

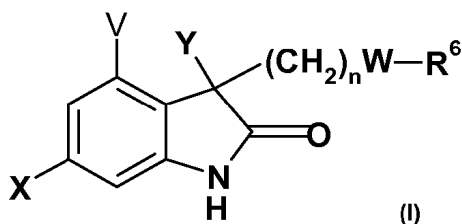
 (19) 대한민국특허청(KR) (12) 공개특허공보(A)	(11) 공개번호 10-2009-0053833 (43) 공개일자 2009년05월27일
(51) Int. Cl. <i>C07D 209/40</i> (2006.01) <i>C07D 403/12</i> (2006.01) <i>A61K 31/404</i> (2006.01) <i>A61P 35/00</i> (2006.01) (21) 출원번호 10-2009-7005769 (22) 출원일자 2009년03월20일 심사청구일자 2009년03월20일 번역문제출일자 2009년03월20일 (86) 국제출원번호 PCT/EP2007/059489 국제출원일자 2007년09월11일 (87) 국제공개번호 WO 2008/034736 국제공개일자 2008년03월27일 (30) 우선권주장 60/846,201 2006년09월21일 미국(US)	(71) 출원인 에프. 호프만-라 로슈 아게 스위스 체하-4070 바젤 그렌짜체스트라쎄 124 (72) 발명자 천 리 중국 201210 상하이 진케 로드 동지아오 스테이트 게스트 호텔 에이8 넘버 1800 장 징 미국 07054 뉴저지주 파시페니 칼튼 드라이브 1621 (뒷면에 계속) (74) 대리인 특허법인코리아나

전체 청구항 수 : 총 41 항

(54) 항암제로서의 옥신돌 유도체

(57) 요약

R⁶, V, W, X, Y 및 n 이 기술된 바와 같은 하기 화학식 (I) 의 화합물이 제공된다. 상기 화합물은 항암제로서의 활성을 나타낸다.



(72) 발명자

장 주밍

미국 08844 뉴저지주 힐스보로우 웨슬리 로드 59

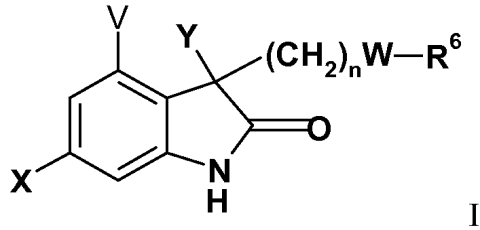
양 송

중국 201210 상하이 푸동 관글란 로드 1155

특허청구의 범위

청구항 1

하기 화학식 I 의 화합물 및 이의 약학적으로 허용가능한 염:

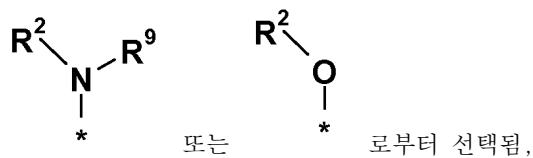


[식 중,

X 는 수소, 할로젠, 시아노, 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 저급 알콕시, 니트로, 메틸 술폰닐, 술폰아미드 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터 선택됨,

V 는 수소 또는 할로젠으로부터 선택됨,

Y 는

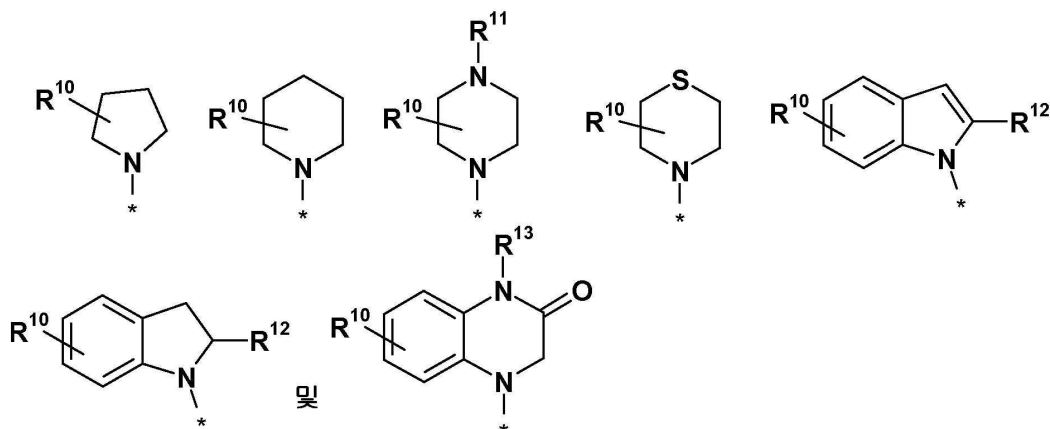


R² 는 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 알케닐, 헤테로사이클, 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R⁶ 은 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 및 치환된 헤테로아릴로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R⁹ 는 수소, 저급 알킬 및 치환된 저급 알킬, 저급 알콕시, 치환된 저급 알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고,

R² 및 R⁹ 의 경우에, 이들이 독립적으로 연결되어 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택된 시클릭 구조를 형성할 수 있는데, 상기 헤테로아릴 또는 헤테로사이클은



로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R¹⁰ 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함),

할로젠, 히드록시, CN, CF₃, NH₂, N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 아미노카르보닐, 카르복시, NO₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 저급-알킬-카르보닐-NH, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH₂-저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R¹¹ 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, CF₃, NH₂, N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH₂-저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R¹² 는 수소, 저급 알킬, 아미노카르보닐, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알콕시카르보닐, 플루오로-저급-알킬, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

