3N_3OS$, 353,1; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,25 (dd, $J = 1,9$, 0,9 Hz, 1H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,59 - 7,56 (m, 1H), 7,54 - 7,51 (m, 1H), 6,71 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,99 (s, 3H).

15

Exemplul 439: 2-[6-(5-Cloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-*N,N*-dimetil-acetamidă.

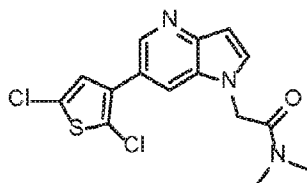


20

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{14}ClN_3OS$, 319,1; m/z găsit, 320,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,60 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,24 (dd, $J = 1,8$, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,43 (d, $J = 5,8$ Hz, 1H), 7,24 (d, $J = 5,8$ Hz, 1H), 6,74 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,33 (s, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,97 (s, 3H).

25

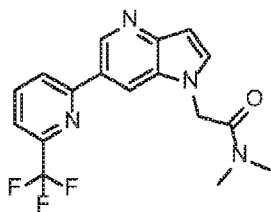
Exemplul 440: 2-[6-(2,5-Dicloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-*N,N*-dimetil-acetamidă.



30

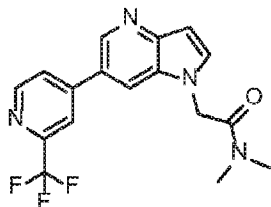
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{15}H_{13}Cl_2N_3OS$, 353,0; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,51 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,99 - 7,96 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,19 (s, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,97 (s, 3H).

Exemplul 441: *N,N*-Dimetil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



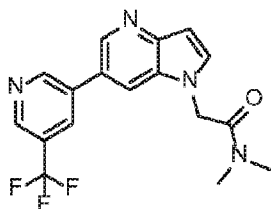
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_3N_4O$, 348,1; m/z găsit, 349,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,08 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,21 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 8,08 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,72 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,99 (s, 3H).

Exemplul 442: *N,N*-Dimetil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



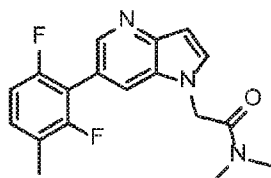
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_3N_4O$, 348,1; m/z găsit, 349,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,79 - 8,72 (m, 2H), 8,34 (s, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,06 - 8,00 (m, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 1H), 6,73 - 6,68 (m, 1H), 5,32 (s, 2H), 3,22 (s, 3H), 2,99 (s, 3H).

Exemplul 443: *N,N*-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



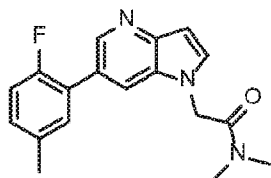
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_3N_4O$, 348,1; m/z găsit, 349,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 9,16 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,90 - 8,84 (m, 1H), 8,67 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,49 - 8,46 (m, 1H), 8,25 - 8,22 (m, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 6,70 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,30 (s, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 444: 2-[6-(2,6-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-*N,N*-dimetil-acetamidă.



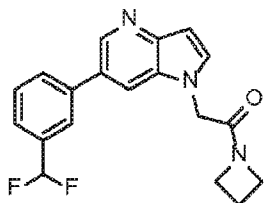
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,35 - 8,33 (m, 1H), 7,93 - 7,91 (m, 1H), 7,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,32 - 7,25 (m, 1H), 7,03 - 6,98 (m, 1H), 6,69 (dd, $J = 3,4, 0,9$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,17 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 2,32 - 2,29 (m, 3H).

Exemplul 445: 2-[6-(2-Fluoro-5-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-*N,N*-dimetil-acetamidă.



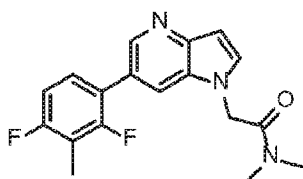
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,47 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,59 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,40 - 7,35 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 6,60 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,36 (s, 3H).

Exemplul 446: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



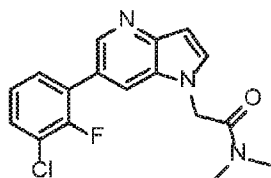
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,17 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,96 - 7,91 (m, 2H), 7,69 - 7,56 (m, 3H), 7,12 (t, $J = 55,8$ Hz, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,30 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 447: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



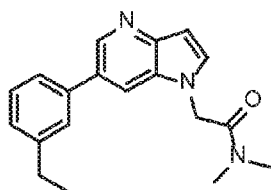
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,44 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,60 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,48 - 7,39 (m, 1H), 7,23 - 7,16 (m, 1H), 6,60 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,26 - 2,23 (m, 3H).

Exemplul 448: 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



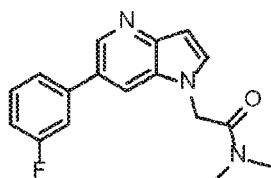
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,49 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,66 - 7,59 (m, 2H), 7,60 - 7,53 (m, 1H), 7,36 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 6,62 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 449: 2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

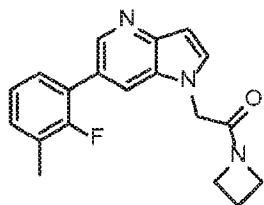


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3O$, 307,2; m/z găsit, 308,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,09 - 8,04 (m, 1H), 7,59 - 7,49 (m, 3H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,58 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,70 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 450: 2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

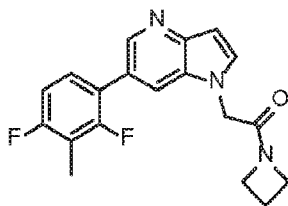


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3O$, 297,1; m/z găsit, 298,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 3H), 7,57 - 7,50 (m, 1H), 7,23 - 7,16 (m, 1H), 6,59 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

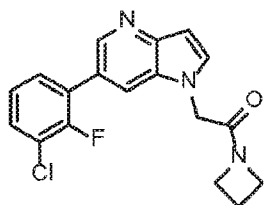
Exemplul 451: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,48 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,62 (d, $J = 3,2$ Hz, 1H), 7,41 - 7,37 (m, 1H), 7,35 - 7,29 (m, 1H), 7,22 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,20 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H), 2,30 - 2,21 (m, 2H).

10 **Exemplul 452: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**

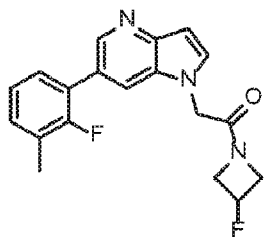


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,45 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,63 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,50 - 7,41 (m, 1H), 7,24 - 7,17 (m, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 4,98 (s, 2H), 4,20 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,31 - 2,21 (m, 5H).

Exemplul 453: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

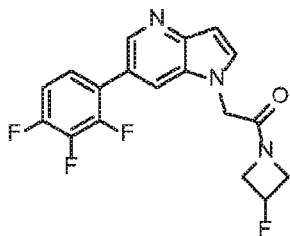
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 - 8,04 (m, 1H), 7,66 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 1H), 7,60 - 7,55 (m, 1H), 7,40 - 7,34 (m, 1H), 6,64 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,30 - 2,22 (m, 2H).

25 **Exemplul 454: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



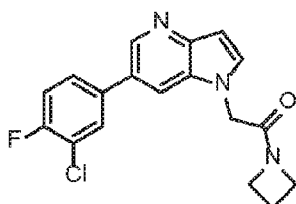
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,49 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,36 - 7,29 (m, 1H), 7,23 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,63 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,54 - 5,36 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 4,7$ Hz, 2H), 4,59 - 4,48 (m, 1H), 4,36 - 4,18 (m, 2H), 4,02 - 3,90 (m, 1H), 2,33 (d, $J = 2,2$ Hz, 3H).

35 **Exemplul 455: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



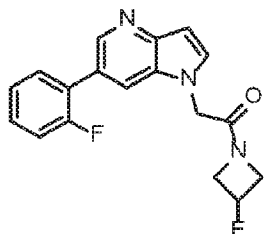
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,67 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,51 - 7,45 (m, 2H), 6,65 (dd, $J = 3,3$, 0,9 Hz, 1H), 5,54 - 5,36 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 4,6$ Hz, 2H), 4,59 - 4,49 (m, 1H), 4,37 - 4,18 (m, 2H), 4,02 - 3,90 (m, 1H).

Exemplul 456: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,18 - 8,15 (m, 1H), 7,98 (dd, $J = 7,2$, 2,2 Hz, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 1H), 7,62 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,55 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 6,61 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,21 (m, 2H).

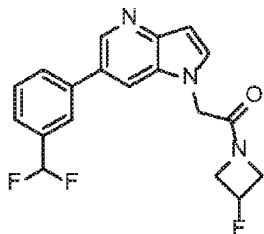
- 15 **Exemplul 457: 1-(3-Fluorazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



- 20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 (t, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,65 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,64 - 7,56 (m, 1H), 7,49 - 7,42 (m, 1H), 7,40 - 7,32 (m, 2H), 6,64 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 5,55 - 5,34 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,0$ Hz, 2H), 4,61 - 4,46 (m, 1H), 4,37 - 4,17 (m, 2H), 4,03 - 3,88 (m, 1H).

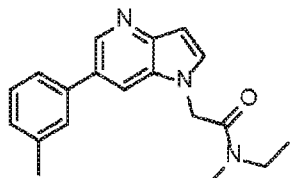
Exemplul 458: 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluorazetidin-1-il)etanonă.

25



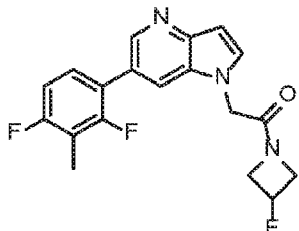
- 30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 1,9$, 0,9 Hz, 1H), 7,95 - 7,91 (m, 2H), 7,69 - 7,62 (m, 2H), 7,62 - 7,57 (m, 1H), 7,12 (t, $J = 55,8$ Hz, 1H), 6,63 (dd, $J = 3,3$, 0,8 Hz, 1H), 5,56 - 5,36 (m, 1H), 5,10 (d, $J = 2,3$ Hz, 2H), 4,60 - 4,47 (m, 1H), 4,37 - 4,18 (m, 2H), 4,04 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 459: N-Etil-N-metil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



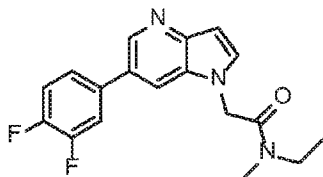
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3O$, 307,2; m/z găsit, 308,1 $[M+H]^+$.

5 **Exemplul 460: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.**



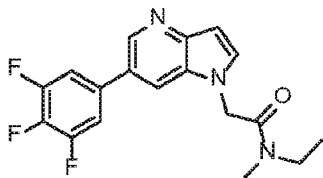
10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,46 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,48 - 7,41 (m, 1H), 7,24 - 7,18 (m, 1H), 6,63 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,53 - 5,36 (m, 1H), 5,06 (d, $J = 4,8$ Hz, 2H), 4,58 - 4,48 (m, 1H), 4,36 - 4,19 (m, 2H), 4,01 - 3,91 (m, 1H), 2,25 (s, 3H).

Exemplul 461: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il-N-etil-N-metil-acetamidă.



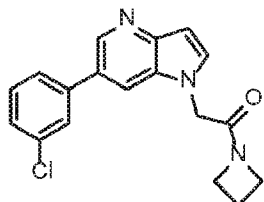
15 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,1 $[M+H]^+$.

Exemplul 462: N-Etil-N-metil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



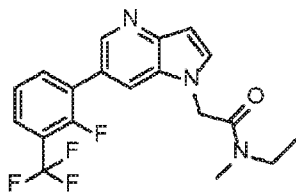
20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$.

Exemplul 463: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 102. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}ClN_3O$, 325,1; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,83 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,72 (m, 1H), 7,62 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,53 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,47 - 7,41 (m, 1H), 6,61 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,21 (m, 2H).

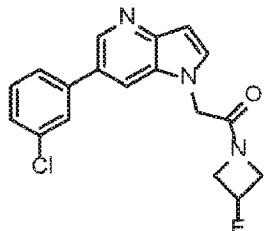
30 **Exemplul 464: N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.**



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_4N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$.

Exemplul 465: 2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

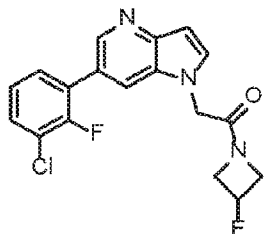
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClF_2N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,82 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,74 (d, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,65 - 7,61 (m, 1H), 7,56 - 7,50 (m, 1H), 7,46 - 7,41 (m, 1H), 6,62 (d, $J = 3,0$ Hz, 1H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,09 (s, 2H), 4,60 - 4,49 (m, 1H), 4,36 - 4,19 (m, 2H), 4,00 - 3,91 (m, 1H).

10

Exemplul 466: 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

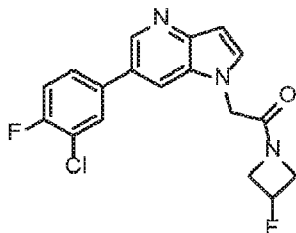


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,20 (s, 1H), 7,98 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,81 - 7,75 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,55 (t, $J = 8,9$ Hz, 1H), 6,63 (dd, $J = 3,2, 0,9$ Hz, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 2,9$ Hz, 2H), 4,60 - 4,48 (m, 1H), 4,37 - 4,19 (m, 2H), 4,02 - 3,90 (m, 1H).

20

Exemplul 467: 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

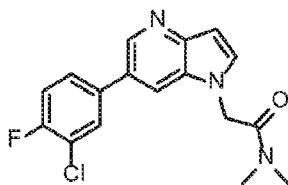


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 128. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (dd, $J = 2,2, 0,9$ Hz, 1H), 7,98 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,80 - 7,75 (m, 1H), 7,63 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,55 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 6,62 (dd, $J = 3,3, 0,8$ Hz, 1H), 5,54 - 5,37 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 2,8$ Hz, 2H), 4,59 - 4,48 (m, 1H), 4,36 - 4,19 (m, 2H), 4,01 - 3,90 (m, 1H).

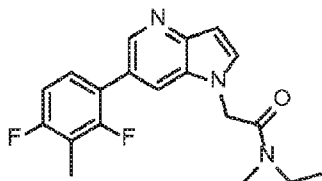
30

Exemplul 468: 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-r)henil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il-N,N-dimetil-acetamidă.



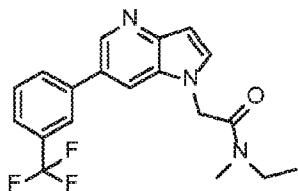
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 375. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 (dd, $J = 2,0, 0,9$ Hz, 1H), 7,83 (dd, $J = 7,0, 2,3$ Hz, 1H), 7,69 - 7,62 (m, 1H), 7,55 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,35 (t, $J = 8,9$ Hz, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,21 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 469: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă.



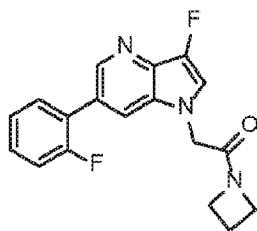
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}F_2N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,37 - 8,33 (m, 1H), 7,93 - 7,87 (m, 1H), 7,59 (dd, $J = 8,5, 3,3$ Hz, 1H), 7,33 - 7,24 (m, 1H), 7,04 - 6,96 (m, 1H), 6,73 - 6,66 (m, 1H), 5,26 (s, 0,8H), 5,22 (s, 1,2H), 3,54 (q, $J = 7,1$ Hz, 0,8H), 3,42 (q, $J = 7,1$ Hz, 1,2H), 3,15 (s, 1,8H), 2,93 (s, 1,2H), 2,33 - 2,27 (m, 3H), 1,26 (t, $J = 7,2$ Hz, 1,2H), 1,11 (t, $J = 7,2$ Hz, 1,8H).

Exemplul 470: N-Etil-N-metil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



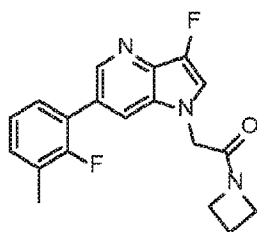
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_3N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,59 - 8,57 (m, 1H), 8,11 - 8,06 (m, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,94 - 7,90 (m, 1H), 7,68 - 7,63 (m, 2H), 7,56 (dd, $J = 7,3, 3,3$ Hz, 1H), 6,67 (dd, $J = 3,3, 0,9$ Hz, 1H), 5,26 (s, 0,8H), 5,23 (s, 1,2H), 3,54 (q, $J = 7,1$ Hz, 0,8H), 3,43 (q, $J = 7,1$ Hz, 1,2H), 3,16 (s, 1,8H), 2,94 (s, 1,2H), 1,29 (t, $J = 7,2$ Hz, 1,2H), 1,12 (t, $J = 7,2$ Hz, 1,8H).

Exemplul 471: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



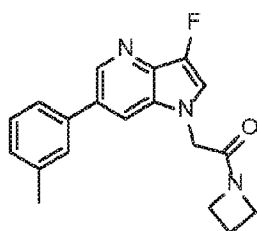
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_3N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,54 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,69 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 - 7,57 (m, 1H), 7,52 - 7,44 (m, 1H), 7,41 - 7,33 (m, 2H), 4,94 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,32 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 472: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



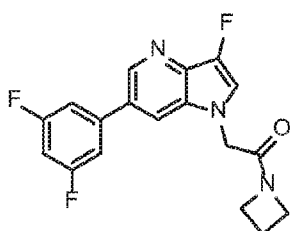
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,51 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,44 - 7,31 (m, 2H), 7,23 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,21 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 (d, $J = 2,2$ Hz, 3H), 2,30 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 473: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,68 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,16 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,63 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,60 - 7,51 (m, 2H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,31 - 2,22 (m, 2H).

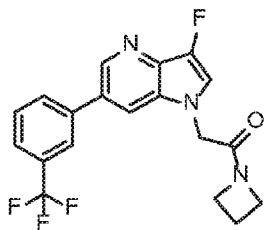
- 15 **Exemplul 474: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**



- 20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,32 (t, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,70 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,62 - 7,56 (m, 2H), 7,30 - 7,23 (m, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,26 - 4,19 (m, 2H), 3,94 - 3,87 (m, 2H), 2,35 - 2,24 (m, 2H).

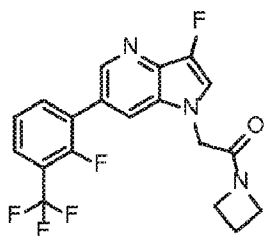
Exemplul 475: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

25



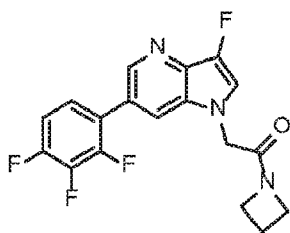
- 30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,31 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,12 - 8,06 (m, 2H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,70 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 476: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



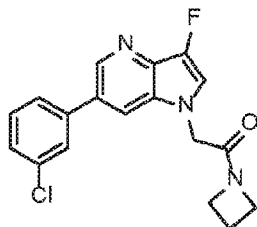
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,56 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,19 - 8,14 (m, 1H), 7,99 - 7,93 (m, 1H), 7,89 - 7,81 (m, 1H), 7,73 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,57 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 477: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



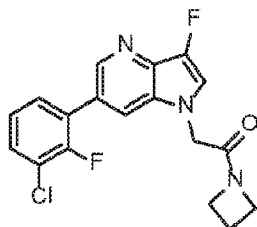
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,54 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,14 - 8,10 (m, 1H), 7,73 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,52 - 7,45 (m, 2H), 4,95 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,30 - 2,20 (m, 2H).

Exemplul 478: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



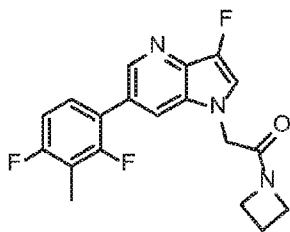
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClF_2N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,13 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,75 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,68 - 7,62 (m, 1H), 7,52 - 7,45 (m, 2H), 7,44 - 7,38 (m, 1H), 4,97 (s, 2H), 4,32 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,44 - 2,33 (m, 2H).

Exemplul 479: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



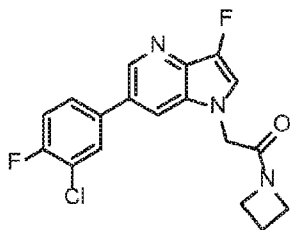
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, MeOD) δ 8,90 - 8,81 (m, 2H), 8,09 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,69 - 7,57 (m, 2H), 7,45 - 7,31 (m, 1H), 5,20 (s, 2H), 4,41 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,14 - 4,02 (m, 2H), 2,50 - 2,36 (m, 2H).

Exemplul 480: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



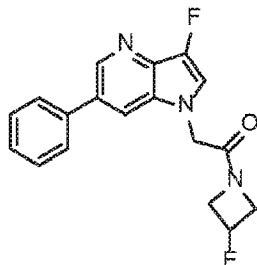
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,94 - 8,90 (m, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,15 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,63 - 7,51 (m, 1H), 7,20 - 7,12 (m, 1H), 5,25 (s, 2H), 4,44 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,09 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,49 - 2,36 (m, 2H), 2,34 - 2,27 (m, 3H).

Exemplul 481: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluorofenil)-3-fluoropirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



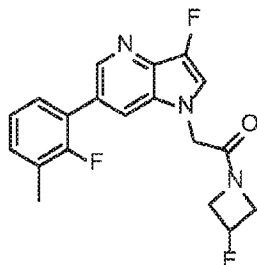
- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,58 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,14 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,81 (dd, $J = 7,0$, 2,3 Hz, 1H), 7,66 - 7,59 (m, 1H), 7,53 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,34 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 4,95 (s, 2H), 4,32 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 4,06 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,44 - 2,32 (m, 2H).

15 **Exemplul 482: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.**

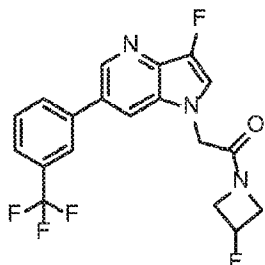


- 20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,70 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,19 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,78 - 7,74 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,55 - 7,49 (m, 2H), 7,44 - 7,38 (m, 1H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,03 (d, $J = 2,7$ Hz, 2H), 4,61 - 4,50 (m, 1H), 4,38 - 4,18 (m, 2H), 4,02 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 483: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

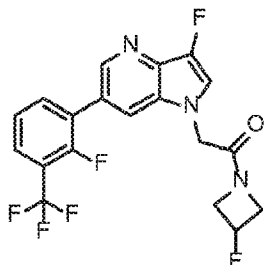


- 25
30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,52 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,51 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,37 (td, $J = 7,5$, 1,7 Hz, 1H), 7,32 - 7,26 (m, 1H), 7,19 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,47 - 5,30 (m, 1H), 5,00 (d, $J = 2,1$ Hz, 2H), 4,61 - 4,50 (m, 1H), 4,41 - 4,28 (m, 2H), 4,15 - 4,04 (m, 1H), 2,36 (d, $J = 2,3$ Hz, 3H).

Exemplul 484: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

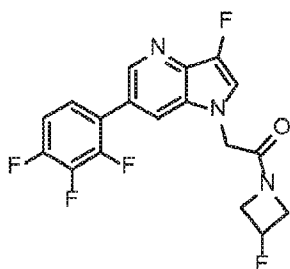
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,31 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,12 - 8,05 (m, 2H), 7,80 - 7,72 (m, 2H), 7,70 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,09 - 5,00 (m, 2H), 4,62 - 4,50 (m, 1H), 4,40 - 4,17 (m, 2H), 4,04 - 3,91 (m, 1H).

10 **Exemplul 485: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**

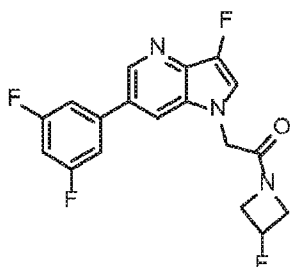


15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}F_5N_3O$, 413,1; m/z găsit, 414,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,56 (s, 1H), 8,18 (s, 1H), 7,95 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,85 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,63 - 7,52 (m, 1H), 5,57 - 5,35 (m, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,64 - 4,48 (m, 1H), 4,41 - 4,16 (m, 2H), 4,03 - 3,89 (m, 1H).

20 **Exemplul 486: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.**

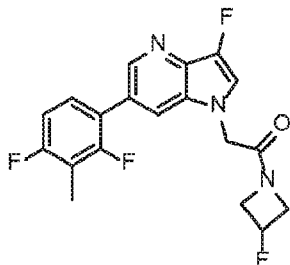


25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{12}F_5N_3O$, 381,1; m/z găsit, 382,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,54 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,73 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,53 - 7,44 (m, 2H), 5,55 - 5,35 (m, 1H), 5,01 (d, $J = 3,9$ Hz, 2H), 4,62 - 4,49 (m, 1H), 4,39 - 4,17 (m, 2H), 4,01 - 3,90 (m, 1H).

Exemplul 487: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

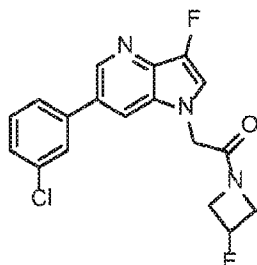
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}F_4N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,32 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,71 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,61 - 7,54 (m, 2H), 7,30 - 7,24 (m, 1H), 5,56 - 5,38 (m, 1H), 5,03 (d, $J = 1,8$ Hz, 2H), 4,61 - 4,49 (m, 1H), 4,39 - 4,18 (m, 2H), 4,03 - 3,89 (m, 1H).

Exemplul 488: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



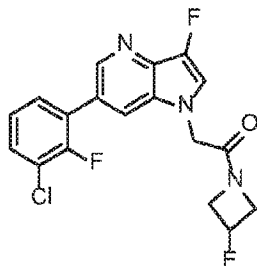
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 - 8,45 (m, 1H), 8,06 (s, 1H), 7,69 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,51 - 7,41 (m, 1H), 7,22 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 5,55 - 5,36 (m, 1H), 5,00 (d, $J = 4,0$ Hz, 2H), 4,61 - 4,47 (m, 1H), 4,37 - 4,17 (m, 2H), 4,01 - 3,87 (m, 1H), 2,25 (s, 3H).

Exemplul 489: 2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



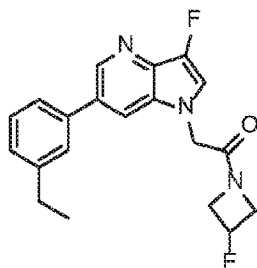
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,73 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,26 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,84 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,54 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,50 - 7,44 (m, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,03 (d, $J = 1,9$ Hz, 2H), 4,61 - 4,50 (m, 1H), 4,37 - 4,20 (m, 2H), 4,02 - 3,92 (m, 1H).

Exemplul 490: 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



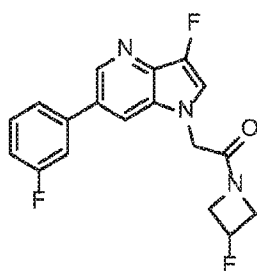
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,55 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,15 (s, 1H), 7,72 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,68 - 7,63 (m, 1H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 1H), 5,55 - 5,36 (m, 1H), 5,02 (d, $J = 3,5$ Hz, 2H), 4,61 - 4,50 (m, 1H), 4,39 - 4,17 (m, 2H), 4,02 - 3,88 (m, 1H).

Exemplul 491: 2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



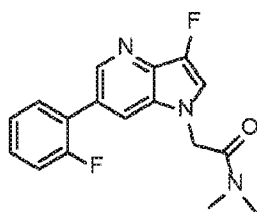
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,16 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,59 - 7,57 (m, 1H), 7,57 - 7,53 (m, 1H), 7,42 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,02 (d, $J = 3,0$ Hz, 2H), 4,61 - 4,49 (m, 1H), 4,38 - 4,17 (m, 2H), 4,02 - 3,90 (m, 1H), 2,71 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 492: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



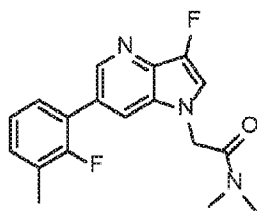
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,26 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 2H), 7,59 - 7,52 (m, 1H), 7,28 - 7,19 (m, 1H), 5,56 - 5,38 (m, 1H), 5,03 (d, $J = 2,2$ Hz, 2H), 4,62 - 4,49 (m, 1H), 4,39 - 4,18 (m, 2H), 4,02 - 3,92 (m, 1H).

Exemplul 493: 2-[3-Fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



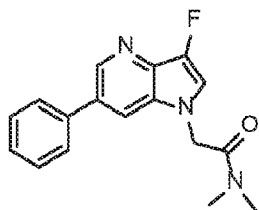
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,55 - 8,50 (m, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,65 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 1H), 7,51 - 7,44 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 2H), 5,20 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H).

Exemplul 494: 2-[3-Fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



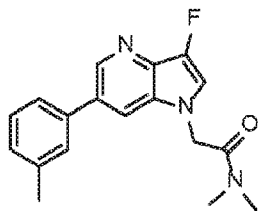
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 - 8,02 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,42 - 7,36 (m, 1H), 7,34 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,23 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,20 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,32 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H).

Exemplul 495: 2-(3-Fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă.



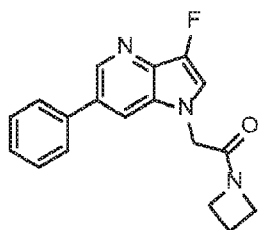
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}FN_3O$, 297,1; m/z găsit, 298,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,19 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 2H), 7,61 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,54 - 7,48 (m, 2H), 7,43 - 7,37 (m, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 496: 2-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



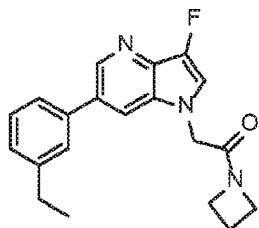
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,59 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,05 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,53 - 7,50 (m, 1H), 7,49 - 7,45 (m, 1H), 7,43 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,36 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,24 - 7,19 (m, 1H), 5,22 (s, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,98 (s, 3H), 2,43 (s, 3H).

Exemplul 497: 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirol[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



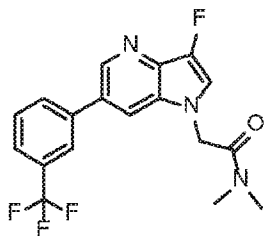
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}FN_3O$, 309,1; m/z găsit, 310,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,18 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,81 - 7,72 (m, 2H), 7,65 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,56 - 7,48 (m, 2H), 7,45 - 7,38 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,22 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 498: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



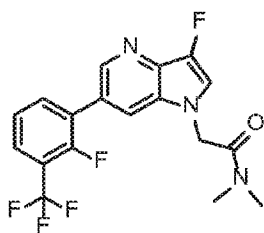
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 338,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 7,80 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,26 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 6,74 - 6,67 (m, 2H), 6,66 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 6,59 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 6,47 - 6,41 (m, 1H), 4,15 (s, 2H), 3,49 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,26 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 1,94 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,62 - 1,52 (m, 2H), 0,49 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 499: 2-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



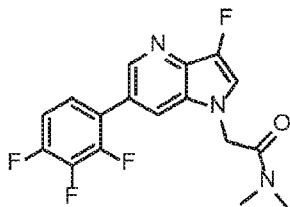
- 5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_4N_3O$, 365,1; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,30 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,12 - 8,05 (m, 2H), 7,80 - 7,73 (m, 2H), 7,66 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 5,24 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 500: 2-[3-Fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



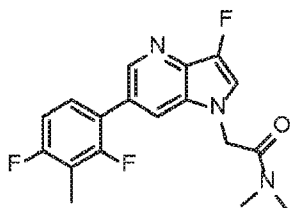
- 10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_5N_3O$, 383,1; m/z găsit, 384,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,54 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,98 - 7,91 (m, 1H), 7,88 - 7,82 (m, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,60 - 7,53 (m, 1H), 5,22 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H).

- 15 **Exemplul 501: 2-[3-Fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



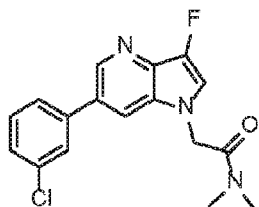
- 20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}F_4N_3O$, 351,1; m/z găsit, 352,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 - 8,11 (m, 1H), 7,69 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,52 - 7,43 (m, 2H), 5,20 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H).

Exemplul 502: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



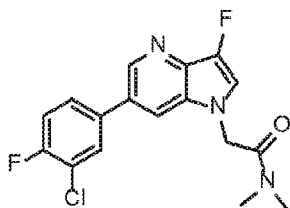
- 25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,48 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,65 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,50 - 7,41 (m, 1H), 7,21 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,24 (s, 3H).

- 30 **Exemplul 503: 2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



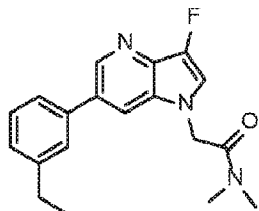
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,26 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,83 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,73 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,53 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,48 - 7,43 (m, 1H), 5,22 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 504: 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



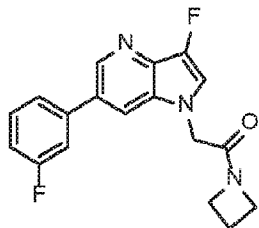
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}ClF_2N_3O$, 349,1; m/z găsit, 350,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,25 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,99 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,82 - 7,76 (m, 1H), 7,64 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,56 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 505: 2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



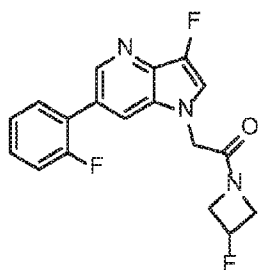
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,67 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,60 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,58 - 7,56 (m, 1H), 7,54 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,41 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,25 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,70 (q, $J = 7,5$ Hz, 2H), 1,25 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 506: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



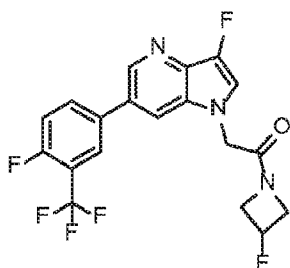
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}F_2N_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 - 8,71 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,70 - 7,62 (m, 3H), 7,59 - 7,53 (m, 1H), 7,27 - 7,20 (m, 1H), 4,96 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,22 (m, 2H).

Exemplul 507: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



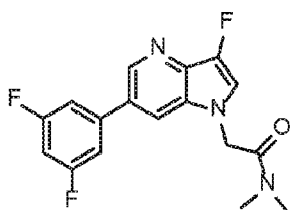
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}F_3N_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,54 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,08 - 8,02 (m, 1H), 7,62 - 7,55 (m, 1H), 7,52 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,47 - 7,41 (m, 1H), 7,35 - 7,29 (m, 1H), 7,29 - 7,22 (m, 1H), 5,48 - 5,30 (m, 1H), 5,00 (d, $J = 2,2$ Hz, 2H), 4,61 - 4,51 (m, 1H), 4,42 - 4,28 (m, 2H), 4,14 - 4,03 (m, 1H).

Exemplul 508: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



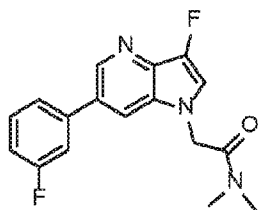
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 182. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}F_6N_3O$, 413,1; m/z găsit, 414,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,29 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,17 - 8,11 (m, 1H), 8,09 (dd, $J = 6,9, 2,4$ Hz, 1H), 7,70 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,69-7,65 (m, 1H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,03 (d, $J = 2,1$ Hz, 2H), 4,60 - 4,49 (m, 1H), 4,37 - 4,19 (m, 2H), 4,03 - 3,90 (m, 1H).

Exemplul 509: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



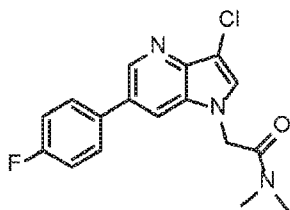
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}F_3N_3O$, 333,1; m/z găsit, 334,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,78 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,32 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,67 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,61 - 7,54 (m, 2H), 7,29 - 7,21 (m, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 510: 2-[3-Fluoro-6-(3-fluoropenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



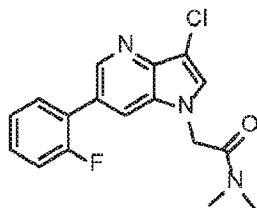
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}F_2N_3O$, 315,1; m/z găsit, 316,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,62 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,12 (t, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,56 - 7,44 (m, 4H), 7,16 - 7,10 (m, 1H), 5,23 (s, 2H), 3,19 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 511: 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



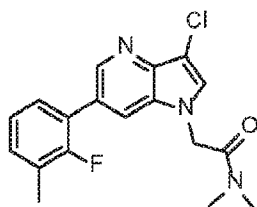
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,21 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,83 - 7,76 (m, 2H), 7,75 (s, 1H), 7,38 - 7,32 (m, 2H), 5,26 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 512: 2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



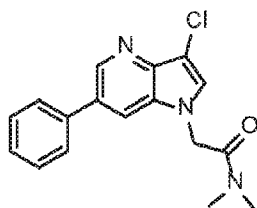
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,56 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,12 (dd, $J = 1,9, 1,1$ Hz, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 1H), 7,51 - 7,44 (m, 1H), 7,40 - 7,33 (m, 2H), 5,26 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 513: 2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



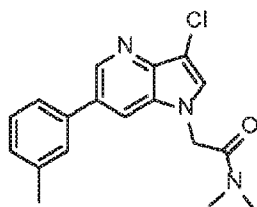
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}ClFN_3O$, 345,1; m/z găsit, 346,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD $_3$ OD) δ 8,54 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,03 (t, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,39 - 7,33 (m, 1H), 7,32 - 7,25 (m, 1H), 7,18 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,18 (s, 3H), 2,97 (s, 3H), 2,35 (d, $J = 2,3$ Hz, 3H).

Exemplul 514: 2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{16}ClN_3O$, 313,1; m/z găsit, 314,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,22 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,79 - 7,71 (m, 3H), 7,55 - 7,48 (m, 2H), 7,44 - 7,37 (m, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

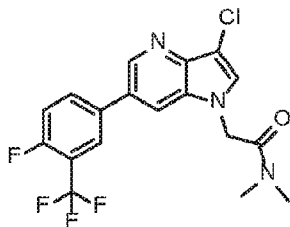
Exemplul 515: 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}ClN_3O$, 327,1; m/z găsit, 328,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70

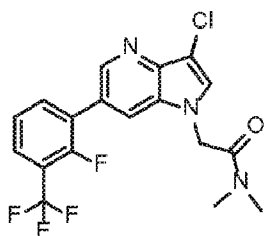
(d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,53 (d, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,39 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,41 (s, 3H).

5 **Exemplul 516: 2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



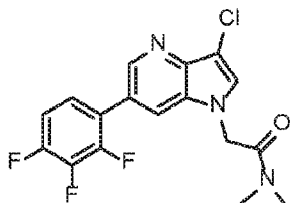
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_4N_3O$, 399,1; m/z găsit, 400,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,77 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,31 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 - 8,10 (m, 1H), 8,08 (dd, $J = 6,8, 2,4$ Hz, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,71 - 7,63 (m, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 517: 2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_4N_3O$, 399,1; m/z găsit, 400,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,21 - 8,18 (m, 1H), 7,94 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,89 - 7,82 (m, 2H), 7,57 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

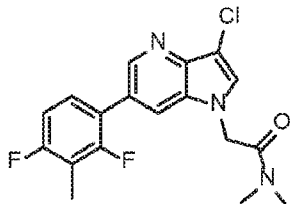
20 **Exemplul 518: 2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.**



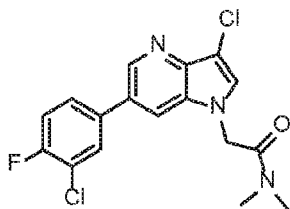
25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{13}ClF_3N_3O$, 367,1; m/z găsit, 368,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,56 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 - 8,12 (m, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,53 - 7,43 (m, 2H), 5,26 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

Exemplul 519: 2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

30



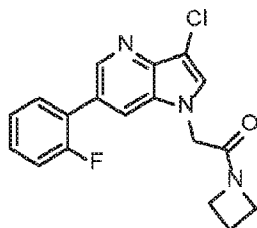
35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}ClF_2N_3O$, 363,1; m/z găsit, 364,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,09 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,50 - 7,41 (m, 1H), 7,22 (t, $J = 9,2$ Hz, 1H), 5,25 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,25 (s, 3H).

Exemplul 520: 2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

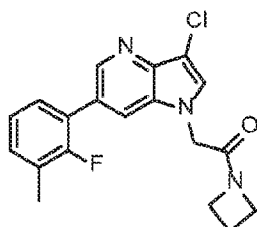
5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}Cl_2FN_3O$, 365,0; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,74 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,28 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,99 (dd, $J = 7,1, 2,4$ Hz, 1H), 7,82 - 7,78 (m, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,56 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 5,27 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 521: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

10



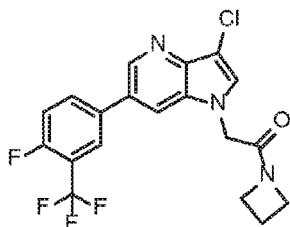
15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,12 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,64 - 7,58 (m, 1H), 7,52 - 7,45 (m, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 2H), 5,00 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 522: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}ClFN_3O$, 357,1; m/z găsit, 358,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,55 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,10 (dd, $J = 1,9, 1,1$ Hz, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,43 - 7,37 (m, 1H), 7,37 - 7,32 (m, 1H), 7,24 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 (d, $J = 2,1$ Hz, 3H), 2,31 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 523: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

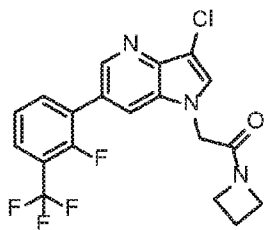
25



30 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$, 411,1; m/z găsit, 412,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,78 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,32 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 - 8,12 (m, 1H), 8,10 (dd, $J = 6,8, 2,4$ Hz, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,72-7,65 (m, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,24 (m, 2H).