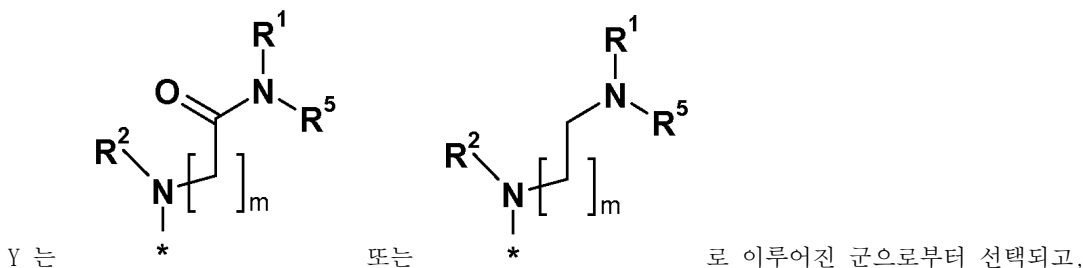
R¹³ 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, NH₂, N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬카르보닐옥시, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH₂-저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

W 는 0, N 또는 단일 결합임,

n 은 1-3 임].

청구항 2

제 1 항에 있어서,



R¹ 및 R⁵ 은 독립적으로, 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알케닐, 치환된 저급 알케닐, 저급 알키닐, 치환된 저급 알키닐, 저급 알콕시, 치환된 저급 알콕시, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 시클로알케닐, 헤테로사이클 및 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택되고,

R^1 및 R^5 의 경우에, 이들이 독립적으로 연결되어 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 치환된 또는 비치환된 시클로알킬, 치환된 또는 비치환된 시클로알케닐 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택되는 시클릭 구조를 형성할 수 있고,

R^2 는 저급 알킬, 시클로알킬, 페닐 또는 치환된 시클로알킬로부터 선택되고,

R^6 은 메타 할로젠 치환된 페닐이고,

X 는 Cl 또는 Br 이고,

V 는 수소이고,

W 는 결합이고,

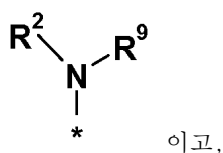
n 은 1 이며,

m 은 1-3 인 화합물.

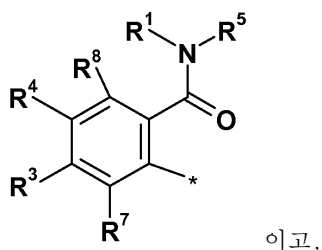
청구항 3

제 1 항에 있어서,

Y 는



R^2 는



R^1 및 R^5 는 독립적으로 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알케닐, 치환된 저급 알케닐, 저급 알키닐, 치환된 저급 알키닐, 저급 알콕시, 치환된 저급 알콕시, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 시클로알케닐, 헤테로사이클 및 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택되고,

R^1 및 R^5 의 경우에, 이들은 독립적으로 연결되어, 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 치환된 또는 비치환된 시클로알킬, 치환된 또는 비치환된 시클로알케닐 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택된 시클릭 구조를 형성할 수 있고,

R^3 , R^4 , R^7 및 R^8 은 수소, 할로젠, 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 저급 알콕시 및 시클로알킬로 이루어진 군으로부터 선택되고,

R^9 은 수소이고,

R^6 은 메타 할로젠 치환된 페닐이고,

X 는 Cl 또는 Br 이고,

V 는 수소이고,

W 는 결합이고,
n 은 1 이며,
m 은 1-3 인 화합물.

청구항 4

제 3 항에 있어서,
 R^7 은 수소이고,
 R^8 은 수소이고,
 R^3 은 할로젠, 저급 알킬 또는 저급 알콕시로부터 선택되고,
 R^4 은 수소, 할로젠, 저급 알킬 또는 저급 알콕시로부터 선택되는 화합물.

청구항 5

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,6-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-3-(벤조[1,3]디옥솔-5-일아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-3-(4-브로모-2-플루오로-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-에틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 6

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-3-(3-아세틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-페닐아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]-벤조니트릴,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-3-(4-브로모-2-메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(5-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 7

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-3-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4,5-트리플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-메틸-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로부틸아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
 rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 아마이드.

청구항 8

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1R)-히드록시메틸-2,2-디메틸-프로필아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-플루오로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-트리플루오로메틸-피리딘-2-일)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(2-히드록시-에톡시)-에틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-티오모르폴린-4-일-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로프로필아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-시클로헥실아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 9

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(1-히드록시메틸-2-메틸-프로필아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-1-히드록시메틸-1-메틸-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 tert-부틸 에스테르,
 rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노-아세트산,
 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르,

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 및

rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 10

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세틸)-1,3-디이소프로필-우레아,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-옥소-2-(3-옥소-피페라진-1-일)-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-(4-이소프로필-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(1,1-디메틸-프로필)-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-디메틸아미노-1-메틸-에틸)-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-피페리딘-1-일-아세트아미드 및

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-푸란-2-일메틸-아세트아미드.