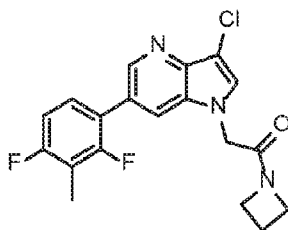
Exemplul 524: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

35



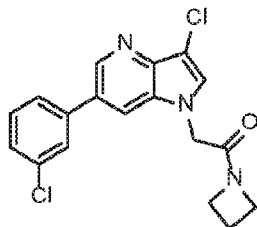
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}ClF_4N_3O$, 411,1; m/z găsit, 412,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,59 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,20 (t, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,99 - 7,93 (m, 1H), 7,89 - 7,83 (m, 2H), 7,58 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 525: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



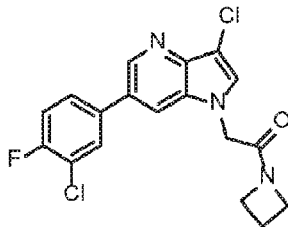
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$, 375,1; m/z găsit, 376,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,53 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,09 (t, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,50 - 7,43 (m, 1H), 7,23 (t, $J = 8,5$ Hz, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,23 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,22 (m, 5H).

Exemplul 526: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



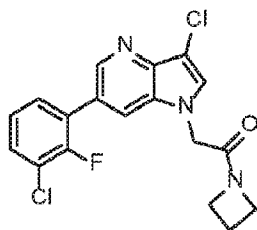
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}Cl_2N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,76 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,29 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,85 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,81 (s, 1H), 7,78 - 7,72 (m, 1H), 7,55 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,51 - 7,45 (m, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 527: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



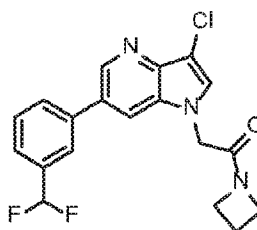
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$, 377,0; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,28 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,01 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,83 - 7,78 (m, 2H), 7,61 - 7,54 (m, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,33 - 2,24 (m, 2H).

Exemplul 528: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



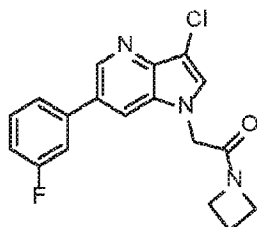
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$, 377,0; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 (s, 1H), 8,17 (s, 1H), 7,85 (s, 1H), 7,66 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,58 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,38 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 5,01 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H).

Exemplul 529: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-(difluorometil)fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



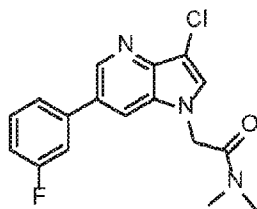
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$, 375,1; m/z găsit, 376,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,69 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,18 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,92 - 7,84 (m, 2H), 7,68 - 7,56 (m, 3H), 6,87 (t, $J = 56,2$ Hz, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,33 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 4,07 (t, $J = 7,9$ Hz, 2H), 2,44 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 530: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



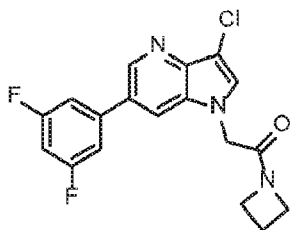
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClFN_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,79 - 8,75 (m, 1H), 8,31 - 8,27 (m, 1H), 7,81 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 7,68 - 7,61 (m, 2H), 7,60 - 7,52 (m, 1H), 7,24 (t, $J = 8,2$ Hz, 1H), 5,02 (d, $J = 2,3$ Hz, 2H), 4,25 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 2,33 - 2,25 (m, 2H).

Exemplul 531: 2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



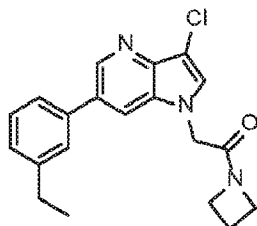
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3O$, 331,1; m/z găsit, 332,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,66 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,15 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,62 (s, 1H), 7,57 - 7,46 (m, 3H), 7,17 - 7,09 (m, 1H), 5,29 (s, 2H), 3,20 (s, 3H), 2,98 (s, 3H).

Exemplul 532: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



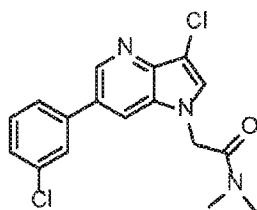
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, CD_3OD) δ 8,68 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,20 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,39 (dd, $J = 8,7, 2,2$ Hz, 2H), 7,03 - 6,96 (m, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,39 - 4,30 (m, 2H), 4,08 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,44 - 2,35 (m, 2H).

Exemplul 533: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



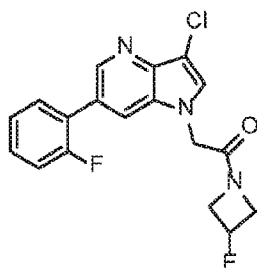
- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}ClN_3O$, 353,1; m/z găsit, 354,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,19 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,60 - 7,57 (m, 1H), 7,58 - 7,53 (m, 1H), 7,43 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,26 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,91 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,71 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,32 - 2,23 (m, 2H), 1,26 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

Exemplul 534: 2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



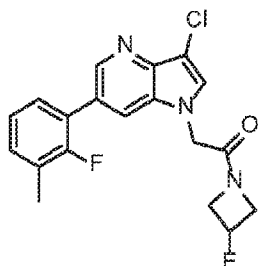
- 15 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}Cl_2N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,30 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,84 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,77 - 7,73 (m, 1H), 7,54 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,49 - 7,45 (m, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H).

Exemplul 535: 2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



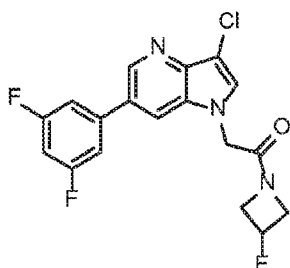
- 25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,58 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,14 (dd, $J = 1,9, 1,1$ Hz, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,64 - 7,57 (m, 1H), 7,51 - 7,45 (m, 1H), 7,41 - 7,34 (m, 2H), 5,55 - 5,37 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,7$ Hz, 2H), 4,63 - 4,52 (m, 1H), 4,40 - 4,29 (m, 1H), 4,29 - 4,16 (m, 1H), 4,02 - 3,89 (m, 1H).

- 30 **Exemplul 536: 2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.**



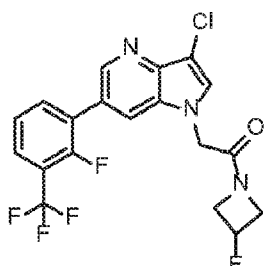
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}ClF_2N_3O$, 375,1; m/z găsit, 376,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 - 8,54 (m, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,82 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 7,35 (t, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,24 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,9$ Hz, 2H), 4,64 - 4,51 (m, 1H), 4,41 - 4,29 (m, 1H), 4,29 - 4,19 (m, 1H), 4,02 - 3,90 (m, 1H), 2,33 (s, 3H).

Exemplul 537: 2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



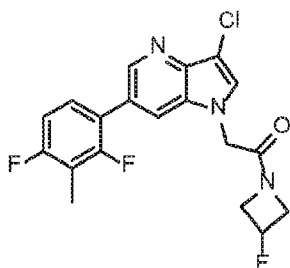
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_5N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,82 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,35 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,84 (s, 1H), 7,61 - 7,55 (m, 2H), 7,31 - 7,23 (m, 1H), 5,57 - 5,40 (m, 1H), 5,08 (s, 2H), 4,65 - 4,53 (m, 1H), 4,41 - 4,31 (m, 1H), 4,31 - 4,20 (m, 1H), 4,04 - 3,93 (m, 1H).

Exemplul 538: 2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}ClF_5N_3O$, 429,1; m/z găsit, 430,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,60 (t, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,22 - 8,20 (m, 1H), 7,98 - 7,93 (m, 1H), 7,89 - 7,83 (m, 2H), 7,58 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 3,5$ Hz, 2H), 4,63 - 4,52 (m, 1H), 4,40 - 4,30 (m, 1H), 4,29 - 4,18 (m, 1H), 4,02 - 3,91 (m, 1H).

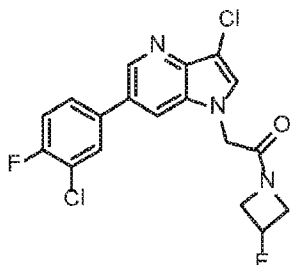
Exemplul 539: 2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$, 393,1; m/z găsit, 394,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ

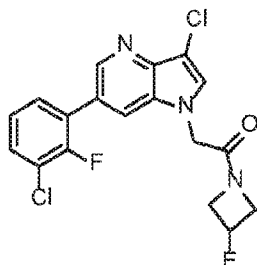
8,53 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,50 - 7,42 (m, 1H), 7,22 (t, $J = 8,9$ Hz, 1H), 5,57 - 5,36 (m, 1H), 5,06 (d, $J = 4,1$ Hz, 2H), 4,63 - 4,50 (m, 1H), 4,42 - 4,17 (m, 2H), 4,06 - 3,89 (m, 1H), 2,25 (s, 3H).

5 **Exemplul 540:** 2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



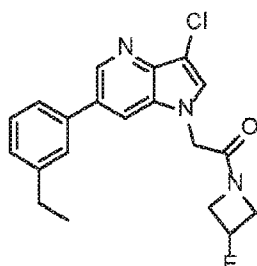
10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}Cl_2F_2N_3O$, 395,0; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,75 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,28 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,00 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,81 - 7,77 (m, 1H), 7,61 - 7,52 (m, 1H), 5,57 - 5,39 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 2,1$ Hz, 2H), 4,64 - 4,52 (m, 1H), 4,40 - 4,30 (m, 1H), 4,30 - 4,20 (m, 1H), 4,03 - 3,90 (m, 1H).

15 **Exemplul 541:** 2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



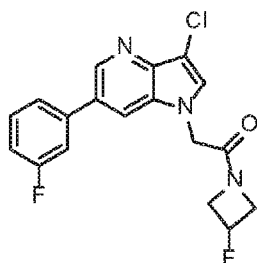
20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}Cl_2F_2N_3O$, 395,0; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,59 (t, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,19 (t, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,69 - 7,63 (m, 1H), 7,61 - 7,56 (m, 1H), 7,42 - 7,35 (m, 1H), 5,55 - 5,38 (m, 1H), 5,07 (d, $J = 3,6$ Hz, 2H), 4,63 - 4,52 (m, 1H), 4,40 - 4,30 (m, 1H), 4,29 - 4,19 (m, 1H), 4,02 - 3,90 (m, 1H).

Exemplul 542: 2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



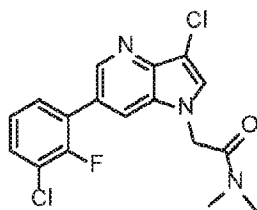
25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}ClFN_3O$, 371,1; m/z găsit, 372,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,20 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,78 (s, 1H), 7,60 - 7,52 (m, 2H), 7,43 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,26 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,56 - 5,39 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 3,0$ Hz, 2H), 4,63 - 4,53 (m, 1H), 4,41 - 4,30 (m, 1H), 4,30 - 4,20 (m, 1H), 4,03 - 3,90 (m, 1H), 2,71 (q, $J = 7,6$ Hz, 2H), 1,26 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H).

30 **Exemplul 543:** 2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



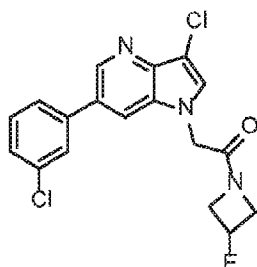
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}ClF_2N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,78 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,29 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,66 - 7,61 (m, 2H), 7,59 - 7,53 (m, 1H), 7,28 - 7,20 (m, 1H), 5,57 - 5,39 (m, 1H), 5,08 (d, $J = 2,3$ Hz, 2H), 4,64 - 4,53 (m, 1H), 4,40 - 4,30 (m, 1H), 4,30 - 4,20 (m, 1H), 4,04 - 3,91 (m, 1H).

Exemplul 544: 2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă.



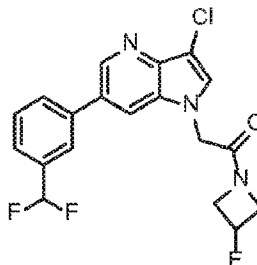
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}Cl_2FN_3O$, 365,0; m/z găsit, 366,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, CD_3OD) δ 8,55 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,08 (t, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,57 - 7,48 (m, 2H), 7,34 - 7,26 (m, 1H), 5,28 (s, 2H), 3,18 (s, 3H), 2,97 (s, 3H).

Exemplul 545: 2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

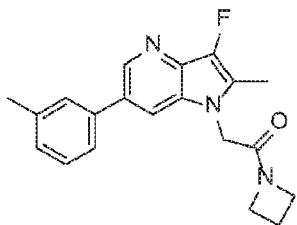


Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{14}Cl_2FN_3O$, 377,0; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ 8,76 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,30 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,84 (t, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,82 (s, 1H), 7,78 - 7,73 (m, 1H), 7,55 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,49 - 7,45 (m, 1H), 5,56 - 5,39 (m, 1H), 5,09 (d, $J = 2,0$ Hz, 2H), 4,64 - 4,53 (m, 1H), 4,42 - 4,30 (m, 1H), 4,30 - 4,20 (m, 1H), 4,04 - 3,92 (m, 1H).

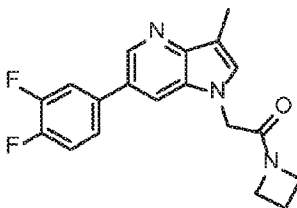
Exemplul 546: 2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



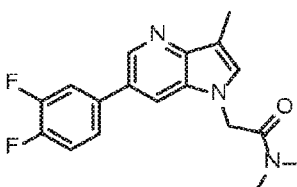
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}ClF_3N_3O$, 393,1; m/z găsit, 394,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,76 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,96 - 7,92 (m, 2H), 7,82 (s, 1H), 7,73 - 7,56 (m, 2H), 7,30 - 6,95 (m, 1H), 5,60 - 5,36 (m, 1H), 5,10 (s, 2H), 4,66 - 4,50 (m, 1H), 4,43 - 4,17 (m, 2H), 4,05 - 3,89 (m, 1H).

Exemplul 547: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

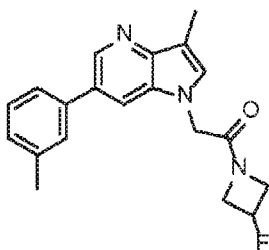
5 La o soluție de compus 1-(azetidin-1-il)-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă (Exemplul 41, 104 mg, 0,32 mmol) și Selectfluor® (135 mg, 0,38 mmol) în ACN (0,63 mL) s-a adăugat piridină (0,18 mL, 2,34 mmol). Amestecul de reacție a fost agitat la temperatura camerei timp de 12 ore, concentrat sub presiune redusă. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 50-100% în hexani) a dat compusul din titlu (6,4 mg, 6%). MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O, 337,2; m/z găsit, 338,1 [M+H]⁺. ¹H RMN (500 MHz, CD₃OD) δ 8,52 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,01 (dd, J = 2,4, 1,8 Hz, 1H), 7,50 (s, 1H), 7,48 - 7,44 (m, 1H), 7,36 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,32 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 4,07 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 2,43 (s, 3H), 2,41 (d, J = 2,0 Hz, 3H), 2,41 - 2,34 (m, 2H).

Exemplul 548: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₉H₁₇F₂N₃O, 341,1; m/z găsit, 342,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,61 (s, 1H), 7,83 (s, 1H), 7,47 - 7,37 (m, 1H), 7,37 - 7,29 (m, 1H), 7,29 - 7,18 (m, 2H), 4,77 (s, 2H), 4,09 (t, J = 7,7 Hz, 2H), 4,00 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,38 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 549: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₇F₂N₃O, 329,1; m/z găsit, 330,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, CDCl₃) δ 8,50 (s, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,41 - 7,21 (m, 4H), 5,09 (s, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,96 (s, 3H), 2,47 (s, 3H).

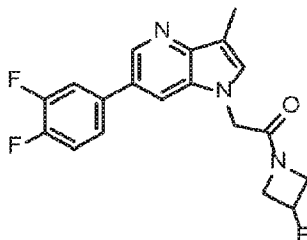
Exemplul 550: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

35 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₂₀FN₃O, 337,2; m/z găsit, 338,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (300 MHz, DMSO-d₆) δ 8,61 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,02 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,57 - 7,47 (m, 2H), 7,43 - 7,34 (m, 2H), 7,19 (d, J =

7,6 Hz, 1H), 5,58 - 5,44 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,61 - 4,42 (m, 1H), 4,37 - 4,14 (m, 2H), 4,04 - 3,86 (m, 1H), 2,41 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 551: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.

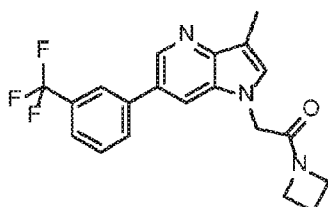
5



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,10 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,89 - 7,79 (m, 1H), 7,64 - 7,50 (m, 2H), 7,40 (s, 1H), 5,59 - 5,30 (m, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,61 - 4,43 (m, 1H), 4,35 - 4,15 (m, 2H), 4,04 - 3,87 (m, 1H), 2,30 (s, 3H).

10

Exemplul 552: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

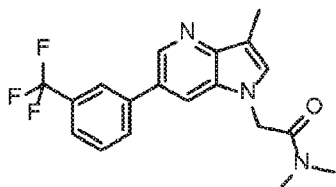


15

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,71 (s, 1H), 8,25 (br. s, 1H), 7,89 - 7,78 (m, 2H), 7,76 - 7,57 (m, 2H), 7,45 (s, 1H), 4,89 (s, 2H), 4,34 - 4,22 (m, 2H), 4,13 (t, $J = 7,8$ Hz, 2H), 2,59 (s, 3H), 2,50 - 2,32 (m, 2H).

20

Exemplul 553: N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

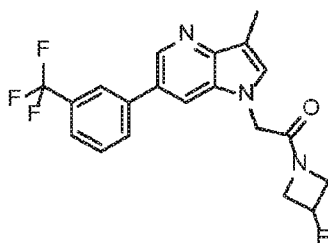


25

Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_3N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,67 (s, 1H), 7,86 - 7,74 (m, 3H), 7,67 - 7,54 (m, 2H), 7,22 (s, 1H), 4,98 (s, 2H), 3,15 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,47 (s, 3H).

Exemplul 554: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

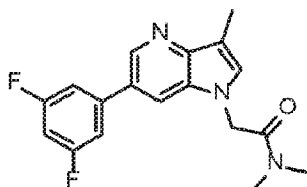
30



35

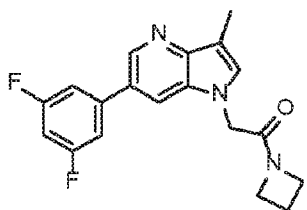
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{17}F_4N_3O$, 391,1; m/z găsit, 392,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,17 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,10 - 7,99 (m, 2H), 7,74 (d, $J = 4,7$ Hz, 2H), 7,42 (s, 1H), 5,59 - 5,28 (m, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,61 - 4,42 (m, 1H), 4,37 - 4,15 (m, 2H), 4,04 - 3,87 (m, 1H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 555: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



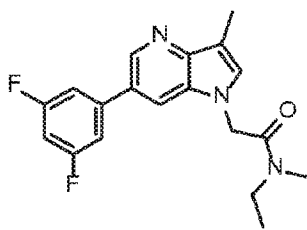
5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3O$, 329,1; m/z găsit, 330,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,18 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,59 - 7,48 (m, 2H), 7,38 (s, 1H), 7,28 - 7,15 (m, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

10 **Exemplul 556:** 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



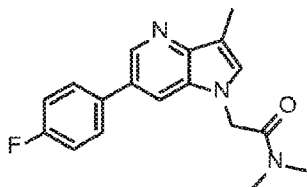
15 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,71 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,18 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,60 - 7,49 (m, 2H), 7,42 (s, 1H), 7,30 - 7,15 (m, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,20 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,34-2,19 (m, 5H).

Exemplul 557: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă.



20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}F_2N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (s, 1H), 8,23 - 8,07 (m, 1H), 7,60 - 7,46 (m, 2H), 7,45 - 7,35 (m, 1H), 7,27 - 7,15 (m, 1H), 5,20 (s, 0,8H), 5,17 (s, 1,2H), 3,48 (q, $J = 7,0$ Hz, 1,2H), 3,32 - 3,20 (m, 0,8H), 3,09 (s, 1,8H), 2,82 (s, 1,2H), 2,30 (s, 3H), 1,24 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,2H), 1,03 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,8H).

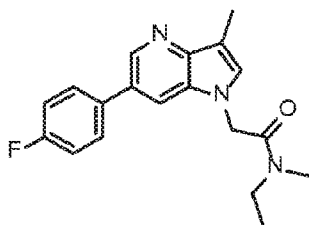
25 **Exemplul 558:** 2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



30 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,59 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,02 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,80 - 7,70 (m, 2H), 7,39 - 7,27 (m, 3H), 5,18 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

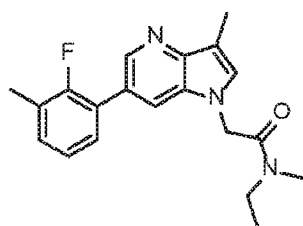
Exemplul 559: N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.

35



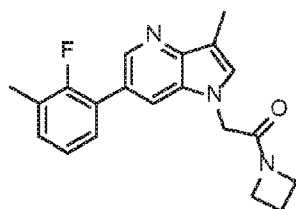
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,65 (s, 1H), 7,65 - 7,51 (m, 3H), 7,21 - 7,09 (m, 3H), 4,89 (d, $J = 9,2$ Hz, 2H), 3,53 - 3,38 (m, 2H), 3,07 - 2,90 (m, 3H), 2,44 (s, 3H), 1,29 - 1,05 (m, 3H).

Exemplul 560: N-Etil-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.



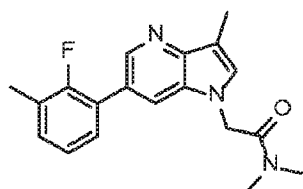
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{22}FN_3O$, 339,2; m/z găsit, 340,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,44 (s, 1H), 7,93 - 7,84 (m, 1H), 7,42 - 7,26 (m, 3H), 7,25 - 7,16 (m, 1H), 5,18 (s, 0,8H), 5,14 (s, 1,2H), 3,45 (d, $J = 7,1$ Hz, 1,2H), 3,32 - 3,21 (m, 0,8H), 3,06 (s, 1,8H), 2,81 (s, 1,2H), 2,32 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 1,20 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,2H), 1,01 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,8H).

Exemplul 561: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-il]etanonă.



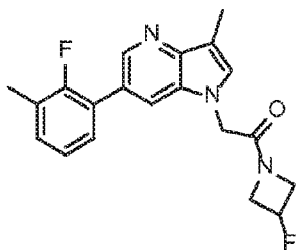
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}FN_3O$, 337,2; m/z găsit, 337,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,45 (s, 1H), 7,91 (s, 1H), 7,42 - 7,27 (m, 3H), 7,22 (t, $J = 7,5$ Hz, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,18 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,36 - 2,17 (m, 8H).

Exemplul 562: 2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



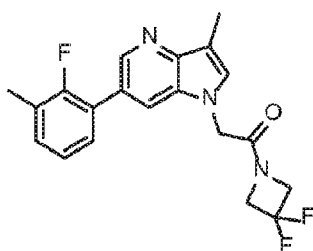
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,47 - 8,42 (m, 1H), 7,92 - 7,88 (m, 1H), 7,42 - 7,26 (m, 3H), 7,26-7,16 (m, 1H), 5,17 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,35 - 2,27 (m, 6H).

Exemplul 563: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



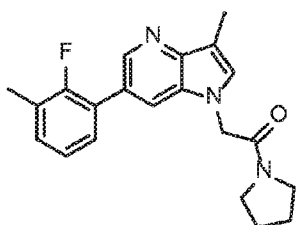
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,66 (s, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,38 - 7,10 (m, 4H), 5,33 - 5,02 (m, 1H), 4,77 (s, 2H), 4,41 - 4,06 (m, 2H), 3,91 - 3,74 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,36 (s, 3H).

Exemplul 564: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



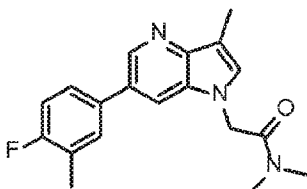
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 373,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,48 - 8,44 (m, 1H), 7,97 - 7,93 (m, 1H), 7,42 - 7,27 (m, 3H), 7,26 - 7,18 (m, 1H), 5,05 (s, 2H), 4,70 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,35 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 2,36 - 2,26 (m, 6H).

Exemplul 565: 2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



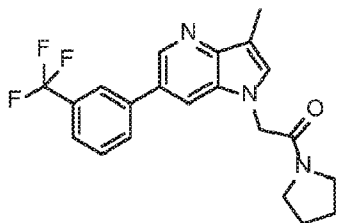
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O$, 351,2; m/z găsit, 352,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,60 (s, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,49 - 7,06 (m, 4H), 4,83 (s, 2H), 3,51 (t, $J = 6,9$ Hz, 2H), 3,42 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,06 - 1,95 (m, 2H), 1,92 - 1,82 (m, 2H).

Exemplul 566: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



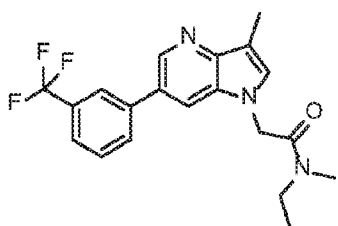
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,58 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,01 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,67 - 7,60 (m, 1H), 7,59 - 7,51 (m, 1H), 7,33 (s, 1H), 7,25 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,29 (s, 3H).

Exemplul 567: 2-[3-Metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]piolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



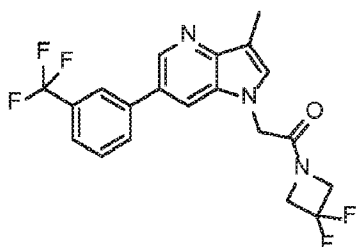
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{20}F_3N_3O$, 387,2; m/z găsit, 388,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,68 (s, 1H), 7,91 - 7,76 (m, 2H), 7,70 (s, 1H), 7,65 - 7,50 (m, 2H), 7,20 (s, 1H), 4,85 (s, 2H), 3,64 - 3,41 (m, 4H), 2,43 (s, 3H), 2,15 - 1,97 (m, 2H), 1,97 - 1,81 (m, 2H).

Exemplul 568: N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



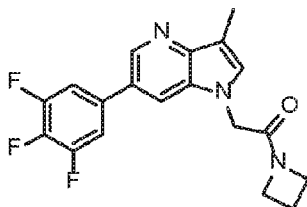
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{20}F_3N_3O$, 375,2; m/z găsit, 376,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,68 (s, 1H), 7,88 - 7,76 (m, 2H), 7,69 - 7,51 (m, 3H), 7,18 (s, 1H), 4,92 (d, $J = 8,7$ Hz, 2H), 3,59-3,34 (m, 2H), 3,08 (s, 1,5H), 2,98 (s, 1,5H), 2,44 (s, 3H), 1,25 (t, $J = 7,2$ Hz, 1,5H), 1,14 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,5H).

Exemplul 569: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



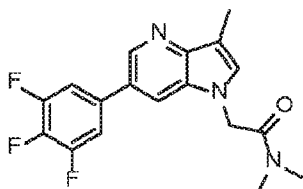
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{16}F_5N_3O$, 409,1; m/z găsit, 410,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,75 (s, 1H), 7,89 - 7,78 (m, 2H), 7,72 - 7,57 (m, 3H), 7,16 (s, 1H), 4,85 (s, 2H), 4,39 (t, $J = 12,0$ Hz, 2H), 4,00 (t, $J = 11,5$ Hz, 2H), 2,46 (s, 3H).

Exemplul 570: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



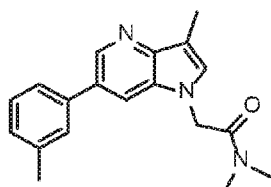
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,69 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,16 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,79 (dd, $J = 9,6, 6,8$ Hz, 2H), 7,42 (s, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,19 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,90 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,38 - 2,15 (m, 5H).

Exemplul 571: N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



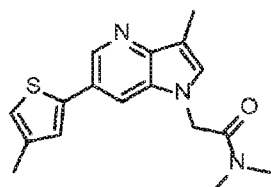
- 5 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,69 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 8,15 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,77 (dd, $J = 9,5, 6,8$ Hz, 2H), 7,41 (d, $J = 17,8$ Hz, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 572: *N,N*-Dimetil-2-[3-metil-6-(*m*-tolil)pirolo[3,2-*b*]piridin-1-il]acetamidă.



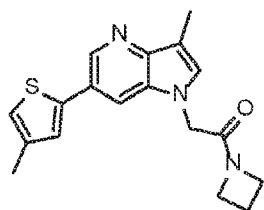
- 10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3O$, 307,2; m/z găsit, 308,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,57 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,42 - 7,18 (m, 5H), 5,06 (s, 2H), 3,16 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,44 (s, 3H), 2,42 (s, 3H).

Exemplul 573: *N,N*-Dimetil-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-*b*]piridin-1-il]acetamidă.



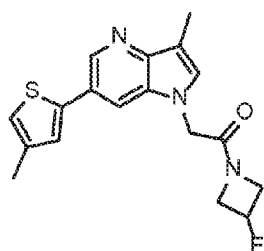
- 15 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{19}N_3OS$, 313,1; m/z găsit, 314,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,68 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,14 (d, $J = 3,8$ Hz, 2H), 6,88 (s, 1H), 4,90 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 3,00 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

20 **Exemplul 574:** 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-*b*]piridin-1-il]etanonă.



- 25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3OS$, 325,1; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,70 (s, 1H), 7,73 (s, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,14 (s, 1H), 6,89 (s, 1H), 4,72 (s, 2H), 4,09 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,85 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,39 (s, 3H), 2,31 (s, 3H), 2,27 - 2,21 (m, 2H).

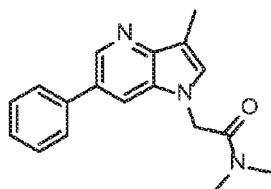
Exemplul 575: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-*b*]piridin-1-il]etanonă.



30

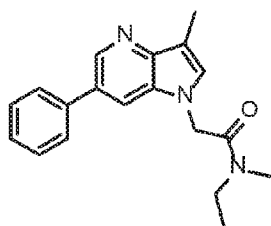
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3OS$, 343,1; m/z găsit, 344,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,76 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,65 (s, 1H), 7,18 (s, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,90 (s, 1H), 5,29 - 5,04 (m, 1H), 4,76 (s, 2H), 4,40 - 4,09 (m, 2H), 3,82 (dd, $J = 21,7, 4,4$ Hz, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,32 (s, 3H).

5 **Exemplul 576: *N,N*-Dimetil-2-(3-metil-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă.**



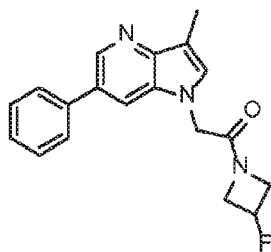
10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3O$, 293,2; m/z găsit, 294,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,04 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,70 (m, 2H), 7,49 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,38 (d, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,33 (s, 1H), 5,18 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 577: *N*-Etil-*N*-metil-2-(3-metil-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă.



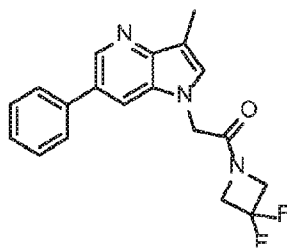
15 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3O$, 307,2; m/z găsit, 308,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,62 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 8,01 (dd, $J = 9,3, 2,0$ Hz, 1H), 7,72 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,49 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,42 - 7,30 (m, 2H), 5,20 (s, 0,8H), 5,16 (s, 1,2H), 3,53 - 3,41 (m, 0,8H), 3,33 - 3,26 (m, 1,2H), 3,08 (s, 1,8H), 2,82 (s, 1,2H), 2,30 (s, 3H), 1,22 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,2H), 1,02 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,8H).

20 **Exemplul 578: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.**



25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,64 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,77 - 7,68 (m, 2H), 7,57 - 7,46 (m, 2H), 7,43 - 7,33 (m, 2H), 5,59 - 5,29 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,61 - 4,42 (m, 1H), 4,38 - 4,15 (m, 2H), 4,05 - 3,85 (m, 1H), 2,30 (s, 3H).

30 **Exemplul 579: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.**

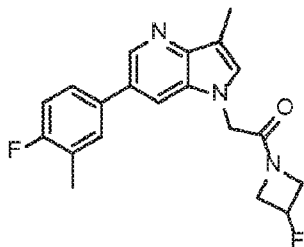


Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,63

(d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,06 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,73 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,50 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,43 - 7,32 (m, 2H), 5,07 (s, 2H), 4,71 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,36 (t, $J = 12,7$ Hz, 2H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 580: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

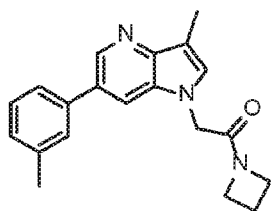
5



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,60 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,40 (d, $J = 6,2$ Hz, 2H), 7,23 (s, 1H), 7,10 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 5,27 - 5,01 (m, 1H), 5,01 - 4,76 (m, 2H), 4,47 - 3,95 (m, 4H), 2,44 (s, 3H), 2,35 (s, 3H).

10

Exemplul 581: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

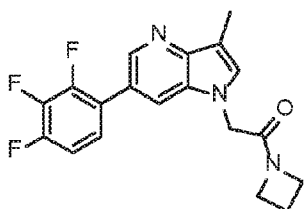


Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}N_3O$, 319,2; m/z găsit, 320,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,61 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 8,01 (d, $J = 1,7$ Hz, 1H), 7,53 (d, $J = 12,9$ Hz, 2H), 7,37 (d, $J = 7,7$ Hz, 2H), 7,19 (d, $J = 7,4$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,18 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,41 (s, 3H), 2,33 - 2,17 (m, 5H).

15

Exemplul 582: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.

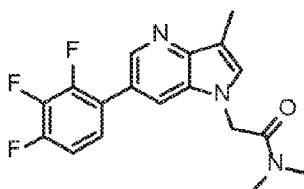
20



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,47 (s, 1H), 7,97 (s, 1H), 7,56 - 7,39 (m, 3H), 4,92 (s, 2H), 4,19 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,28 - 2,18 (m, 2H).

25

Exemplul 583: N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

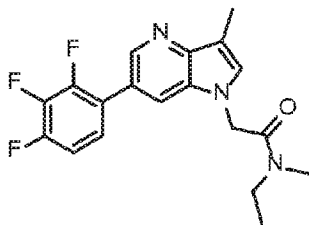


30

Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{16}F_3N_3O$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,46 (s, 1H), 7,96 (s, 1H), 7,54 - 7,37 (m, 3H), 5,18 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,31 (s, 3H).

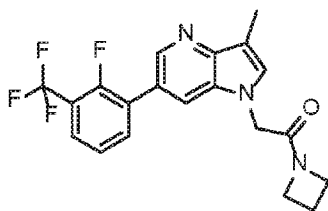
Exemplul 584: N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.

35



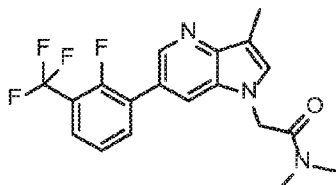
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}F_3N_3O$, 361,1; m/z găsit, 362,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,46 (s, 1H), 7,99 - 7,90 (m, 1H), 7,53 - 7,38 (m, 3H), 5,19 (s, 0,8H), 5,15 (s, 1,2H), 3,45 (q, J = 7,0 Hz, 0,8H), 3,30 - 3,25 (m, 1,2 H), 3,06 (s, 1,8H), 2,81 (s, 1,2H), 2,31 (s, 3H), 1,21 (t, J = 7,1 Hz, 1,2H), 1,01 (t, J = 7,1 Hz, 1,8H).

Exemplul 585: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



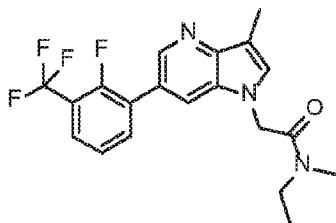
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{17}F_4N_3O$, 391,1; m/z găsit, 392,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,49 (s, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,93 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,82 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 7,56 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,19 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 3,89 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,29 - 2,21 (m, 2H).

Exemplul 586: 2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



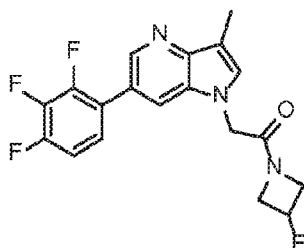
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_4N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 - 8,45 (m, 1H), 8,03 - 7,99 (m, 1H), 7,92 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 7,81 (t, J = 7,2 Hz, 1H), 7,54 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,41 (s, 1H), 5,19 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 587: N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.



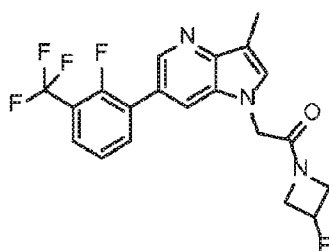
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_4N_3O$, 393,1; m/z găsit, 394,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,47 (s, 1H), 8,03 - 7,96 (m, 1H), 7,92 (t, J = 7,5 Hz, 1H), 7,81 (t, J = 7,1 Hz, 1H), 7,54 (t, J = 7,8 Hz, 1H), 7,47 - 7,39 (m, 1H), 5,20 (s, 0,8H), 5,17 (s, 1,2H), 3,45 (q, J = 7,1 Hz, 0,8H), 3,33 - 3,25 (m, 1,2H), 3,06 (s, 1,8H), 2,81 (s, 1,2H), 2,31 (s, 3H), 1,21 (t, J = 7,1 Hz, 1,2H), 1,01 (t, J = 7,1 Hz, 1,8H).

Exemplul 588: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



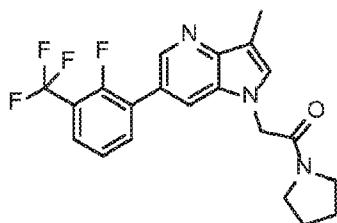
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,51 - 8,43 (m, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,52 - 7,40 (m, 3H), 5,59 - 5,30 (m, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,62 - 4,41 (m, 1H), 4,40 - 4,12 (m, 2H), 4,04 - 3,83 (m, 1H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 589: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



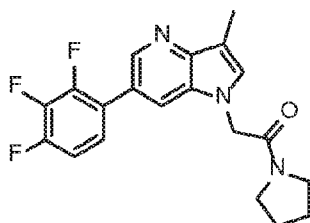
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{16}F_5N_3O$, 409,1; m/z găsit, 410,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,52 - 8,46 (m, 1H), 8,05 - 8,00 (m, 1H), 7,97 - 7,89 (m, 1H), 7,87 - 7,77 (m, 1H), 7,55 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,46 - 7,43 (m, 1H), 5,58 - 5,29 (m, 1H), 5,00 (s, 2H), 4,61 - 4,41 (m, 1H), 4,38 - 4,12 (m, 2H), 4,04 - 3,86 (m, 1H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 590: 2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



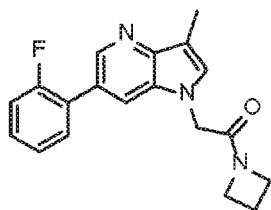
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{19}F_4N_3O$, 405,1; m/z găsit, 406,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 - 8,45 (m, 1H), 8,04 - 8,00 (m, 1H), 7,92 (t, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,82 (t, $J = 7,1$ Hz, 1H), 7,55 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,45 - 7,42 (m, 1H), 5,10 (s, 2H), 3,56 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,34 - 3,25 (m, 2H), 2,32 (s, 3H), 2,01 - 1,89 (m, 2H), 1,85 - 1,72 (m, 2H).

Exemplul 591: 2-[3-Metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



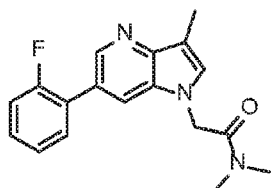
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,48 - 8,43 (m, 1H), 8,00 - 7,96 (m, 1H), 7,51 - 7,38 (m, 3H), 5,09 (s, 2H), 3,56 (t, $J = 6,8$ Hz, 2H), 3,34 - 3,25 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,00 - 1,89 (m, 2H), 1,86 - 1,72 (m, 2H).

Exemplul 592: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



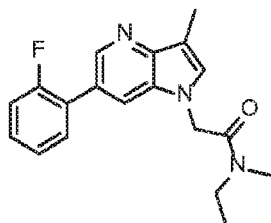
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{18}FN_3O$, 323,1; m/z găsit, 324,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 - 8,44 (m, 1H), 7,96 - 7,91 (m, 1H), 7,63 - 7,55 (m, 1H), 7,49 - 7,27 (m, 4H), 4,91 (s, 2H), 4,19 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 3,89 (t, $J = 7,7$ Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,29 - 2,18 (m, 2H).

Exemplul 593: 2-[6-(2-Fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



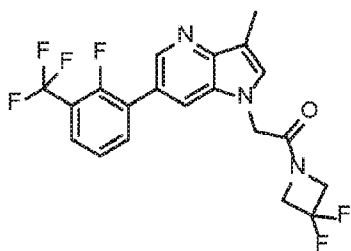
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3O$, 311,1; m/z găsit, 312,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,53 - 8,46 (m, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,63 - 7,51 (m, 1H), 7,50 - 7,39 (m, 2H), 7,39 - 7,30 (m, 2H), 5,19 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 594: N-Etil-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.



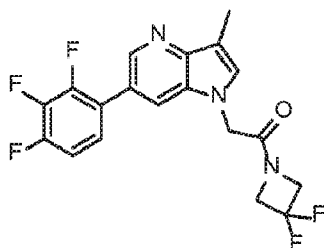
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{20}FN_3O$, 325,2; m/z găsit, 326,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,49 - 8,44 (m, 1H), 7,91 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,62 - 7,53 (m, 1H), 7,49-7,29 (m, 4H), 5,18 (s, 0,8H), 5,15 (s, 1,2H), 3,45 (q, $J = 7,2$ Hz, 0,8H), 3,33 (s, 1,2H), 3,06 (s, 1,8H), 2,81 (s, 1,2H), 2,31 (s, 3H), 1,20 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,2H), 1,01 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,8H).