청구항 11

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-히드록시-1,1-디메틸-에틸)-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-(2R)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-부티르산,
 rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트)-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-(4-히드록시-시클로헥실)-아세트아미드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸]-페닐-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[2-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-(2-히드록시-에틸)-아세트아미드,
 rac-{(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜타노일}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드 및
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(3-히드록시-피롤리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 12

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{(1S)-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-3-메틸-부틸아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 (2-히드록시-에틸)-아미드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(4-히드록시-피페리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-페닐-아세트아미드,
 rac-N-tert-부틸-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드,
 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 메틸 에스테르,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-클로로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-페닐-피페라진-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 13

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-이소프로필-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로펜틸-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-페닐-아세트아미드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드,
 rac-4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인도-3-일]-페닐-아미노}-아세틸)-피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-피페리딘-1-일-아세트아미드 및
 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(4-히드록시-시클로헥실)-3-페닐-프로피온아미드.

청구항 14

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-히드록시-에틸)-3-페닐-프로피온아미드,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-피페라진-1-일-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-3-(4-벤젠술포닐-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(티오펜-2-술포닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,
 rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 15

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-1-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페리딘-

4-카르복실산 아미드,

rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-(4-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페라진-1-일)-니코티노니트릴,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리미딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 16

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-히드록시-1-히드록시메틸-에틸)-아미드,

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드,

rac-({1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-아미노)-아세트산 에틸 에스테르,

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-1-{3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-(4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,

rac-4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,

rac-모르폴린-4-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드 및

rac-4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드.

청구항 17

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로프로필메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-[2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-(2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-(2-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 18

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{5-클로로-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{5-클로로-2-[4-(2-메톡시-에틸)피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-히드록시-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트아미드,

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-메톡시-페닐)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-메톡시-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-벤조산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디메톡실-벤조산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메톡실-벤조산 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 19

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N,N'-디메틸-벤즈아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-메틸-벤즈아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드,

rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드,

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-6-메톡시-2,3-디히드로-1H-인돌-2-카르복실산 에틸 에스테르,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르, 및

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산.

청구항 20

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-에티닐-벤조산,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,

rac-3-[5-브로모-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-에티닐-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-3-이소프로필-벤조산 및

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-에티닐-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인

돌-2-온.

청구항 21

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-이소프로필-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-술포닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤젠술포닐아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,

rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-벤조산,

rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-피페리딘-4-일-벤즈아미드 및

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드.

청구항 22

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트아미드,

rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술폰아미드,

rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아세트아미드,

rac-3-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-1,1-디메틸-우레아,

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,

rac-모르폴린-4-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,

rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,

rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메

톡시-벤즈아미드 및

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-4-메톡시-벤즈아미드.

청구항 23

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드,

rac-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3,5-디클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-벤즈아미드,

rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-클로로-6-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-3-메톡시-벤즈아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-3-메톡시-벤즈아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메톡시-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드 및

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-3-클로로-페닐}-아미노}-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드.

청구항 24

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((3-클로로-페닐)-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-3-에틸-프로필}-아미노}-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-3-에틸-프로필}-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-이소프로필-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-시클로헥실-아

세트아미드,

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세트산 및

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르.

청구항 25

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산,

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세트산,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-에톡시-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-에톡시-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온, 및

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산.

청구항 26

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-5-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-5-메틸-벤조산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3,5-디메틸-벤조산,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드,

rac-2-[(1-아세틸-피페리딘-4-일)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-4-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노]-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드 및

rac-N-(1-아세틸-피페리딘-4-일)-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-아세트아미드.

청구항 27

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-피페리딘-4-일-아세트아미드,

rac-4-(2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-아세틸아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,

rac-3-{2-[(1-아세틸-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-5-브로모-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-{5-브로모-2-[(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,

rac-3-(5-브로모-2-시클로부틸아미노메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-(5-브로모-2-모르폴린-4-일메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-(5-브로모-2-히드록시메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드 및

rac-N-(2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노}-에틸)-아세트아미드.

청구항 28

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-3-{5-브로모-2-[(2,2-디플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-{5-브로모-2-[(3-이미다졸-1-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-{5-브로모-2-[(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]

노]-벤즈아미드,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2-디플루오로-에틸)-벤즈아미드,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-벤즈아미드,

rac-3-{5-브로모-2-[(3-모르폴린-4-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-{5-브로모-2-[(2-모르폴린-4-일-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-3-{5-브로모-2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 29

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-4-클로로-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노]-벤조산,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐]-메틸-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-4-클로로-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노]-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드,

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-클로로-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노]-벤즈아미드,

rac-4-클로로-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노]-N-시클로펜틸-아세트아미드,

rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노]-아세트산,

rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노]-아세트산,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노]-N-시클로펜틸-아세트아미드 및

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드.

청구항 30

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노]-N-시클로프로필-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로부틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로헵틸-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헵틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드 및

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드.

청구항 31

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로헵틸-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헵틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-2,4-디메틸-펜탄산 시클로프로필아미드,

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로부틸아미드,

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로헵틸아미드,

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로헥실아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트아미드,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 메틸 에스테르 및

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산.

청구항 32

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N,N-디메틸-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-메틸-아세트아미드,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로헥실아미드,

rac-1-[6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르보닐]-피페리딘-4-카르복실산 아미드,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-벤조산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-플루오로-벤조산 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-메틸-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 33

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-4-플루오로-벤조아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-플루오로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-모르폴린-4-일-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(R)-3-메틸-시클로헥실)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-아세트산,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-

N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드 및

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-모르폴린-4-일-아세트아미드.