Exemplul 595: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]1-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



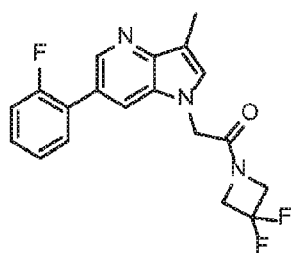
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{15}F_6N_3O$, 427,1; m/z găsit, 428,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,51 - 8,47 (m, 1H), 8,06 - 8,01 (m, 1H), 7,93 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,82 (t, $J = 7,3$ Hz, 1H), 7,55 (t, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,44 (s, 1H), 5,07 (s, 2H), 4,71 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 4,35 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 2,32 (s, 3H).

Exemplul 596: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



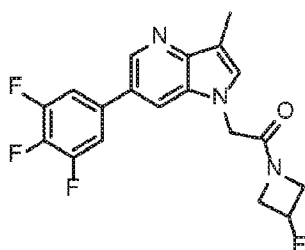
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}F_5N_3O$, 395,1; m/z găsit, 396,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,50 - 8,45 (m, 1H), 8,01 - 7,98 (m, 1H), 7,52 - 7,40 (m, 3H), 5,06 (s, 2H), 4,71 (t, J = 12,6 Hz, 2H), 4,35 (t, J = 12,7 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 597: 1-(3,3-Difluoropropil)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



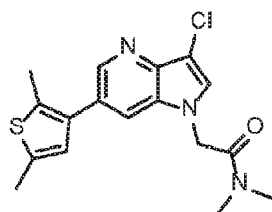
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,51 - 8,46 (m, 1H), 8,00 - 7,93 (m, 1H), 7,63 - 7,54 (m, 1H), 7,51 - 7,29 (m, 4H), 5,06 (s, 2H), 4,71 (t, J = 12,4 Hz, 2H), 4,35 (t, J = 12,7 Hz, 2H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 598: 1-(3-Fluoropropil)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



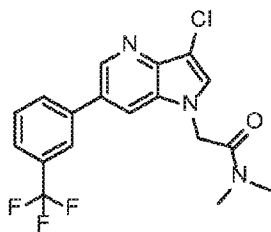
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,70 (s, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,95 - 7,68 (m, 2H), 7,42 (s, 1H), 5,82 - 5,17 (m, 1H), 4,99 (s, 2H), 4,65 - 4,40 (m, 1H), 4,40 - 4,11 (m, 2H), 4,11 - 3,76 (m, 1H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 599: 2-[3-Cloro-6-(2,5-dimetil-3-tienil)pirolol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



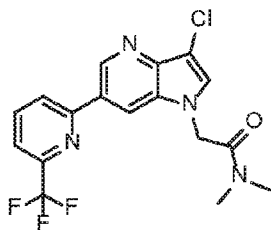
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{18}ClN_3OS$, 347,1; m/z găsit, 348,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,56 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 7,32 (s, 1H), 6,71 (s, 1H), 4,87 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 3,00 (s, 3H), 2,46 (s, 3H), 2,43 (s, 3H).

Exemplul 600: 2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



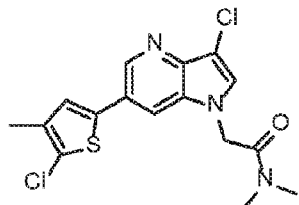
- 5 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{15}ClF_3N_3O$, 381,1; m/z găsit, 382,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 8,75 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,84 - 7,81 (m, 1H), 7,81 - 7,76 (m, 1H), 7,69 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,67 - 7,55 (m, 2H), 7,36 (s, 1H), 4,95 (s, 2H), 3,15 (s, 3H), 3,01 (s, 3H).

Exemplul 601: 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



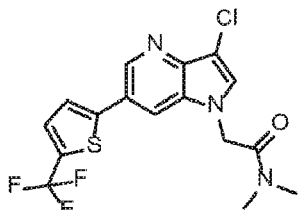
- 10 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{14}ClF_3N_4O$, 382,1; m/z găsit, 383,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 9,07 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,37 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,01 (d, $J = 8,0$ Hz, 1H), 7,95 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,66 - 7,60 (m, 1H), 7,42 (s, 1H), 4,99 (s, 2H), 3,17 (s, 3H), 3,01 (s, 3H).

- 15 **Exemplul 602:** 2-[3-Cloro-6-(5-cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



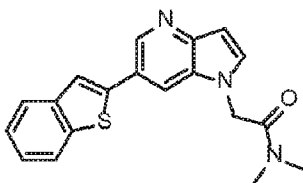
- 20 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}Cl_2N_3OS$, 367,0; m/z găsit, 368,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,63 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,12 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,74 (s, 1H), 7,41 (s, 1H), 5,23 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 2,85 (s, 3H), 2,19 (s, 3H).

Exemplul 603: 2-[3-Cloro-6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



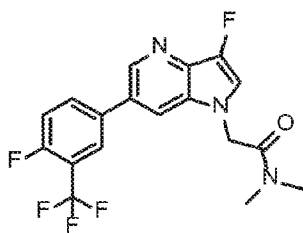
- 25 Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 146. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{13}ClF_3N_3OS$, 387,0; m/z găsit, 388,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,79 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,30 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 7,80 (s, 1H), 7,79 - 7,74 (m, 1H), 7,69 - 7,64 (m, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

- 30 **Exemplul 604:** 2-[6-(Benzotiofen-2-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 106. ^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ 8,85 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,82 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,80 - 7,74 (m, 2H), 7,56 (s, 1H), 7,40 - 7,28 (m, 3H), 6,78 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 4,92 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 3,00 (s, 3H).

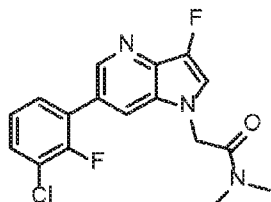
5 **Exemplul 605:** 2-[3-Fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



10 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{18}\text{H}_{14}\text{F}_5\text{N}_3\text{O}$, 383,1; m/z găsit, 384,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,73 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,30 - 8,26 (m, 1H), 8,17-8,04 (m, 2H), 7,72 - 7,63 (m, 2H), 5,22 (s, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,85 (s, 3H).

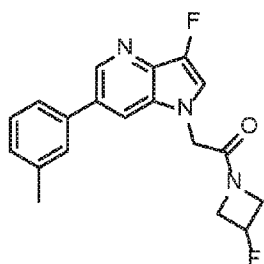
Exemplul 606: 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirollo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

15



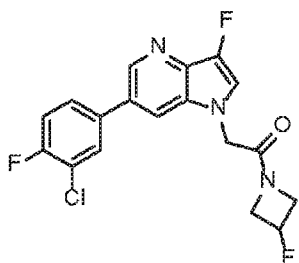
20 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{17}\text{H}_{14}\text{ClF}_2\text{N}_3\text{O}$, 349,1; m/z găsit, 350,0 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,54 - 8,51 (m, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,67 - 7,62 (m, 1H), 7,59 - 7,54 (m, 1H), 7,40 - 7,34 (m, 1H), 5,21 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H).

Exemplul 607: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



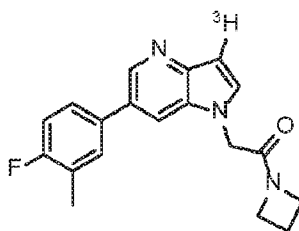
25 Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $\text{C}_{19}\text{H}_{17}\text{F}_2\text{N}_3\text{O}$, 341,1; m/z găsit, 342,1 $[\text{M}+\text{H}]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $\text{DMSO}-d_6$) δ 8,68 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 8,16 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,64 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 8,1$ Hz, 1H), 7,40 (t, $J = 7,6$ Hz, 1H), 7,22 (d, $J = 7,5$ Hz, 1H), 5,58 - 5,35 (m, 1H), 5,03 (s, 2H), 4,64 - 4,47 (m, 1H), 4,40 - 4,16 (m, 2H), 4,04 - 3,89 (m, 1H), 2,41 (s, 3H).

30 **Exemplul 608:** 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirollo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



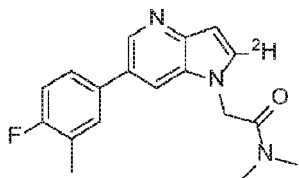
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 92. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{13}ClF_3N_3O$, 379,1; m/z găsit, 380,0 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ 8,72 (d, $J = 1,9$ Hz, 1H), 8,25 (t, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,00 (dd, $J = 7,1, 2,3$ Hz, 1H), 7,84 - 7,74 (m, 1H), 7,68 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 7,57 (t, $J = 9,0$ Hz, 1H), 5,58 - 5,35 (m, 1H), 5,02 (s, 2H), 4,63 - 4,48 (m, 1H), 4,40 - 4,15 (m, 2H), 4,07 - 3,87 (m, 1H).

Exemplul 609: 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-[^3H]-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 349 înlocuind tritiu gaz pentru H_2 gaz. ^3H RMN (300 MHz, CD_3OD) δ 6,97 (s, 1H).

Exemplul 610: 2-[2-Deuterio-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

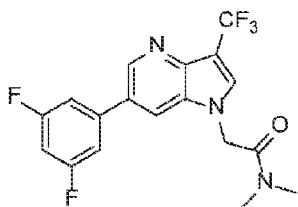


Etapă A: 6-(4-Fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-carboxilat de *terț*-butil. La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină (500 mg, 2,21 mmol) în DCM (10 mL) s-a adăugat (Boc) $_2$ O (0,57 mL, 2,65 mmol) și DMAP (27 mg, 0,22 mmol) și amestecul de reacție a fost agitat la rt timp de 1 oră. S-a adăugat apă și amestecul rezultat a fost extras cu EtOAc. Straturile organice au fost combinate, uscate, concentrate și purificate prin FCC (EtOAc 0-100% în hexani) pentru a furniza 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-carboxilat de *terț*-butil (78%, 564 mg).

Etapă B: 6-(4-Fluoro-3-metilfenil)-2-duetero-1H-pirololo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-carboxilat de *terț*-butil (400 mg, 1,23 mmol) în THF la -78 °C s-a adăugat tBuLi (2,89 mL, 4,91 mmol, 1,7 M în hexani) și amestecul de reacție a fost agitat timp de 15 minute. La amestecul de reacție s-a adăugat CD_3CO_2D (0,75 mL, 12,3 mmol) și amestecul de reacție a fost încălzit încet la rt. Amestecul de reacție a fost diluat cu EtOAc și spălat cu apă. Faza organică a fost uscată, concentrată și purificată prin FCC (EtOAc 0-100% în hexani) pentru a furniza 6-(4-fluoro-3-metilfenil)-2-duetero-1H-pirololo[3,2-b]piridină (89 %, 251 mg).

Etapă C: 2-(6-(4-Fluoro-3-metilfenil)-2-duetero-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 66. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}DFN_3O$, 312,1; m/z găsit, $[M+H]^+$.

Exemplul 611: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



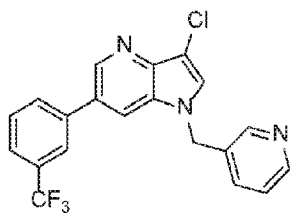
Etapă A: 6-(3,5-Difluorofenil)-3-iodo-1H-pirololo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-(3,5-difluorofenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină (Intermediar 9, 750mg, 3,5mmol) în DMF (10mL) la temperatura camerei s-a adăugat NIS (1,1g, 4,4 mmol). Soluția a fost agitată peste noapte și dimineața s-a adăugat apă (20 mL). Amestecul de reacție a fost concentrat direct pe silicagel și purificat (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) pentru a da compusul din titlu (1,1g, 97%). ¹H RMN (400 MHz, DMSO) δ 11,96 (s, 1H), 8,82 - 8,66 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,19 - 8,02 (d, *J* = 2,0 Hz, 1H), 8,02 - 7,80 (d, *J* = 2,8 Hz, 1H), 7,70 - 7,45 (m, 2H), 7,33 - 7,14 (m, 1H).

Etapă B: 6-(3,5-Difluorofenil)-3-iodo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-carboxilat de *tert*-butil. La o soluție 6-(3,5-difluorofenil)-3-iodo-1H-pirololo[3,2-b]piridină (1,13g, 3,2mmol) în DCM (10mL) s-a adăugat DMAP (39mg, 0,32mmol) urmat de BOC-anhidridă (0,82mL, 3,8mmol). Amestecul de reacție a fost agitat timp de o oră. S-au adăugat apă (25mL) și EtOAc (25mL). Organicele au fost extras, combinate, uscate (MgSO₄), filtrate și concentrate sub presiune redusă. Purificarea (SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (946mg, 65%). MS(ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₅F₂N₂O₂, 456,04; *m/z* găsit, 457,05.

Etapă C: 6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină. La o soluție de 6-(3,5-difluorofenil)-3-iodo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-carboxilat de *tert*-butil (500mg, 1,1 mmol) în DMF (5mL) s-a adăugat cupru (208mg, 3,3mmol) și trifluorometansulfonat de difenil(trifluorometil)sulfoniu (886mg, 2,2mmol). Amestecul a fost refluxat la 90 °C timp de 12 ore. Masa de reacție a fost diluată cu apă (5 mL) și concentrată pe silicagel. Purificarea (FCC, SiO₂, EtOAc 0-100% în hexani) a dat compusul din titlu (177mg, 54%). MS(ESI): masă calc. pentru C₁₄H₇F₅N₂, 298,2; *m/z* găsit, 299,1.

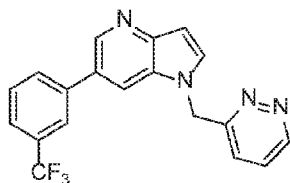
Etapă D: 2-(6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. La o soluție de 6-(3,5-difluorofenil)-3-(trifluorometil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină (15 mg, 0,05 mmol) în DMF (0,5 mL) la 0 °C s-a adăugat NaH (6,0 mg, 0,15 mmol, dispersie 60% în ulei). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 30 minute și apoi răcit la 0 °C urmat de adăugarea unei soluții de 1-(azetidină-1-il)-2-bromoetanonă (10 mg, 0,06 mmol) în DMF (0,5 mL). Amestecul de reacție a fost încălzit la temperatura camerei și agitat timp de 12 ore. S-a adăugat apă și amestecul a fost extras cu EtOAc. Straturile organice combinate au fost uscate (MgSO₄), filtrate și concentrate sub presiune redusă. Purificarea prin HPLC Metoda A a dat compusul din titlu (1,7 mg, 8,8%). MS (ESI): masă calc. pentru C₁₈H₁₄F₅N₃O, 383,1; *m/z* găsit, [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CD₃OD) δ 8,82 - 8,50 (d, 1H), 8,34 - 8,15 (d, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,51 - 7,29 (d, *J* = 8,4 Hz, 3H), 7,11 - 6,91 (m, 1H), 5,37 (s, 2H), 3,22 (s, 2H), 2,99 (s, 2H).

Exemplul 612: 3-Cloro-1-(3-piridilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridină.



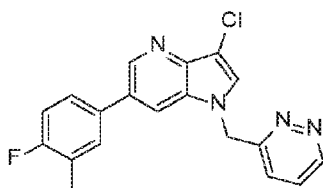
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, utilizând 3-cloro-6-(3-(trifluorometil)fenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină și bromhidrat de 3-(bromometil)piridină în Etapa C. MS (ESI): masă calc. pentru C₂₀H₁₃ClF₃N₃, 387,1; *m/z* găsit, 388,0 [M+H]⁺. ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ 5,40 (s, 2 H) 7,27 - 7,32 (m, 1 H) 7,36 - 7,44 (m, 2 H) 7,56 - 7,69 (m, 2 H) 7,72 (d, *J* = 1,85 Hz, 1 H) 7,76 (d, *J* = 7,63 Hz, 1 H) 7,80 (s, 1 H) 8,49 - 8,67 (m, 2 H) 8,79 (d, *J* = 1,85 Hz, 1 H)

Exemplul 613: 1-(Piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridină.



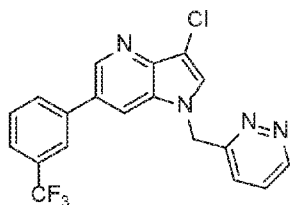
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, utilizând 6-(3-(trifluorometil)fenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină și 3-(clorometil)piridazină în Etapa C. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{13}F_3N_4$, 354,1; m/z găsit, 355,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5,77 (s, 2 H) 6,88 (dd, $J=3,24$, 0,69 Hz, 1 H) 6,98 (dd, $J=8,55$, 1,39 Hz, 1 H) 7,28 - 7,44 (m, 1 H) 7,50 - 7,65 (m, 3 H) 7,72 - 7,84 (m, 3 H) 8,74 (d, $J=1,85$ Hz, 1 H) 9,15 (dd, $J=4,97$, 1,50 Hz, 1 H)

Exemplul 614: 3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină.



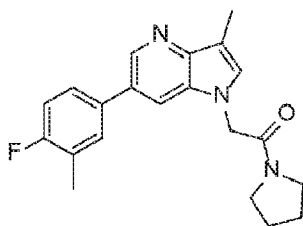
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, utilizând 3-cloro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină și clorhidrat de 3-(clorometil)piridazină în Etapa C. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{14}ClFN_4$, 352,1; m/z găsit, 353,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 2,35 (d, $J=1,16$ Hz, 3 H) 5,71 (s, 2H) 7,09 (s, 2 H) 7,28 - 7,38 (m, 2 H) 7,39 - 7,45 (m, 1 H) 7,49 (s, 1 H) 7,72 (d, $J=1,62$ Hz, 1 H) 8,75 (d, $J=1,16$ Hz, 1 H) 9,16 (d, $J=4,86$ Hz, 1 H)

Exemplul 615: 3-Cloro-1-(piridazin-3-ilmetil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină.



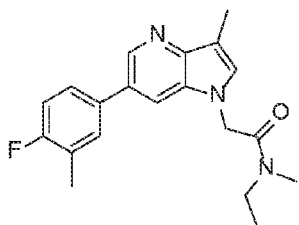
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 1, utilizând 3-cloro-6-(3-(trifluorometil)fenil)-1H-pirololo[3,2-b]piridină și clorhidrat de 3-(clorometil)-piridazină în Etapa C. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{12}ClF_3N_4$, 388,1; m/z găsit, 389,1 $[M+H]^+$. ^1H RMN (400 MHz, $CDCl_3$) δ 5,74 (s, 2 H) 7,09 (dd, $J=8,55$, 1,62 Hz, 1 H) 7,45 (dd, $J=8,55$, 5,09 Hz, 1 H) 7,54 (s, 1 H) 7,56 - 7,70 (m, 2 H) 7,75 (s, 1 H) 7,78 - 7,86 (m, 2 H) 8,80 (d, $J=1,85$ Hz, 1 H) 9,18 (dd, $J=4,85$, 1,62 Hz, 1 H)

Exemplul 616: 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



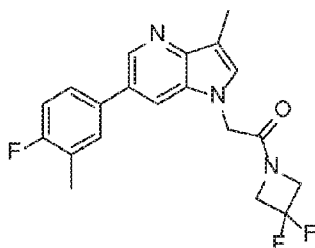
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27, înlocuind acidul (4-fluorofenil)boronic cu acid (4-fluoro-3-metilfenil)boronic în Etapa A. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{22}FN_3O$, 351,2; m/z găsit, 352 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,58 (s, 1H), 8,01 (s, 1H), 7,64 (d, $J=7,4$ Hz, 1H), 7,60 - 7,48 (m, 1H), 7,34 (s, 1H), 7,25 (t, $J=9,1$ Hz, 1H), 5,09 (s, 2H), 3,58 (t, $J=6,7$ Hz, 2H), 3,31 - 3,25 (m, 3H), 2,33 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 2,05 - 1,88 (m, 2H), 1,86 - 1,72 (m, 2H).

Exemplul 617: N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă.



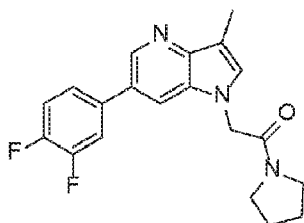
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{22}FN_3O$, 339,2; m/z găsit, 340 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,58 (s, 1H), 7,98 (d, $J = 5,5$ Hz, 1H), 7,63 (d, $J = 6,9$ Hz, 1H), 7,59 - 7,48 (m, 1H), 7,35 (d, $J = 8,4$ Hz, 1H), 7,25 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,19 (s, 0,8H), 5,15 (s, 1,2H), 3,52 - 3,42 (m, 1,2H), 3,30 - 3,24 (m, 0,8H), 3,08 (s, 1,8H), 2,82 (s, 1,2H), 2,33 (s, 3H), 2,29 (s, 3H), 1,22 (t, 1,2H), 1,02 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,8H).

Exemplul 618: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



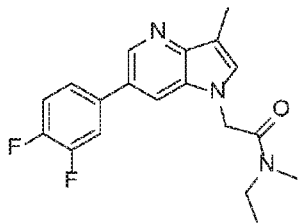
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,60 (s, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,64 (d, $J = 7,4$ Hz, 1H), 7,60 - 7,51 (m, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,26 (t, $J = 9,1$ Hz, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,70 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 4,36 (t, $J = 12,5$ Hz, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 619: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



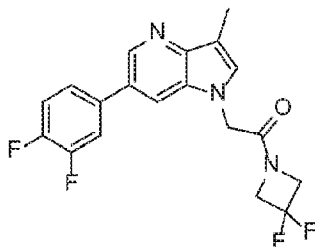
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,64 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,90 - 7,76 (m, 1H), 7,65 - 7,47 (m, 2H), 7,38 (s, 1H), 5,09 (s, 2H), 3,58 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 3,30 - 3,21 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,03 - 1,89 (m, 2H), 1,87 - 1,70 (m, 2H).