청구항 34

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(R)-3-메틸-시클로펜틸)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일)-(2-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산 시클로부틸아미드,

rac-3-[1-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-시클로헥실아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로프로필메틸-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일)-(3,3,5,5-테트라메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-((R)-바이시클로[2.2.1]헵트-2-일-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-2-[(6-클로로-3-시클로헥실메틸-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일)-시클로헥실-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 35

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페라진-1-일]-N,N-디메틸-2-옥소-아세트아미드,

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 디메틸아미드,

rac-2-{sec-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-{2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-[1-(프로판-2-술폰닐)-피페리딘-4-일]-아세트아미드,

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-메탄술포닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-메탄술포닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{이소프로필-[2-(4-메탄술포닐-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온.

청구항 36

제 1 항에 있어서, 하기로 이루어진 군으로부터 선택되는 화합물:

rac-2-{tert-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-N-[1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-일]-메탄술포나미드,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((1,2-디메틸-프로필)-{2-[4-(2-메탄술포닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노}-N-(1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드,

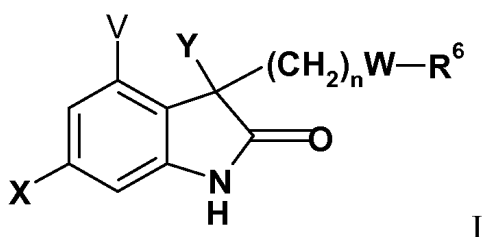
rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2,2-디메틸-프로필)-{2-[4-(2-메탄술포닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노}-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드.

청구항 37

하기 화학식 I 의 화합물 및 그의 약학적으로 허용가능한 염을 약학적으로 허용가능한 담체와 함께 포함하는 약학적 제형물:

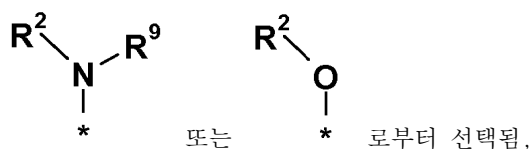


[식 중,

X 는 수소, 할로젠, 시아노, 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 저급 알콕시, 니트로, 메틸 술포닐, 술포아미드 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터 선택됨,

V 는 수소 또는 할로젠으로부터 선택됨,

Y 는

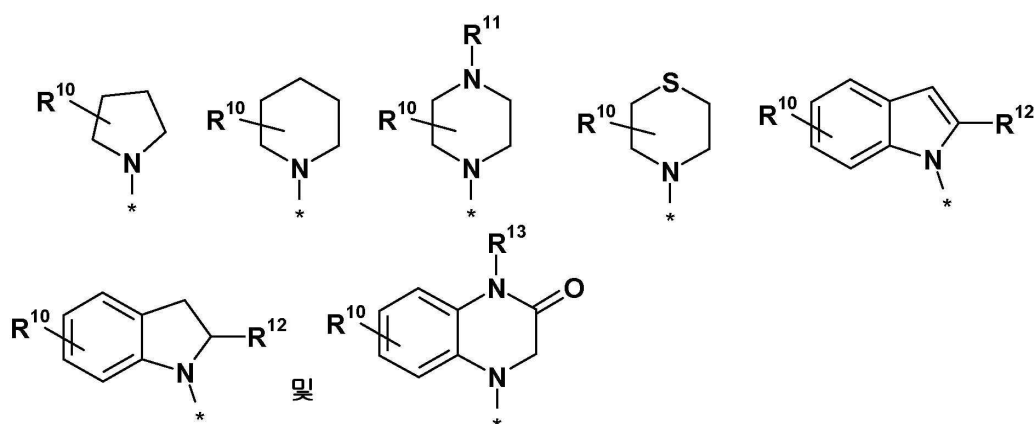


R^2 는 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 알케닐, 헤테로사이클, 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R^6 는 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 및 치환된 헤테로아릴로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R^9 는 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알콕시 및 치환된 저급 알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고,

R^2 및 R^9 의 경우에, 이들이 독립적으로 연결되어 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택되는 시클릭 구조를 형성할 수 있는데, 상기 헤테로아릴 또는 헤테로사이클은



로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R^{10} 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 할로젠, 히드록시, CN, CF_3 , NH_2 , N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 아미노카르보닐, 카르복시, NO_2 , 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 저급-알킬-카르보닐-NH, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH_2 -저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R^{11} 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, CF_3 , NH_2 , N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH_2 -저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R^{12} 는 수소, 저급 알킬, 아미노카르보닐, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알콕시카르

보닐, 플루오로-저급-알킬, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

R¹³ 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, NH₂, N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬카르보닐옥시, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH₂-저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

W 는 O, N 또는 단일 결합임,

n 은 1-3 임].

청구항 38

약학적 조성물의 제조를 위한, 제 1 항 내지 제 36 항 중 어느 한 항에 따른 화합물의 용도.

청구항 39

제 38 항에 있어서, 약학적 조성물이 중양 장애를 포함하는 세포 증식성 장애의 치료 또는 제어에 유용한 용도.

청구항 40

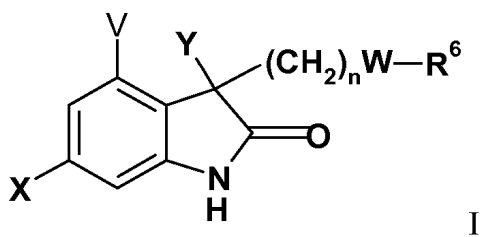
제 39 항에 있어서, 약학적 조성물이 유방 종양, 결장 종양, 폐 종양 및 전립선 종양을 포함하는 고형 종양의 치료 또는 제어에 유용한 용도.