Exemplul 620: 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă.



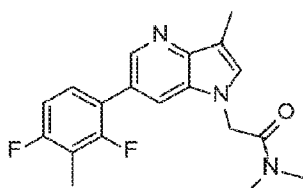
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}F_2N_3O$, 343,1; m/z găsit, 344 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,63 (s, 1H), 8,07 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,89 - 7,77 (m, 1H), 7,64 - 7,47 (m, 2H), 7,38 (d, $J = 8,3$ Hz, 1H), 5,19 (s, 0,9H), 5,16 (s, 1,1H), 3,54 - 3,41 (m, 1,1H), 3,30 - 3,24 (m, 0,9H), 3,09 (s, 1,7H), 2,82 (s, 1,3H), 2,29 (s, 3H), 1,23 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,3H), 1,02 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,7H).

Exemplul 621: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



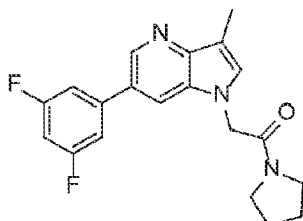
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{15}F_4N_3O$, 377,1; m/z găsit, 378 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,65 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,91 - 7,76 (m, 1H), 7,65 - 7,47 (m, 2H), 7,39 (s, 1H), 5,06 (s, 2H), 4,70 (t, $J = 12,2$ Hz, 2H), 4,36 (t, $J = 12,6$ Hz, 2H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 622: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



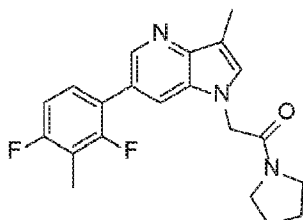
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{19}F_2N_3O$, 343,1; 343 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,41 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,48 - 7,32 (m, 2H), 7,19 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,08 (s, 3H), 2,84 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,24 (s, 3H).

Exemplul 623: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



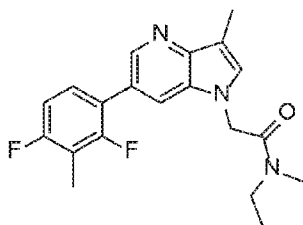
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; m/z găsit, 356 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,66 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,66 (d, $J = 1,8$ Hz, 1H), 7,23 - 7,08 (m, 3H), 6,85 - 6,74 (m, 1H), 4,83 (s, 2H), 3,58 - 3,42 (m, 4H), 2,44 (s, 3H), 2,12 - 1,97 (m, 2H), 1,96 - 1,82 (m, 2H).

Exemplul 624: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



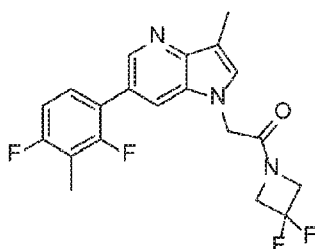
Compusul din titlu a fost preparat intr-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{21}H_{21}F_2N_3O$, 369,2; m/z găsit, 370 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,45 (s, 1H), 7,98 (s, 1H), 7,50 - 7,37 (m, 2H), 7,20 (t, $J = 8,8$ Hz, 1H), 5,09 (s, 2H), 3,56 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 3,29 - 3,17 (m, 2H), 2,31 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 2,03 - 1,86 (m, 2H), 1,86 - 1,70 (m, 2H).

Exemplul 625: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-piolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă.



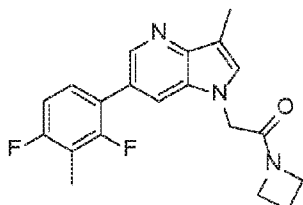
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{21}F_2N_3O$, 357,2; m/z găsit, 358 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,42 (s, 1H), 7,89 (d, $J = 6,9$ Hz, 1H), 7,49 - 7,34 (m, 2H), 7,19 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 5,18 (s, 0,8H), 5,14 (s, 1,2H), 3,52 - 3,38 (m, 2H), 3,06 (s, 1,8H), 2,81 (s, 1,2H), 2,30 (s, 3H), 2,24 (s, 3H), 1,20 (t, $J = 6,9$ Hz, 1,2H), 1,01 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,8H).

Exemplul 626: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



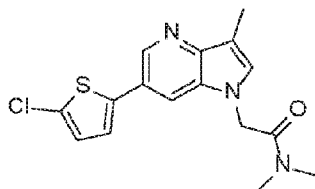
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{17}F_4N_3O$, 391,1; m/z găsit, 392 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,44 (s, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,54 - 7,34 (m, 2H), 7,20 (s, 1H), 5,05 (s, 2H), 4,82 - 4,61 (m, 2H), 4,45 - 4,24 (m, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,24 (s, 3H).

Exemplul 627: 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



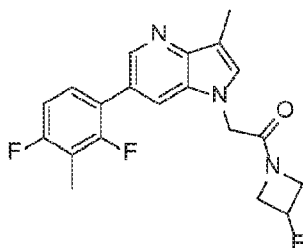
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{19}F_2N_3O$, 355,1; 356 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,43 (s, 1H), 7,90 (s, 1H), 7,50 - 7,35 (m, 2H), 7,20 (t, $J = 8,7$ Hz, 1H), 4,90 (s, 2H), 4,18 (t, $J = 7,4$ Hz, 2H), 3,88 (t, $J = 7,5$ Hz, 2H), 2,30 (s, 3H), 2,28 - 2,18 (m, 5H).

Exemplul 628: 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.



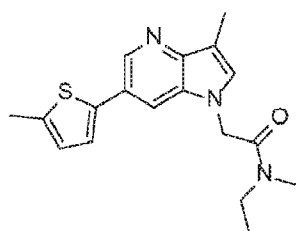
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{16}ClN_3OS$, 333,1; 334 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, DMSO- d_6) δ 8,56 (s, 1H), 7,99 (s, 1H), 7,40 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 7,36 (s, 1H), 7,18 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 5,16 (s, 2H), 3,11 (s, 3H), 2,86 (s, 3H), 2,27 (s, 3H).

Exemplul 629: 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



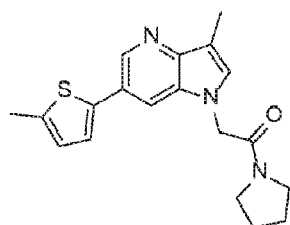
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{20}H_{18}F_3N_3O$, 373,1; m/z găsit, 374 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,61 (s, 1H), 7,68 (s, 1H), 7,38 - 7,27 (m, 1H), 7,15 (s, 1H), 6,96 (t, $J = 8,5$ Hz, 1H), 5,42 - 5,21 (m, 1H), 4,76 (s, 2H), 4,42 - 4,07 (m, 2H), 3,99 - 3,74 (m, 2H), 2,45 (s, 3H), 2,28 (s, 3H), 1,60 (s, 3H).

Exemplul 630: N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



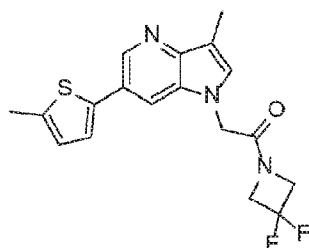
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{21}N_3OS$, 327,1; m/z găsit, 328 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,55 (s, 1H), 7,88 (d, $J = 7,7$ Hz, 1H), 7,37 - 7,26 (m, 2H), 6,84 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 5,16 (s, 0,8H), 5,13 (s, 1,2H), 3,52 - 3,40 (m, 2H), 3,08 (s, 1,8H), 2,82 (s, 1,2H), 2,48 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,22 (t, $J = 7,0$ Hz, 1,2H), 1,02 (t, $J = 7,1$ Hz, 1,8H).

Exemplul 631: 2-[3-Metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă.



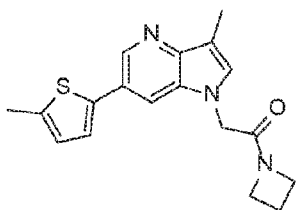
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{21}N_3OS$, 339,1; m/z găsit, 340 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,55 (s, 1H), 7,94 (s, 1H), 7,36 - 7,27 (m, 2H), 6,84 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 5,07 (s, 2H), 3,58 (t, $J = 6,7$ Hz, 2H), 3,30 - 3,24 (m, 2H), 2,48 (s, 3H), 2,27 (s, 3H), 1,95 (dd, $J = 13,3, 6,7$ Hz, 2H), 1,82 (dd, $J = 13,4, 6,7$ Hz, 2H).

Exemplul 632: 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



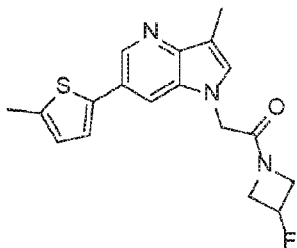
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{17}F_2N_3OS$, 361,1; m/z găsit, 362 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,69 (s, 1H), 7,70 (s, 1H), 7,17 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,12 (s, 1H), 6,77 (d, $J = 2,5$ Hz, 1H), 4,85 (s, 2H), 4,38 (t, $J = 11,9$ Hz, 2H), 4,03 (t, $J = 11,3$ Hz, 2H), 2,53 (s, 3H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 633: 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



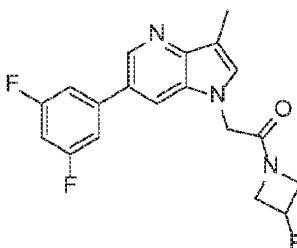
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{19}N_3OS$, 325,1; m/z găsit, 326 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,72 (s, 1H), 7,64 (s, 1H), 7,20 - 7,00 (m, 2H), 6,77 (s, 1H), 4,68 (s, 2H), 4,07 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 3,77 (t, $J = 7,6$ Hz, 2H), 2,53 (s, 3H), 2,41 (s, 3H), 2,22 (dd, $J = 15,3, 7,7$ Hz, 2H).

Exemplul 634: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



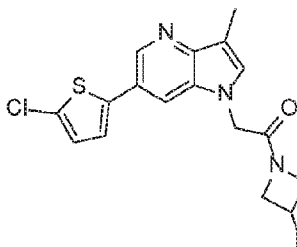
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{18}H_{18}FN_3OS$, 343,1; m/z găsit, 344 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,73 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,61 (d, $J = 1,5$ Hz, 1H), 7,15 (d, $J = 3,4$ Hz, 1H), 7,09 (s, 1H), 6,77 (d, $J = 2,3$ Hz, 1H), 5,27 (dd, $J = 9,7, 5,1$ Hz, 0,5H), 5,13 - 5,01 (m, 0,5H), 4,74 (s, 2H), 4,41 - 4,08 (m, 2H), 3,85 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 3,78 (d, $J = 4,2$ Hz, 1H), 2,53 (s, 3H), 2,41 (s, 3H).

Exemplul 635: 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirollo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



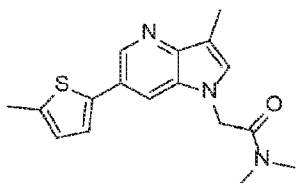
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{16}F_3N_3O$, 359,1; m/z găsit, 360 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,72 (s, 1H), 8,19 (s, 1H), 7,54 (d, $J = 7,6$ Hz, 2H), 7,42 (s, 1H), 7,23 (t, $J = 9,4$ Hz, 1H), 5,60 - 5,51 (m, 0,5H), 5,41 - 5,30 (m, 0,5H), 5,00 (s, 2H), 4,62 - 4,43 (m, 1H), 4,38 - 4,14 (m, 2H), 4,05 - 3,86 (m, 1H), 2,30 (s, 3H).

Exemplul 636: 2-[6-(5-Chloro-2-tienil)-3-metil-pirollo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă.



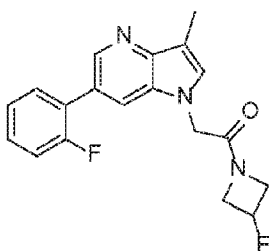
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{15}ClFN_3OS$, 363,1; m/z găsit, 364 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,59 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 8,00 (d, $J = 1,4$ Hz, 1H), 7,45 - 7,35 (m, 2H), 7,19 (d, $J = 3,9$ Hz, 1H), 5,61 - 5,48 (m, 0,5H), 5,41 - 5,30 (m, 0,5H), 4,98 (s, 2H), 4,64 - 4,45 (m, 1H), 4,40 - 4,15 (m, 2H), 4,06 - 3,85 (m, 1H), 2,28 (s, 3H).

Exemplul 637: N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă.



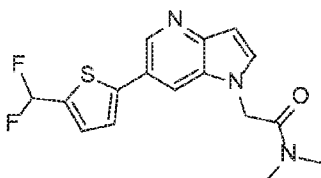
Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{17}H_{19}N_3OS$, 313,1; m/z găsit, 314 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $CDCl_3$) δ 8,69 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 7,58 (d, $J = 1,6$ Hz, 1H), 7,13 - 7,06 (m, 2H), 6,75 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 4,86 (s, 2H), 3,09 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,52 (s, 3H), 2,40 (s, 3H).

Exemplul 638: 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă.



Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Exemplul 27. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{19}H_{17}F_2N_3O$, 341,1; m/z găsit, 342 $[M+H]^+$. ^1H RMN (300 MHz, $DMSO-d_6$) δ 8,48 (s, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,58 (t, $J = 7,8$ Hz, 1H), 7,50 - 7,27 (m, 4H), 5,53 (s, 0,5H), 5,34 (s, 0,5H), 4,98 (s, 2H), 4,59 - 4,43 (m, 1H), 4,37 - 4,13 (m, 2H), 3,95 (dd, $J = 24,6, 11,6$ Hz, 1H), 2,31 (s, 3H).

Exemplul 639: 2-[6-[5-(Difluorometil)-2-tienil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă.



Etapă A: 2-(6-Bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. Compusul din titlu a fost preparat într-un mod analog cu Intermediarul 10, utilizând 6-bromo-1H-pirololo[3,2-b]piridină și 2-bromo-N,N-dimetilacetamidă. MS (ESI): masă calc. pentru $C_{11}H_{12}BrN_3O$, 281,1; m/z găsit, 282,05 $[M+H]^+$.

Etapă B: 2-(6-[5-(Difluorometil)tiofen-2-il]-1H-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetilacetamidă. La o soluție de 2-bromo-5-(difluorometil)tiofen (100 mg, 0,47 mmol) în dioxan (2 mL) s-a adăugat bis(pinacolato)diboron (143 mg, 0,56 mmol), $PdCl_2(dppf)$, CH_2Cl_2 (35 mg, 0,05 mmol), KOAc (138 mg, 1,40 mmol). Amestecul de reacție rezultat a fost încălzit la 90 °C într-un vas etanșat și agitat timp de două ore. Amestecul de reacție a fost răcit la temperatura camerei apoi intermediarul din Etapa A (50 mg, 0,18 mmol) a fost ulterior adăugat urmat de CS_2CO_3 (115 mg, 0,352 mmol) și cantități suplimentare de $PdCl_2(dppf)$, CH_2Cl_2 (35 mg, 0,05 mmol) și dioxan (3 mL). Amestecul de reacție a fost din nou încălzit la 90 °C și agitat timp de două ore într-un vas etanșat. Masa de reacție a fost răcită la temperatura camerei și spălată cu soluție saturată de $NaHCO_3$. Stratul organic a fost izolat apoi uscat pe Mg_2SO_4 , filtrat și conc. într-un reziduu maro care a fost purificat prin cromatografie pe silicagel (NH_3 2M/MeOH 0-7% în DCM) pentru a furniza compusul din titlu (45 mg, 30%). MS (ESI): masă calc. pentru $C_{16}H_{15}F_2N_3OS$, 335,3; m/z găsit, 335,9 $[M+H]^+$. ^1H RMN (500 MHz, $CDCl_3$) δ 8,76 - 8,71 (d, $J = 2,0$ Hz, 1H), 7,71 - 7,66 (m, 1H), 7,37 - 7,33 (d, $J = 3,3$ Hz, 1H), 7,28 - 7,23 (m, 2H), 6,97 - 6,72 (m, 2H), 4,96 - 4,89 (s, 2H), 3,14 - 3,09 (s, 3H), 3,04 - 2,97 (s, 3H).

TESTE BIOLOGICE

Inhibarea legării specifice la receptorul NR1/NR2B de șobolan

Testul depinde de legarea unui traser la receptorii NMDA care conțin subunitatea GluN2B și de capacitatea compușilor de testare de a deplasa o astfel de legare. 3- $[^3H]$ 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă este un antagonist selectiv al GluN2B cu afinitate ridicată, care se leagă de site-ul de legare Ifenprodil situat la interfața dintre subunitățile GluN1 și GluN2B. Alternativ, testul măsoară afinitatea de legare pentru liganzii care

- concorează pentru site-ul de legare a Ifenprodil în receptorii NMDA nativi de la membranele corticale de șobolan adult. Pe scurt, cortexul de șobolan adult este omogenizat în tamponul de testare (Tris 50 mM; pH 7,4). Membranele corticale rezultate conținând receptori NMDA nativi sunt purificate prin centrifugare și spălate intens, apoi re-suspendate în tamponul de testare.
- 5 Compușii testați, trăsorul și membranele se amestecă împreună și se incubează cu agitare timp de 2 ore la temperatura camerei pentru a ajunge la echilibrul de legare. Legarea nespecifică a trăsorului este determinată prin pre-incubarea membranelor creierului cu CP 101,606 de 10 μ M. După incubare, trăsorul legat și nelegat este separat prin filtrare cu recoltatorul de celule și plăcile de filtru GF/B (PerkinElmer) umezite cu polietilenimină. Mărimea legării este măsurată prin
- 10 numărarea radioactivității [^{3} H] reținută pe plăcile de filtru cu un contor de scintilație de lichid. Afinitatea de legare (constanta de disociere la echilibru, K_i) pentru compușii testați este determinată prin fitarea datelor experimentale cu următorul model
- $$\log EC_{50} = \log(10^{\log K_i} (1 + [\text{Radioligand}] / \text{HotKd})) \text{ și } Y = \text{Bază} + (\text{Vârf} - \text{Bază}) / (1 + 10^{(X - \log EC_{50})})$$
- unde [Radioligand] este concentrația de trăsor, HotKdNM este constanta de disociere la echilibru a trăsorului, Vârf și Bază sunt platourile curbei în unitățile axei Y.
- 15

HNR2BC: Efectele articolelor de testare asupra canalelor de ioni NR1/NR2B clonate umane exprimate în celule de mamifere

- Receptorii NMDA sunt canale ionice care sunt foarte permeabile la ioni Ca^{2+} , ceea ce face posibilă monitorizarea funcției receptorului NMDA folosind analiza fluxului de calciu pe
- 20 bază de celule. În acest test, co-agoniștii glutamat și glicină se adaugă la celule heteroloage care exprimă receptori GluN1/GluN2B NMDA umani pentru a iniția influxul celular al Ca^{2+} . Perioada de modificare a calciului intracelular este măsurată folosind un colorant fluorescent și un dispozitiv FLIPR (Fluorometric Imaging Reader Plate).
- Cu douăzeci și patru de ore înainte de măsurători, expresia receptorilor NMDA din linia celulară
- 25 stabilă este indusă cu un sistem inductibil Tet-On în prezența unui blocant neselectiv al receptorului NMDA. În ziua experimentului, mediul de cultură celulară este spălat cu atenție, iar celulele sunt încărcate cu kitul colorant de calciu 5 (Molecular Devices) într-un tampon de încărcare a colorantului care conține NaCl 137 mM, KCl 4 mM, CaCl_2 2 mM, MgCl_2 0,5 mM, HEPES 10 mM și D-glucoză 5 mM; pH 7,4. După 1h de incubare la temperatura camerei, colorantul este îndepărtat prin spălare cu tampon de testare (NaCl 137 mM, KCl 4 mM, CaCl_2 2 mM, EDTA 0,01 mM, HEPES 10 mM și D-glucoză 5 mM; pH 7,4) în cititorul FLIPR TETRA, la
- 30 celule se adaugă diferite concentrații de compuși de testare în timp de 5 min, timp în care fluorescența este monitorizată pentru a detecta activitatea agonistă potențială. În continuare, se adaugă co-agoniștii glutamat și glicină în timp de încă 5 minute. Concentrația de glutamat care
- 35 corespunde la EC_{80} este utilizată pentru a maximiza fereastra de semnal a testului și capacitatea de a detecta antagoniștii receptorilor NMDA și modulatorii alosterici negativi. O concentrație saturantă (10 μ M) de glicină este de asemenea prezentă în analiză. Un antagonist neselectiv al receptorului NMDA, (+)MK-801 este utilizat drept control pozitiv pentru activitatea de antagonist. Semnalul fluorescent în prezența compușilor testați este cuantificat și normalizat la semnalul
- 40 adecvat definit de godeurile de control.

Tabelul 5.

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
1	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;	6,5
2	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	6,9
3	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
4	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,3
5	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;	6,7
6	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,3
7	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,8
8	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
9	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,2
10	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	7,3
11	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,6
12	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,4
13	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,3
14	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;	6,9
15	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,4
16	2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;	7,1

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
17	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	7,3
18	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
19	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,5
20	2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,3
21	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	7,4
22	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
23	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,3
24	2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,0
25	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,1
26	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
27	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,3
28	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,7
29	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
30	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
31	2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	5,5
32	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
33	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
34	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,8
35	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,7
36	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,0
37	2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,0
38	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	5,3
39	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,5
40	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,3
41	1-(Azetidin-1-il)-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
42	2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;	5,6
43	N-Ciclopropil-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;	NT
44	2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,7
45	2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,3
46	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,3
47	1-(Azetidin-1-il)-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,1
48	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,2
49	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,7
50	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
51	N-Ciclopropil-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,2
52	2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;	5,9
53	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	5,3
54	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
55	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,5
56	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,3
57	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,5
58	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,6
59	3-[[6-(4-Fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;	7,4
60	5-Metil-3-[[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;	7,0

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
61	Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;	6,4
62	Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;	6,9
63	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;	6,7
64	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;	7,2
65	Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;	7,1
66	Sare trifluoroacetat de N-ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
67	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	5,3
68	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
69	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
70	Acid 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic;	7,3
71	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,1
72	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
73	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
74	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
75	N-Ciclopropil-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,3
76	N-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,0
77	N-Ciclopropil-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
78	2-(6-Fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;	5,8
79	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,1
80	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,5
81	2-[6-(m-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,5
82	2-[6-(p-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,2
83	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,6
84	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,1
85	1-Morfolino-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,2
86	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,3
87	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,0
88	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,6
89	1-Morfolino-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
90	1-Morfolino-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
91	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	5,8
92	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
93	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
94	2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
95	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
96	2-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
97	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
98	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
99	N-Ciclopropil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,2
100	N-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,0
101	N-Ciclopropil-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
102	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
103	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
104	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
105	2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,4
106	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,5
107	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,8

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
108	2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,9
109	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
110	N-Ciclopropil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
111	N-Ciclopropil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
112	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-metil-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,3
113	5-[1-[2-(Azetidin-1-il)-2-oxo-etil]pirolo[3,2-b]piridin-6-il]piridin-2-carbonitril;	5,3
114	6-(3,4-Difluorofenil)-1-(pirimidin-5-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	<5
115	6-(3,4-Difluorofenil)-1-[(5-fluoropirimidin-2-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;	6,5
116	Ciclobutil-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metanonă;	6,1
117	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,3
118	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
119	2-Ciclopropil-1-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
120	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
121	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
122	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,4
123	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
124	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
125	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,5
126	1-Morfolino-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
127	1-Morfolino-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
128	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
129	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,6
130	6-(4-Metil-2-tienil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,7
131	6-(3,4-Difluorofenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,9
132	2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,9
133	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
134	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
135	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
136	1-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
137	6-(4-Metil-2-tienil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;	7,7
138	6-(3,4-Difluorofenil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;	NT
139	N,N-Dimetil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	NT
140	1-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;	7,5
141	1-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;	6,4
142	1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;	6,3
143	3,3-Dimetil-1-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	6,1
144	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;	5,7
145	1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;	6,3
146	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,0
147	2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
148	2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
149	2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
150	2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
151	2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
152	2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
153	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,2
154	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
155	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
156	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
157	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
158	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;	6,2
159	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
160	N-Ciclopropil-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
161	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
162	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
163	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
164	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
165	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
166	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
167	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
168	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
169	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
170	Sare trifluoroacetat de 1-butil-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,5
171	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-izopentil-pirolo[3,2-b]piridină;	6,7
172	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(3-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,1
173	Sare trifluoroacetat de 1-(ciclobutilmetil)-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,2
174	Sare trifluoroacetat de 1-(ciclopropilmetil)-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,8
175	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,3
176	Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	7,5
177	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,5
178	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,5
179	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(4-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,3
180	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,1
181	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-pirazol-1-iletil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,1
182	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,4
183	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(pirimidin-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,5
184	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxetan-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,3
185	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
186	Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
187	Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,3
188	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-1-piperidil)etanonă;	7,3
189	Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
190	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-metoxi-1-piperidil)etanonă;	6,6
191	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-	6,5

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
	fluoro-1-piperidil)etanonă;	
192	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[4-(fluorometil)-1-piperidil]etanonă;	7,1
193	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(1-piperidil)etanonă;	6,1
194	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(2-metilmorfolin-4-il)etanonă;	6,8
195	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(trifluorometil)-1-piperidil]etanonă;	6,4
196	Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(2-etilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,9
197	Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilmorfolin-4-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,8
198	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxipirolidin-1-il)etanonă;	6,0
199	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoro-1-piperidil)etanonă;	6,7
200	Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
201	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;	5,4
202	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-3-metil-azetidin-1-il)etanonă;	6,9
203	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-hidroxi-3-(trifluorometil)azetidin-1-il]etanonă;	6,4
204	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,8
205	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	7,3
206	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(hidroximetil)azetidin-1-il]etanonă;	6,5
207	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă;	6,5
208	Sare trifluoroacetat de 1-(5-azaspiro[2.3]hexan-5-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,5
209	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-4-metil-1-piperidil)etanonă;	6,7
210	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilmorfolin-4-il)etanonă;	6,4
211	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiazetidin-1-il)etanonă;	6,4
212	1-[2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]azetidin-3-carbonitril;	6,5
213	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
214	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilazetidin-1-il)etanonă;	7,0
215	1-(3,3-Dimetilazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
216	Sare trifluoroacetat de 1-[2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]pirolidin-3-onă;	5,9
217	1-(3,3-Difluoropirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,5
218	(R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxipirolidin-1-il)etanonă;	6,4
219	1-Ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,3
220	1-Ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,3
221	1-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
222	1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
223	1-[6-(4-Fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,1
224	1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	6,4
225	1-[6-(2,3-Dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,1
226	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-fenil-etanonă;	6,7
227	1-(4-Fluorofenil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,1
228	Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluorofenil)-1-(tetrahidropiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	6,2
229	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izopropil-acetamidă;	6,3
230	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-propil-acetamidă;	5,3

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
231	(R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2,2,2-trifluoro-1-metil-etil)acetamidă;	5,7
232	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(1-metilciclopropil)acetamidă;	5,0
233	N-(2-Fluoroetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	4,8
234	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izobutil-acetamidă;	5,6
235	5-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;	4,9
236	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;	6,7
237	N-(Ciclopropilmetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	5,7
238	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metiltriazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;	5,5
239	5-[[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;	6,8
240	3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;	6,3
241	2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclobutil-etanonă;	5,3
242	1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,1
243	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
244	Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	6,2
245	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
246	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;	7,0
247	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,5
248	N-Ciclopropil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,2
249	N-Ciclopropil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,1
250	N-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
251	N-Benzil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,3
252	2-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]oxazol;	5,3
253	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-hidroxietyl)acetamidă;	7,1
254	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-metoxietyl)acetamidă;	5,9
255	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,4
256	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
257	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	6,9
258	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
259	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
260	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
261	Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
262	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
263	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
264	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
265	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
266	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il];	6,9
267	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
268	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)	7,1

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
	il)etanonă;	
269	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
270	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,4
271	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
272	(R/S)-1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-ol;	7,6
273	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxiacetidin-1-il)etanonă;	6,0
274	(R/S)-1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanol;	7,2
275	Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-ciclopropil-1-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]propan-2-ol;	6,8
276	1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metoxi-etanamină;	6,3
277	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,5
278	1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
279	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
280	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
281	2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
282	2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,1
283	2-[6-(5-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,7
284	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
285	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,8
286	Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanon oximă;	6,8
287	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,2
288	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,7
289	(R/S)-1-(2-Ciclopropil-2-fluoro-etil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,1
290	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă;	6,2
291	Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-metoxietil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,1
292	1-Ciclobutil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,9
293	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;	7,5
294	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3S)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;	6,5
295	Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	6,5
296	N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	7,6
297	N,N-Dietil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,4
298	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,3
299	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;	7,3
300	2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropil-etanonă;	7,7
301	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
302	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
303	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
304	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	6,8
305	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,1
306	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
307	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
308	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
309	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
310	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,3
311	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
	il)etanonă;	
312	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
313	2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,7
314	2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,2
315	2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,1
316	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
317	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
318	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;	7,7
319	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
320	1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
321	1-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
322	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
323	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
324	1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,0
325	1-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	6,7
326	1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	6,7
327	1-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,2
328	1-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,2
329	1-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	6,3
330	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfanilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,2
331	(R/S)-6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfinilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	5,4
332	6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	5,8
333	1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	5,2
334	1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,6
335	1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,9
336	1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,7
337	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,8
338	1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,8
339	1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,9
340	4-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;	7,9
341	1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	6,0
342	1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,3
343	1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,2
344	1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,3
345	1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,5
346	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;	7,4
347	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
348	N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,5
349	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
350	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,8
351	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,1
352	Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,4
353	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
354	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
355	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
356	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
357	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
358	Sare trifluoroacetat de 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
359	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
	il]etanonă;	
360	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
361	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
362	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
363	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
364	1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;	7,7
365	1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
366	N-Ciclopropil-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,5
367	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,3
368	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
369	2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,7
370	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
371	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
372	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,8
373	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
374	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
375	N,N-Dimetil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,9
376	2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,7
377	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	8,0
378	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	8,2
379	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
380	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	8,0
381	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
382	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
383	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
384	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;	7,7
385	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
386	Sare trifluoroacetat de N,N-dimetil-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
387	2-[3-Fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
388	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,1
389	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
390	2-[3-Fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,5
391	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
392	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
393	2-[6-(5-Etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
394	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
395	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
396	2-[6-(4-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,3
397	Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
398	Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
399	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
400	N,N-Dimetil-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,3
401	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoropirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
402	Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
403	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
404	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-metiltiazol-5-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
405	1-(Azetidin-1-il)-2-(6-tiazol-5-ylpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	5,0
406	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-fluoro-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	NT
407	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	5,2
408	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
409	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
410	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,5
411	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;	7,6
412	2-[3-Cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	5,1
413	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,3
414	2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
415	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;	7,2
416	2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	5,6
417	2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
418	2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,3
419	N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	7,2
420	2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,2
421	2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,2
422	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
423	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
424	2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,5
425	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,5
426	2-[6-(5-Cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
427	2-[6-(2,5-Dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
428	N,N-Dimetil-2-[6-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,0
429	2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,1
430	2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
431	2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,6
432	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,1
433	N,N-Dimetil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;	7,6
434	N,N-Dimetil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,0
435	N,N-Dimetil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,3
436	2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
437	N,N-Dimetil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,5
438	N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
439	2-[6-(5-Cloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
440	2-[6-(2,5-Dicloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
441	N,N-Dimetil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,0
442	N,N-Dimetil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,8
443	N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
444	2-[6-(2,6-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,2
445	2-[6-(2-Fluoro-5-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,4
446	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
447	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,7
448	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,7
449	2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
450	2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
451	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
452	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
453	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
454	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
455	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
456	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
457	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
458	2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,4
459	N-Etil-N-metil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,4
460	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
461	2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;	7,5
462	N-Etil-N-metil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,9
463	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
464	N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	7,9
465	2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,1
466	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
467	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
468	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,8
469	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;	7,8
470	N-Etil-N-metil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,7
471	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
472	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
473	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
474	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,5
475	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
476	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
477	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
478	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)-3-fluoropirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
479	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
480	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
481	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
482	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,8
483	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
484	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,9
485	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
486	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
487	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,3
488	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoropirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,8
489	2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	8,0
490	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
491	2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,8
492	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,6
493	2-[3-Fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,6
494	2-[3-Fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,5
495	2-(3-Fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;	7,9
496	2-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
497	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,5
498	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)-3-fluoropirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
499	2-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,6
500	2-[3-Fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
501	2-[3-Fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
502	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
503	2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,8
504	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,9
505	2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,7
506	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,8
507	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,7
508	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
509	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
510	2-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,4
46	2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
512	2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,5
513	2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
514	2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
515	2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
516	2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,7
517	2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
518	2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
519	2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
520	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
521	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
522	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluoro-3-metilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
523	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
524	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
525	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
526	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-clorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
527	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
528	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-2-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
529	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
530	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
531	2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
532	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
533	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-etilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
534	2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
535	2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,7
536	2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,6
537	2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,9
538	2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,1
539	2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metilfenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,6

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
540	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,6
541	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
542	2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,5
543	2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
544	2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,5
545	2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,9
546	2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
547	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
548	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
549	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
550	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
551	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,2
552	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
553	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,1
554	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
555	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
556	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
557	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;	6,9
558	2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
559	N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	6,8
560	N-Etil-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	6,1
561	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
562	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
563	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metilfenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
564	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metilfenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,0
565	2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il)-etanonă;	6,9
566	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,3
567	2-[3-Metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il)-etanonă;	6,7
568	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,3
569	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,4
570	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,2
571	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,3
572	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	7,1
573	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,9
574	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
575	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
576	N,N-Dimetil-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;	7,0
577	N-Etil-N-metil-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;	6,7
578	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	6,9
579	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	7,2
580	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1
581	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,1

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
582	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
583	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,9
584	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,4
585	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
586	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
587	N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;	6,6
588	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
589	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
590	2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,5
591	2-[3-Metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,9
592	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
593	2-[6-(2-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,6
594	N-Etil-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	6,1
595	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,6
596	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
597	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,5
598	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
599	2-[3-Cloro-6-(2,5-dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
600	2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,1
601	2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,9
602	2-[3-Cloro-6-(5-cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	8,0
603	2-[3-Cloro-6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
604	2-[6-(Benzotiofen-2-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,7
605	2-[3-Fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
606	2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,2
607	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,4
608	2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,7
609	1-(Azetidin-1-il)-2-(3-[³ H]-6-(4-fluoro-3-metilfenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;	NT
610	2-[2-Deuterio-6-(4-fluoro-3-metilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	8,7
611	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	8,0
612	3-Cloro-1-(3-piridilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;	7,5
613	1-(Piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;	5,6
614	3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;	7,5
615	3-Cloro-1-(piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;	7,6
616	2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,5
617	N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;	7,3
618	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metilfenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-	7,5

# Exemplu	Denumire compus	pIC ₅₀
	1-il]etanonă;	
619	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,4
620	2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;	7,6
621	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
622	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
623	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,8
624	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	7,1
625	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metilacetamidă;	7,0
626	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
627	1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,8
628	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	7,0
629	2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	7,4
630	N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,6
631	2-[3-Metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;	6,8
632	1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,7
633	1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	7,3
634	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,2
635	2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,5
636	2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;	6,8
637	N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirol[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;	6,5
638	1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirol[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;	6,9
639	2-[6-[5-(Difluorometil)-2-tienil]pirol[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;	6,7

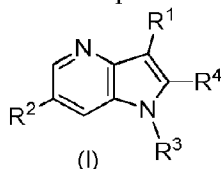
*NT înseamnă că nu s-a testat.

(56) Referințe bibliografice citate în raportul de documentare:

- M. H. BUONARATI ET. AL.: "Role of sulfation and acetylation in the activation of 2-hydroxyamino-1-methyl-6-phenyl-imidazo[4,5-b]pyridine to intermeidates which bind DNA", MUTATION RESEARCH, vol. 245, 1 September 1990 (1990-09-01), pages 185-190, XP002760909,
- WO-A1-03/082868
- WO-A1-2010/043396
- WO-A1-2014/124651
- US-A1- 2007 275 965
- US-A1- 2008 300 239

(57) Revendicări:

1. Un compus având structura cu Formula (I):



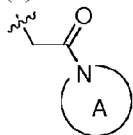
în care:

R¹ este selectat din grupul constând din: H, ³H, halo, alchilC₁₋₃, și haloalchilC₁₋₃;

R² este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchilC₁₋₅, și haloalchilC₁₋₅; piridinil substituit opțional cu halo, alchilC₁₋₅, haloalchilC₁₋₅, și -CN; tiazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchilC₁₋₅, și haloalchilC₁₋₅;

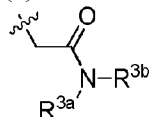
R³ este

(a)



în care inelul A este un heterocicloalchil cu 4-7 membri conținând opțional un heteroatom oxigen suplimentar, selectat din grupul constând din: azetidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchilC₁₋₅, haloalchilC₁₋₅, CH₂OH, alcoxiC₁₋₅, OH, și CN; pirolidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchilC₁₋₅, alcoxiC₁₋₅, și OH; morfolino substituit opțional cu unu sau doi membri alchilC₁₋₅; piperidinil substituit opțional cu unu sau doi membri selectați în mod independent din grupul constând din: halo, alchilC₁₋₅, haloalchilC₁₋₅, alcoxiC₁₋₅, și OH; 3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il; 5-azaspiro[2.3]hexan-5-il; și pirolidin-3-onă; sau

(b)



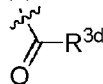
în care R³ᵃ este H, sau alchilC₁₋₅; și R³ᵇ este selectat din grupul constând din: alchilC₁₋₅ substituit opțional cu OH, halo, sau OCH₃; haloalchilC₁₋₅; benzil; CH₂ciclopropil; ciclopropil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; și ciclobutil; sau

(c)



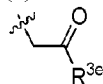
în care R³ᶜ este selectat din grupul constând din: ciclopropil; ciclobutil; pirimidinil substituit opțional cu halo; piridinil; piridazinil; furanil substituit opțional cu haloalchilC₁₋₅; oxazolil; izoxazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; oxadiazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; pirazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; triazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; tetrahydrofuranil; tetrahidropirasil; oxetanil; și oxiranil; sau

(d)



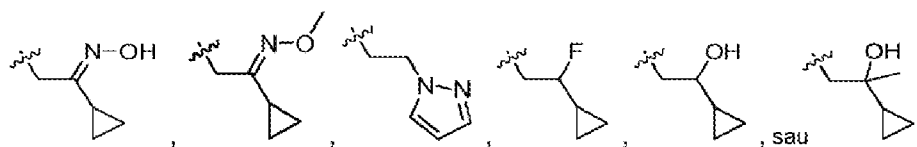
în care R³ᵈ este CH₂-ciclopropil sau ciclobutil; sau

(e)



în care R³ᵉ este selectat din grupul constând din: OH, alchilC₁₋₅, ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; sau

(f) alchilC₁₋₅ substituit opțional cu OH sau alcoxiC₁₋₅; CH₂S(CH₃); CH₂(S=O)CH₃; CH₂(SO₂)CH₃; sau CH₂CH₂(C=O)CH₃; sau (g)



și

 R^4 este H, ^2H sau alchil C_{1-3} ;

sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

2. Compusul conform revendicării 1, în care R^1 este H, Cl, Br, F, sau CH_3 ;

sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

3. Compusul conform revendicării 1, în care R^1 este (i) H; (ii) Cl; sau (iii) CH_3 ;

sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

4. Compusul conform oricăreia dintre revendicările 1 până la 3, în care:

(i) R^2 este fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: Cl, F, CH_3 , CH_2CH_3 , CF_2H , și CF_3 ; piridinil substituit opțional cu F, CN, CH_3 și CF_3 ; tiazolil substituit opțional cu CH_3 ; benzotiofenil; și tienil substituit opțional cu unu, doi sau trei membri selectați în mod independent dintre: Cl, CH_3 , CH_2CH_3 , CHF_2 și CF_3 ;

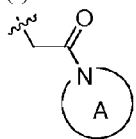
(ii) R^2 este fenil, 2-metilfenil, 3-metilfenil, 4-metilfenil, 3-etilfenil, 3-(difluoro-metil)fenil, 3-(trifluorometil)fenil, 3,5-dimetilfenil, 2,3-dimetilfenil, 2-fluorofenil, 3-fluorofenil, 3-clorofenil, 4-fluorofenil, 2,3-difluorofenil, 2,4-difluorofenil, 3,4-difluorofenil, 3,4-diclorofenil, 2,5-difluorofenil, 3,5-difluorofenil, 3-cloro-2-fluoro-fenil, 3-cloro-4-fluoro-fenil, 2-fluoro-3-metil-fenil, 4-fluoro-2-metil-fenil, 2-metil-3-(trifluorometil)fenil, 2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil, 4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil, 4-fluoro-3-metil-fenil, 2-fluoro-5-metil-fenil, 4-fluoro-2,3-dimetil-fenil, 2,4-difluoro-3-metil-fenil, 2,6-difluoro-3-metil-fenil, 2,3,4-trifluorofenil, 3,4,5-trifluorofenil, 2-tienil, 3-tienil, 5-metil-2-tienil, 4-metil-2-tienil, 5-etil-2-tienil, 5-cloro-2-tienil, 3-cloro-2-tienil, 4-cloro-2-tienil, 5-cloro-3-tienil, 5-(difluorometil)-2-tienil, 5-(trifluorometil)-2-tienil, 2,5-dimetil-3-tienil, 2,5-dicloro-3-tienil, 5-cloro-4-metil-2-tienil, 2,4,5-trimetil-3-tienil, 6-tiazol-5-il, 2-metiltiazol-5-il, 6-metil-3-piridil, 6-fluoro-3-piridil, piridin-2-carbonitril, 2-(trifluorometil)-4-piridil, 5-(trifluorometil)-3-piridil, 6-(trifluorometil)-2-piridil, sau benzotiofen-2-il;

sau

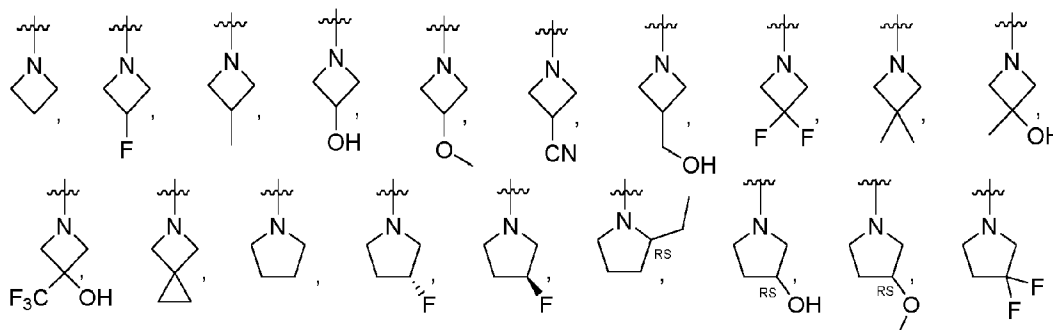
(iii) R^2 este fenil sau tienil, în care the fenil sau tienil este substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ;