청구항 41

본원 상기에서 설명된 바와 같은 본 발명.

명세서

<1> 본 발명은 하기 화학식 I 의 화합물 및 이의 약학적으로 허용가능한 염에 관한 것이다:



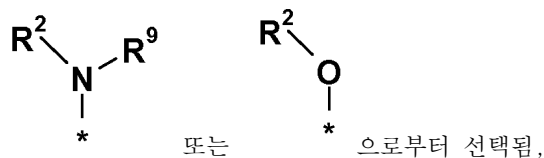
<2>

<3> [식 중,

<4> X 는 수소, 할로젠, 시아노, 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 저급 알콕시, 니트로, 메틸 술포닐, 술폰아미드 및 시클로프로필로 이루어진 군으로부터 선택됨,

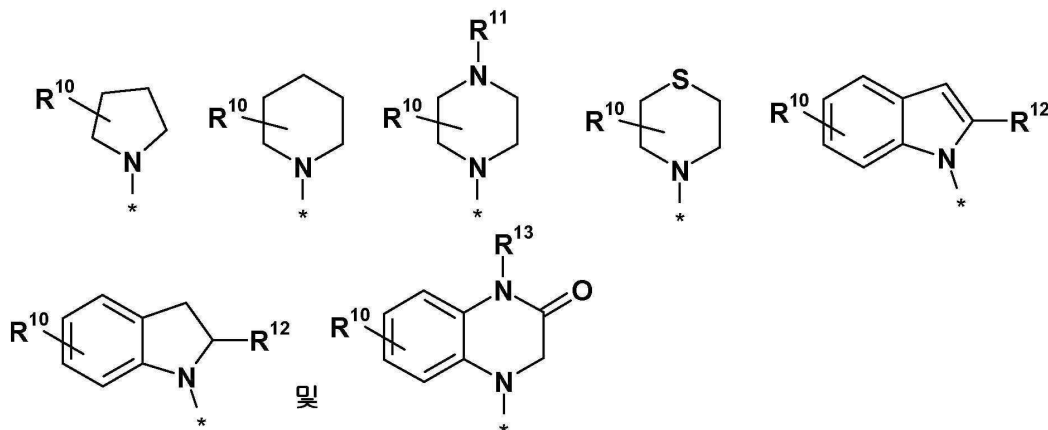
<5> V 는 수소 또는 할로젠으로부터 선택됨,

<6> Y 는



<7>

- <8> R^2 는 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 알케닐, 헤테로사이클, 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택됨,
- <9> R^6 은 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 및 치환된 헤테로아릴로 이루어진 군으로부터 선택됨,
- <10> R^9 는 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알콕시 및 치환된 저급 알콕시로 이루어진 군으로부터 선택되고,
- <11> R^2 및 R^9 의 경우에, 이들은 독립적으로 연결되어, 치환된 또는 비치환된 (unsubstituted) 헤테로아릴, 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택된 시클릭 구조를 형성할 수 있는데, 상기 헤테로아릴 또는 헤테로 사이클은



<12>

<13> 로 이루어진 군으로부터 선택됨,

<14> R^{10} 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 할로젠, 히드록시, CN, CF_3 , NH_2 , N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 아미노카르보닐, 카르복시, NO_2 , 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 저급-알킬-카르보닐-NH, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH_2 -저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

<15> R^{11} 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, CF_3 , NH_2 , N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH_2 -저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

<16> R^{12} 은 수소, 저급 알킬, 아미노카르보닐, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알콕시카르보닐, 플루오로-저급-알킬, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂ 로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

<17> R^{13} 은 수소, 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 히드록시, CN, NH_2 , N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬카르보닐옥시, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH_2 -저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 할로젠, 히드록시, NH_2 , N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂, N(H, 저급-알킬)-카르보닐, N(저급-알킬)₂-카르보닐로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬로 이루어진 군으로부터 선택됨,

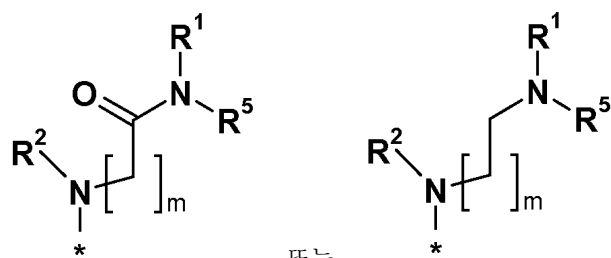
<18> W 는 0, N 또는 단일 결합임,

<19> n 는 1-3 임].

<20> p53 은 암 발생으로부터 보호하는 중심 역할을 하는 종양 저해 단백질이다. 이는 세포 완전성을 지키고, 성장 정지 또는 세포자멸사의 유도에 의해 영구적으로 손상된 세포 클론의 증식을 방지한다. 분자 수준에서, p53 은 세포 주기 및 세포자멸사의 조절에 관련된 유전자 패 널을 활성화할 수 있는 전사 인자이다. p53 는 세포 수준에서 MDM2 에 의해 철두철미하게 조절되는 강력한 세포 주기 억제제이다. MDM2 및 p53 은 피드백 제어 루프 (loop) 를 형성한다. MDM2 이 p53 에 결합하여 p53-조절된 유전자를 전사활성화시키는 능력을 억제할 수 있다. 또한 MDM2 은 p53의 유비퀴틴-의존 분해를 매개한다. p53 은 MDM2 유전자의 발현을 활성화시켜, 이에 따라 MDM2 단백질의 세포 수준을 증가시킬 수 있다. 이러한 피드백 제어 루프는, 정상인 증식 세포들에서 MDM2 및 p53 모두가 낮은 수준을 유지하도록 책임진다. MDM2 는 또한 E2F 에 대한 보조인자인데, 이는 세포 주기 조절에서 중심적인 역할을 한다.

<21> 다수의 암에서는 MDM2 대 p53 (E2F) 의 비율은 조절곤란하다. p16INK4/p19ARF 유전자 위치 (locus) 에서 자주 발생하는 분자 결합은, 예를 들어 MDM2 단백질 분해에 영향을 주는 것으로 보고되어져 있다. 야생형 p53 을 갖는 종양 세포내에서는 MDM2-p53 상호작용의 억제로 p53 의 축적, 세포 주기의 정지 및/또는 세포자멸사를 야기해야 한다. 따라서, MDM2 안타고니스트 (antagonist) 는 단일제로서 또는 광범위한 기타 항암 요법과 병용하여 암치료에 신규한 접근법을 제공할 수 있다. MDM2-p53 상호작용 억제를 위한 상이한 거대분자 도구 (예를 들어, 항체, 안티센스 올리고뉴클레오타이드, 펩타이드) 의 사용을 통해 이러한 전략의 실행가능성을 보여왔다. MDM2 은 또한 p53 으로서 보존된 결합 영역을 통해 E2F 에 결합하여, 사이클린 A 의 E2F-의존 전사를 활성화시키는데, 이는 MDM2 안타고니스트가 p53 돌연변이 세포에 영향을 미칠 수 있음을 시사하는 것이다.

<22> Y 가 하기인 화합물이 바람직하다:



<23> 또는

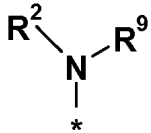
<24> [식 중,

<25> R^1 및 R^5 은 독립적으로 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알케닐, 치환된 저급 알케닐, 저급 알키닐, 치환된 저급 알키닐, 저급 알콕시, 치환된 저급 알콕시, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 시클로알케닐, 헤테로사이클 및 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군으로부터 선택되고,

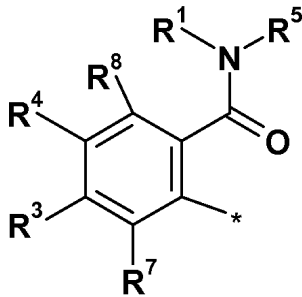
<26> R^1 및 R^5 의 경우에, 이들은 독립적으로 연결되어, 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 치환된 또는 비치환된 시클로알킬, 치환된 또는 비치환된 시클로알케닐 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택되는 시클릭 구조를 형성할 수 있고,

<27> R^2 은 저급 알킬, 시클로알킬, 페닐, 또는 치환된 시클로알킬로부터 선택되고,

- <28> R^6 은 메타 할로젠 치환된 페닐이고,
 <29> X 는 Cl 또는 Br 이고,
 <30> V 는 수소이고,
 <31> W 는 결합이고,
 <32> n 은 1 이고,
 <33> m 은 1-3 임].
 <34> 또한, Y 가 하기인 화합물이 바람직하다:



- <35>
 <36> [식 중,
 <37> R^2 는



- <38> 이고,

- <39> R^1 및 R^5 은 수소, 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 저급 알케닐, 치환된 저급 알케닐, 저급 알키닐, 치환된 저급 알키닐, 저급 알콕시, 치환된 저급 알콕시, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 시클로알케닐, 헤테로사이클 및 치환된 헤테로사이클로 이루어진 군 으로부터 독립적으로 선택되고,
 <40> R^1 및 R^5 의 경우, 이들은 독립적으로 연결되어, 치환된 또는 비치환된 헤테로아릴, 치환된 또는 비치환된 시클로알킬, 치환된 또는 비치환된 시클로알케닐 또는 치환된 또는 비치환된 헤테로사이클로부터 선택된 시클릭 구조를 형성할 수 있고,
 <41> R^3 , R^4 , R^7 및 R^8 은 수소, 할로젠, 저급 알킬, 저급 알케닐, 저급 알키닐, 저급 알콕시 및 시클로알킬로 이루어진 군 으로부터 선택되고,
 <42> R^9 은 수소이고,
 <43> R^6 은 메타 할로젠 치환된 페닐이고,
 <44> X 는 Cl 또는 Br 이고,
 <45> V 는 수소이고,
 <46> W 는 결합이고,
 <47> n 은 1 이며,
 <48> m 은 1-3 임].
 <49> 바로 위의 화합물 중 추가 바람직한 것은 하기인 화합물이다:

- <50> [식 중,
- <51> $R^7=H$,
- <52> $R^8=H$,
- <53> R^3 은 할로젠, 저급 알킬, 저급 알콕시로부터 선택됨, 및
- <54> R^4 은 수소, 할로젠, 저급 알킬 및 저급 알콕시로부터 선택됨].
- <55> 하기 화학식의 화합물이 특히 바람직하다:
- <56> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <57> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,6-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <58> rac-3-(벤조[1,3]디옥솔-5-일아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <59> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <60> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <61> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <62> rac-3-(4-브로모-2-플루오로-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <63> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-에틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <64> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <65> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <66> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <67> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <68> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <69> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <70> rac-3-(3-아세틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <71> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-페닐아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <72> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <73> rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]-벤조니트릴,
- <74> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <75> rac-3-(4-브로모-2-메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <76> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(5-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <77> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <78> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <79> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <80> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-3-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <81> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4,5-트리플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <82> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <83> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <84> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