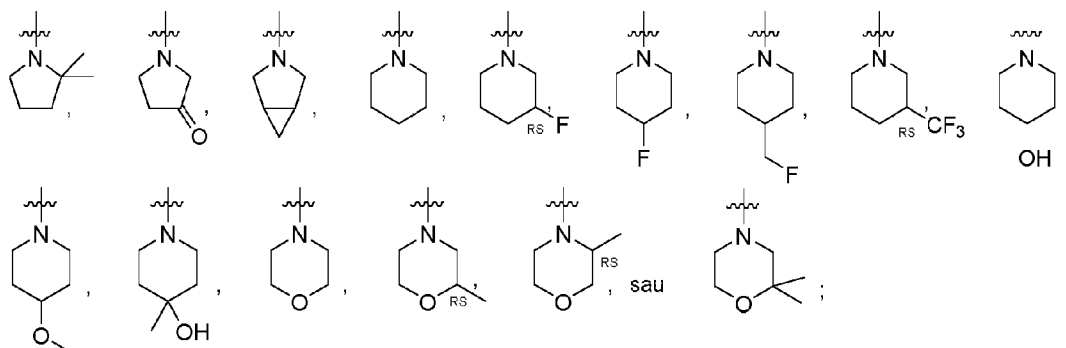
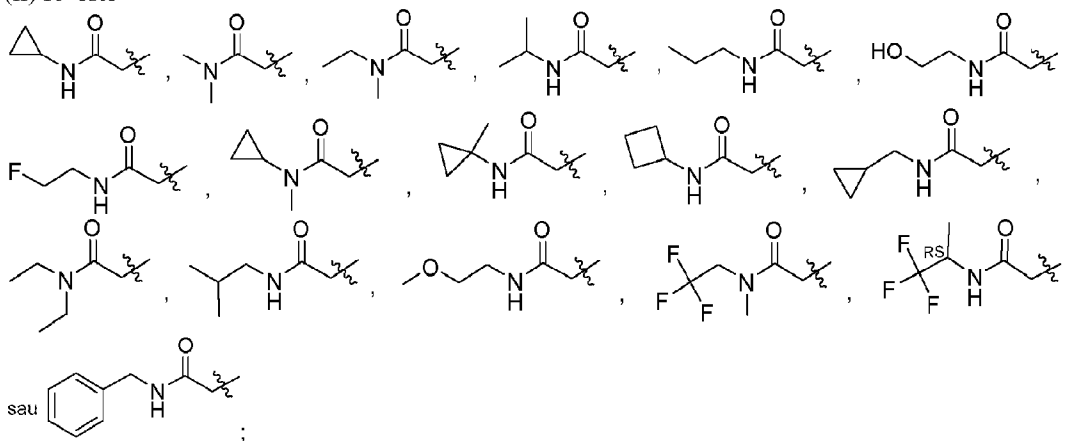
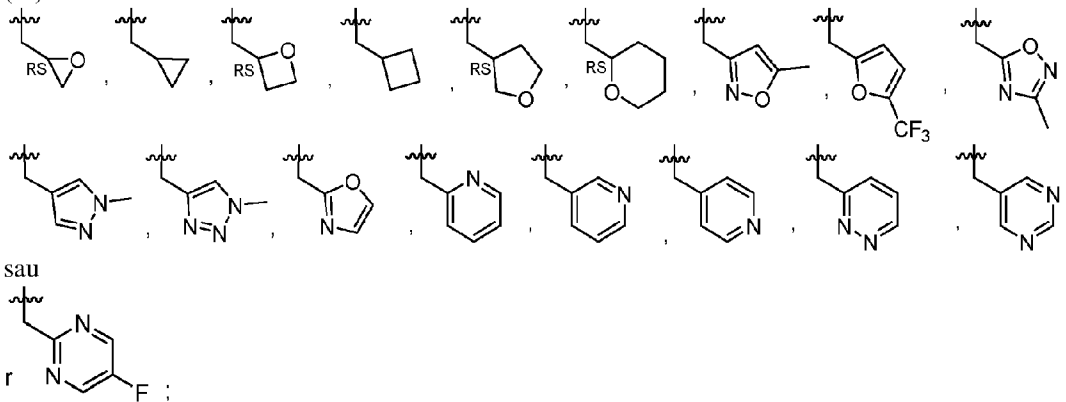
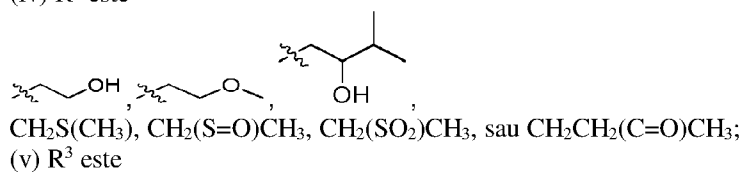
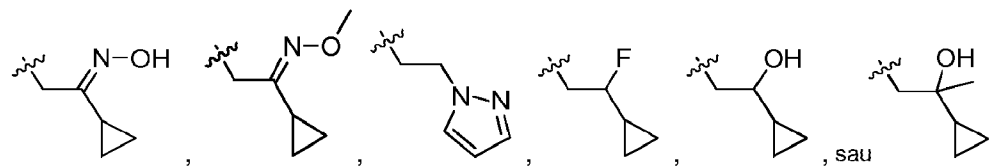
sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

5. Compusul conform oricăreia dintre revendicările 1 până la 4, în care:

(i) R^3 este

în care inel A este



(ii) R^3 este(iii) R^3 este(iv) R^3 este(v) R^3 este

sau

(vi) R^3 este



sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

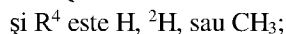
(i) Formula (II):



R¹ este selectat din grupul constand din: H, ³H, halo și alchilC₁₋₃;

R² este selectat din grupul constând din: fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchilC₁₋₅, și haloalchilC₁₋₅; piridinil substituit opțional cu halo, alchilC₁₋₅, haloalchilC₁₋₅, și CN; tiazolil substituit opțional cu alchilC₁₋₅; și tienil substituit opțional cu halo, sau alchilC₁₋₅;

inel A este selectat din grupul constand din:



(ii) Formula (IIA):



in care

R^{2a} este H , sau F ;

R^{2b} este H, F, CH_3 sau CH_2CH_3 ;

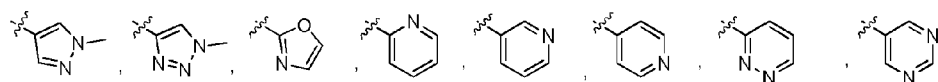
R2dC1=C(R2e)SC(C1)c2cc3c(cc2)n(c3)N(R3)

(IIB)

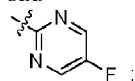
CN(C)C(=O)CC, O=C(CC)N1CC1, sau O=C(CC)N1CC(F)C1

c1ccc2c(c1)c(c3c2c()c(*)c3)N(CCN(C)C)C(=O)N(*)C(*)R1C1=C(R4)N(R3c)c2cc(R2)ncn12

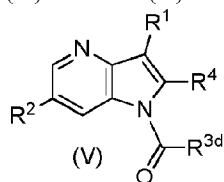
(IV)



sau

și R^4 este H;

(vi) Formula (V):

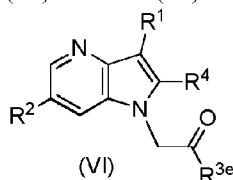


in care

 R^1 și R^4 sunt H; R^2 este fenil substituit opțional cu two halo; și R^{3d} este ciclobutil, sau CH_2 -ciclopropil;

sau

(vii) Formula (VI):



in care

 R^1 este H sau halo; R^2 este fenil substituit opțional cu unu, doi, sau trei membri selectați în mod independent dintre: halo, alchil C_{1-5} , și haloalchil C_{1-5} ; sau tienil substituit cu halo sau alchil C_{1-5} ; R^{3e} este selectat din grupul constând din: OH, alchil C_{1-5} , ciclopropil, ciclobutil, și fenil substituit opțional cu un substituent halo; și R^4 este H sau CH_3 ;

sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia.

8. Compusul conform revendicării 1, în care compusul este selectat din grupul constând din:

- 2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;
- 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
- 2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-(3-Cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-cloro-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
- 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
- 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
- 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
- 2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-N-ciclopropil-acetamidă;
- 2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-(3-Bromo-6-fenil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(4-fluorofenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
- 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
- 2-[3-Bromo-6-(m-tolil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;

N-Ciclopropil-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;

2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

2-[2-Metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)-2-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-(2-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

N-Ciclopropil-2-[2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-(2-Metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-morfolino-etanonă;

2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

3-[[6-(4-Fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;

5-Metil-3-[[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;

Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;

Sare trifluoroacetat de 5-metil-3-[[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]izoxazol;

Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;

Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;

Sare trifluoroacetat de 3-[[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-5-metil-izoxazol;

Sare trifluoroacetat de N-ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-bromo-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Acid 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetic;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-(6-Fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(m-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(p-Tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-Morfolino-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 1-Morfolino-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Morfolino-2-[6-(p-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-metil-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 5-[1-[2-(Azetidin-1-il)-2-oxo-etil]pirolo[3,2-b]piridin-6-il]piridin-2-carbonitril;
 6-(3,4-Difluorofenil)-1-(pirimidin-5-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 6-(3,4-Difluorofenil)-1-[(5-fluoropirimidin-2-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 Ciclobutil-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-Ciclopropil-1-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-Pirolidin-1-il-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 1-Morfolino-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Morfolino-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 6-(4-Metil-2-tienil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 6-(3,4-Difluorofenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 6-(4-Metil-2-tienil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 6-(3,4-Difluorofenil)-1-[[5-(trifluorometil)-2-furil]metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 N,N-Dimetil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
 1-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
 1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
 3,3-Dimetil-1-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
 1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3,3-dimetil-butan-2-onă;
 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(o-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(2,3-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-metil-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-butil-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
 Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-izopentil-pirolo[3,2-b]piridină;
 Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(3-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 Sare trifluoroacetat de 1-(ciclobutilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
 Sare trifluoroacetat de 1-(ciclopropilmetil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;
 Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(tetrahidrofuran-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(4-piridilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-pirazol-1-ilet)pirolo[3,2-b]piridină;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(pirimidin-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(oxetan-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(3-azabicyclo[3.1.0]hexan-3-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-metoxi-1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-fluoro-1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[4-(fluorometil)-1-piperidil]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(2-metilmorfolin-4-il)etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(trifluorometil)-1-piperidil]etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-1-(2-etilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-dimetilmorfolin-4-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxipirolidin-1-il)etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoro-1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(2,2-Dimetilpirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-3-metil-azetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-hidroxi-3-(trifluorometil)azetidin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[3-(hidroximetil)azetidin-1-il]etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetid in-1-il)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(5-azaspiro[2.3]hexan-5-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(4-hidroxi-4-metil-1-piperidil)etanonă;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilmorfolin-4-il)etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-azetidin-1-il)etanonă;

1-[2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]azetidin-3-carbonitril;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metilazetidin-1-il)etanonă;
 1-(3,3-Dimetilazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-[2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetil]pirolidin-3-onă;
 1-(3,3-Difluoropirolidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 (R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxipirolidin-1-il)etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-[6-(4-Fluoro-2,3-dimetil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-(2,3-Dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-fenil-etanonă;
 1-(4-Fluorofenil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de (R/S)-6-(4-fluorofenil)-1-(tetrahidropiran-2-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izopropil-acetamidă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-propil-acetamidă;
 (R/S)-2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2,2,2-trifluoro-1-metiletil)acetamidă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(1-metilciclopropil)acetamidă;
 N-(2-Fluoroetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-izobutil-acetamidă;
 5-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;
 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 N-(Ciclopropilmetil)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metiltriazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 5-[[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]-3-metil-1,2,4-oxadiazol;
 3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-[(1-metilpirazol-4-il)metil]pirolo[3,2-b]piridină;
 2-[3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclobutil-etanonă;
 1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 2-[3-cloro-6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-ciclopropil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Benzil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]metil]oxazol;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-hidroxietil)acetamidă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-(2-metoxietil)acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-ifuoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3,3-difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-2-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

(R/S)-1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-ol;

2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-hidroxi-azetidin-1-il)etanonă;

(R/S)-1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanol;

Sare trifluoroacetat de (R/S)-2-ciclopropil-1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]propan-2-ol;

1-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metoxi-etanimină;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-Pirolidin-1-il-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(5-Etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

2-[6-(5-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanon oximă;

2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

2-[6-(4-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

(R/S)-1-(2-Ciclopropil-2-fluoro-etil)-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridină;

2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-metoxiazetidin-1-il)etanonă;

Sare trifluoroacetat de 6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(2-metoxietil)pirolo[3,2-b]piridină;

1-Ciclobutil-2-[6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3R)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-[(3S)-3-fluoropirolidin-1-il]etanonă;

Sare trifluoroacetat de 1-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;

N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;

N,N-Dietil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;

2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-1-ciclopropil-etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-dimetilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-Ciclopropil-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfanilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 (R/S)-6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfinilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-1-(metilsulfonilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 4-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-[3-(Difluorometil)fenil]-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[3-Fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-morfolino-etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de N-ciclopropil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-diclorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-3-metil-butan-2-onă;
 1-Ciclobutil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N-Ciclopropil-2-[6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(4-Metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 N,N-Dimetil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-ciclopropil-etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de N,N-dimetil-2-[6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(5-Etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(4-Cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(azetidin-1-il)-2-[6-(4-cloro-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N,N-Dimetil-2-[6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(5-etil-2-tienil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 Sare trifluoroacetat de 1-(3-fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-metiltiazol-5-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-(6-tiazol-5-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(6-fluoro-3-piridil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(5-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-N-(2,2,2-trifluoroetil)acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(4-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(5-cloro-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(5-etil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;

2-[6-(5-Cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2,5-Dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-(2,4,5-trimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(4-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

N,N-Dimetil-2-(6-fenilpirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[6-[4-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[6-(5-Cloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2,5-Dicloro-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-[2-(trifluorometil)-4-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[6-[5-(trifluorometil)-3-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[6-(2,6-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2-Fluoro-5-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(3-Etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(3-Fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-[3-(Difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

N-Etil-N-metil-2-[6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(3,4-Difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;

N-Etil-N-metil-2-[6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;

2-[6-(3-Clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;

N-Etil-N-metil-2-[6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-(3-Fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-fluoro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3-etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Fluoro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[6-(3-Clorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[6-(3-Etilfenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(4-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-(3-Cloro-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

2-[3-Cloro-6-(2-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(2-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3,5-difluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-cloro-4-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-etilfenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-fluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-(3-cloro-2-fluoro-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;

2-[3-Cloro-6-(3-clorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

2-[3-Cloro-6-[3-(difluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-fluoro-2-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(3,5-difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;

2-[6-(4-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;

N-Etil-2-[6-(4-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metil-acetamidă;

N-Etil-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;

1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

2-[6-(2-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;

2-[3-Metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;

N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;

N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;

N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N,N-Dimetil-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
 N-Etil-N-metil-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)acetamidă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-(3-metil-6-fenil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 N-Etil-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-[2-Fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[3-Metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(2-Fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 N-Etil-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-[2-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(2,3,4-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(3,4,5-trifluorofenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[3-Cloro-6-(2,5-dimetil-3-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[6-(trifluorometil)-2-piridil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-(5-cloro-4-metil-2-tienil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Cloro-6-[5-(trifluorometil)-2-tienil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[6-(Benzotiofen-2-il)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[3-Fluoro-6-[4-fluoro-3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[6-(3-Cloro-2-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-fluoro-6-(m-tolil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3-Cloro-4-fluoro-fenil)-3-fluoro-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-(3-[3H]-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1H-pirolo[3,2-b]piridin-1-il)etanonă;
 2-[2-Deuterio-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-(trifluorometil)pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetilacetamidă;
 3-Cloro-1-(3-piridilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
 1-(Piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
 3-Cloro-6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-1-(piridazin-3-ilmetil)pirolo[3,2-b]piridină;
 3-Cloro-1-(piridazin-3-ilmetil)-6-[3-(trifluorometil)fenil]pirolo[3,2-b]piridină;
 2-[6-(4-Fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 N-Etil-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-metilacetamidă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(3,4-Difluorofenil)-3-metil-pirolo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metilacetamidă;

1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(3,4-difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N-etil-N-metil-acetamidă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[6-(2,4-difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 2-[6-(2,4-Difluoro-3-metil-fenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 N-Etil-N-metil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 2-[3-Metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-pirolidin-1-il-etanonă;
 1-(3,3-Difluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(Azetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă;
 2-[6-(3,5-Difluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 2-[6-(5-Cloro-2-tienil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-1-(3-fluoroazetidin-1-il)etanonă;
 N,N-Dimetil-2-[3-metil-6-(5-metil-2-tienil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]acetamidă;
 1-(3-Fluoroazetidin-1-il)-2-[6-(2-fluorofenil)-3-metil-pirololo[3,2-b]piridin-1-il]etanonă; și
 2-[6-[5-(Difluorometil)-2-tienil]pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă;
 sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia.

9. Compusul conform revendicării 8, care este sare trifluoroacetat de 2-[6-(4-fluoro-3-metil-fenil)pirololo[3,2-b]piridin-1-il]-N,N-dimetil-acetamidă.

10. O compoziție farmaceutică cuprinzând compusul conform oricăreia dintre revendicările 1 până la 9 sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia, și cel puțin un excipient acceptabil farmaceutic.

11. Compusul conform oricăreia dintre revendicările 1 până la 9 sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia pentru utilizare ca medicament.

12. Compusul conform oricăreia dintre revendicările 1 până la 9 sau o sare acceptabilă farmaceutic, solvat, sau N-oxid al acestuia pentru utilizare într-o metodă de tratare a unei boli, tulburări, sau afecțiuni medicale mediate de activitatea receptorului NR2B, în care respectiva metodă cuprinde administrarea la un subiect care are nevoie de un astfel de tratament a unei cantități eficiente de compus sau de o sare acceptabilă farmaceutic a acestuia, în care boala, tulburarea, sau afecțiunea medicală:

(a) este selectată din grupul constând din: tulburare bipolară, tulburare depresivă majoră, depresie rezistentă la tratament, depresie post-partum, tulburare afectivă sezonieră, boală Alzheimer, boală Parkinson, coree Huntington, scleroză multiplă, depreciere cognitivă, leziune la cap, leziune la măduva spinării, accident vascular cerebral, epilepsie, dischinezii, scleroză laterală amiotrofică, neurodegenerare asociată cu infecții bacteriene sau cronice, durere, neuropatie diabetică, migrenă, ischemie cerebrală, schizofrenie, encefalită, autism și tulburări din spectrul autismului, tulburări de memorie și învățare, tulburare obsesiv-compulsivă, tulburare de hiperactivitate cu deficit de atenție (ADHD) și boli de adicție; sau

(b) este depresie sau tulburare depresivă majoră rezistentă la tratament; sau

(c) este o tulburare a sistemului nervos central; sau

(d) este o tulburare neurologică sau psihiatrică; sau

(e) este (1) o tulburare de dispoziție; (2) o tulburare nevrotică, legată de stres sau somatoformă; (3) o tulburare de dezvoltare psihologică; (4) un sindrom comportamental asociat cu perturbări fiziologice și factori fizici; (5) o tulburare extrapiramidală și de mișcare; (6) o tulburare episodică sau paroxistică; (7) durere; (8) o formă de neurodegenerare, sau (9) o boală cerebrovasculară.

13. Compusul sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia, pentru utilizare așa cum s-a revendicat în revendicarea 12, în care boala, tulburarea, sau afecțiunea

medicală este (i) o tulburare nevrotică, legată de stres sau somatoformă care este o tulburare de anxietate; (ii) o tulburare episodică sau paroxistică care este epilepsie; sau (iii) o boală cerebrovasculară care este o boală cerebrovasculară acută sau o boală cerebrovasculară cronică.

14. Compusul sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia, pentru utilizare așa cum s-a revendicat în revendicarea 12, în care boala, tulburarea sau afecțiunea medicală este depresie rezistentă la tratament.

15. Compusul sau o sare acceptabilă farmaceutic, N-oxid sau solvat al acestuia, pentru utilizare așa cum s-a revendicat în revendicarea 12, în care boala, tulburarea sau afecțiunea medicală este tulburare depresivă majoră.