- <85> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <86> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-메틸-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <87> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로부틸아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <88> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 아마이드,
- <89> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <90> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <91> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1R)-히드록시메틸-2,2-디메틸-프로필아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <92> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <93> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-플루오로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <94> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-트리플루오로메틸-피리딘-2-일)- 피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <95> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(2-히드록시-에톡시)-에틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <96> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-티오모르폴린-4-일-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <97> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로프로필아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <98> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <99> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-시클로헥실아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <100> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(1-히드록시메틸-2-메틸-프로필아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <101> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-1-히드록시메틸-1-메틸-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <102> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 tert-부틸 에스테르,
- <103> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트산,
- <104> rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <105> rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <106> rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <107> rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <108> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르,
- <109> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산,
- <110> rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <111> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세틸)-1,3-디이소프로필-우레아,
- <112> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-옥소-2-(3-옥소-피페라진-1-일)-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <113> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-(4-이소프로필-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

- <114> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-{2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <115> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아세트아미드,
- <116> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드,
- <117> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <118> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-(1,1-디메틸-프로필)-아세트아미드,
- <119> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-(2-디메틸아미노-1-메틸-에틸)-아세트아미드,
- <120> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-피페리딘-1-일-아세트아미드,
- <121> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-푸란-2-일메틸-아세트아미드,
- <122> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-(2-히드록시-1,1-디메틸-에틸)-아세트아미드,
- <123> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <124> rac-(2R)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-부티르산,
- <125> rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드,
- <126> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-([2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <127> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-(4-히드록시-시클로헥실)-아세트아미드,
- <128> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-([2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸]-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <129> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-([2-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <130> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-(2-히드록시-에틸)-아세트아미드,
- <131> rac-((2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜타노일)-피페리딘-4-카르복실산 아미드,
- <132> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(3-히드록시-피롤리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <133> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <134> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 (2-히드록시-에틸)-아미드,
- <135> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(4-히드록시-피페리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로

-인돌-2-온,

- <136> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <137> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-페닐-아세트아미드,
- <138> rac-N-tert-부틸-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트아미드
- <139> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드,
- <140> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 메틸 에스테르,
- <141> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <142> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-클로로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <143> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-페닐-피페라진-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <144> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드,
- <145> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-이소프로필-아세트아미드,
- <146> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로펜틸-아세트아미드,
- <147> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드,
- <148> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-페닐-아세트아미드,
- <149> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <150> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <151> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드,
- <152> rac-4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인도-3-일]-페닐-아미노}-아세틸)-피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
- <153> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-피페리딘-1-일-아세트아미드,
- <154> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(4-히드록시-시클로헥실)-3-페닐-프로피온아미드,
- <155> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-히드록시-에틸)-3-페닐-프로피온아미드,
- <156> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <157> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-피페라진-1-일-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <158> rac-3-(4-벤젠술폰닐-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

- <159> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(티오펜-2-술폰닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <160> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,
- <161> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산,
- <162> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <163> rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <164> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <165> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <166> rac-1-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <167> rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <168> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <169> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <170> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <171> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <172> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <173> rac-6-(4-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페라진-1-일)-니코티노니트릴,
- <174> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <175> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리미딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <176> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <177> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-히드록시-1-히드록시메틸-에틸)-아미드,
- <178> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드,
- <179> rac-({1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-아미노)-아세트산 에틸 에스테르,
- <180> rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <181> rac-1-{3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <182> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,

- <183> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <184> rac-(4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,
- <185> rac-4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,
- <186> rac-모르폴린-4-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,
- <187> rac-4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,
- <188> rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드,
- <189> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로프로필메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <190> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <191> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <192> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드,
- <193> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <194> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-{2-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <195> rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,
- <196> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <197> rac-1-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드,
- <198> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <199> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{5-클로로-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <200> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{5-클로로-2-[4-(2-메톡시-에틸)피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <201> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <202> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-히드록시-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <203> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트아미드,
- <204> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-메톡시-페닐)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르,
- <205> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-메톡시-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <206> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-벤조산,

- <207> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디메톡실-벤조산,
- <208> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메톡실-벤조산,
- <209> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <210> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <211> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <212> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N,N'-디메틸-벤즈아미드,
- <213> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-메틸-벤즈아미드,
- <214> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드,
- <215> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드,
- <216> rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드,
- <217> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 시클로부틸아미드,
- <218> rac-6-메톡시-2,3-디히드로-1H-인돌-2-카르복실산 에틸 에스테르,
- <219> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르,
- <220> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산,
- <221> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <222> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,
- <223> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <224> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,
- <225> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <226> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-에티닐-벤조산,
- <227> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,
- <228> rac-3-[5-브로모-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <229> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-에티닐-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <230> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-3-이소프로필-벤조산,
- <231> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-에티닐-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인

돌-2-온,

- <232> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <233> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-이소프로필-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <234> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <235> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-술포닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <236> rac-4-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤젠술포닐아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
- <237> rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-벤조산,
- <238> rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
- <239> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <240> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <241> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-피페리딘-4-일-벤즈아미드,
- <242> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드,
- <243> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트아미드,
- <244> rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온
- <245> rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술포나미드,
- <246> rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아세트아미드,
- <247> rac-3-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-1,1-디메틸-우레아,
- <248> rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,
- <249> rac-모르폴린-4-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,
- <250> rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,
- <251> rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드,
- <252> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메톡시-벤즈아미드,
- <253> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-4-메톡시-벤즈아미드,
- <254> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <255> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-

일아미노]-벤즈아미드,

- <256> rac-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,
- <257> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3,5-디클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <258> rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-벤즈아미드,
- <259> rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드,
- <260> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-클로로-6-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <261> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-3-메톡시-벤즈아미드,
- <262> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-3-메톡시-벤즈아미드,
- <263> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <264> rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메톡시-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <265> rac-1-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <266> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((3-클로로-페닐)-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <267> rac-1-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <268> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아마이드,
- <269> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <270> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-이소프로필-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <271> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <272> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르,
- <273> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <274> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <275> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세트산,
- <276> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르,

- <277> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산,
- <278> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세트산,
- <279> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <280> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <281> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,
- <282> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <283> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <284> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <285> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-에톡시-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <286> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-에톡시-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <287> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산,
- <288> rac-5-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산,
- <289> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-5-메틸-벤조산,
- <290> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3,5-디메틸-벤조산,
- <291> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산,
- <292> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <293> rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드,
- <294> rac-2-{(1-아세틸-피페리딘-4-일)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <295> rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
- <296> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <297> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드,
- <298> rac-N-(1-아세틸-피페리딘-4-일)-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트아미드,
- <299> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-피페리딘-4-일-아세트아미드,
- <300> rac-4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르,
- <301> rac-3-{2-[(1-아세틸-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-5-브로모-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,

- <302> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <303> rac-3-{5-브로모-2-[(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <304> rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노}-피페리딘-1-카복실산 tert-부틸 에스테르,
- <305> rac-3-(5-브로모-2-시클로부틸아미노메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <306> rac-3-(5-브로모-2-모르폴린-4-일메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <307> rac-3-(5-브로모-2-히드록시메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <308> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드,
- <309> rac-N-(2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노}-에틸)-아세트아미드,
- <310> rac-3-{5-브로모-2-[(2,2-디플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <311> rac-3-{5-브로모-2-[(3-이미다졸-1-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <312> rac-3-{5-브로모-2-[(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <313> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드,
- <314> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2-디플루오로-에틸)-벤즈아미드,
- <315> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드,
- <316> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,
- <317> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-벤즈아미드,
- <318> rac-3-{5-브로모-2-[(3-모르폴린-4-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <319> rac-3-{5-브로모-2-[(2-모르폴린-4-일-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <320> rac-3-{5-브로모-2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <321> rac-4-클로로-2-{{6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일}-메틸-아미노}-벤조산,
- <322> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐]-메틸-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <323> rac-4-클로로-2-{{6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일}-메틸-아미노}-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드,
- <324> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-클로로-2-{{6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일}-

메틸-아미노}-벤즈아미드,

- <325> rac-4-클로로-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노)-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드,
- <326> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-시클로펜틸-아세트아미드,
- <327> rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-아세트산,
- <328> rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-아세트산 ,
- <329> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <330> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-N-시클로펜틸-아세트아미드,
- <331> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <332> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-N-시클로프로필-아세트아미드,
- <333> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로부틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <334> rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노)-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아미드,
- <335> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-N-시클로프로필-아세트아미드,
- <336> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <337> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-N-시클로펜틸-아세트아미드,
- <338> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <339> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로펜틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <340> rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노)-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아미드,
- <341> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노)-N-시클로프로필-아세트아미드,
- <342> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <343> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노)-N-시클로펜틸-아세트아미드,
- <344> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노)-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <345> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헵틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <346> rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵틸-아미노)-아세틸)-피페

리딘-4-카르복실산 아미드,

- <347> rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-2,4-디메틸-펜탄산 시클로프로필아미드,
- <348> rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로부틸아미드,
- <349> rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로헥실아미드,
- <350> rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로헥실아미드,
- <351> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-아세트아미드,
- <352> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 메틸 에스테르,
- <353> rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-아세트산,
- <354> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산,
- <355> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N,N-디메틸-아세트아미드,
- <356> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-메틸-아세트아미드,
- <357> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드,
- <358> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로헥실아미드,
- <359> rac-1-[6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르보닐]-피페리딘-4-카르복실산 아미드,
- <360> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <361> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온,
- <362> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-벤조산,
- <363> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-플루오로-벤조산,
- <364> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-메틸-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <365> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-4-플루오로-벤즈아미드,
- <366> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <367> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-플루오로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <368> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <369> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노)-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <370> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노)-

N-모르폴린-4-일-아세트아미드,

- <371> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(((R)-3-메틸-시클로헥실)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <372> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-아세트산,
- <373> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <374> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드,
- <375> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-모르폴린-4-일-아세트아미드,
- <376> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(((R)-3-메틸-시클로펜틸)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <377> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산,
- <378> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-2-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <379> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산 시클로부틸아미드,
- <380> rac-3-[1-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-시클로헥실아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <381> rac-2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로프로필메틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <382> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3,3,5,5-테트라메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <383> rac-2-{{(R)-바이시클로[2.2.1]헵트-2-일-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <384> rac-2-[[6-클로로-3-시클로헥실메틸-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <385> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <386> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <387> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <388> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <389> rac-2-[4-(2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페라진-1-일]-N,N-디메틸-2-옥소-아세트아미드,
- <390> rac-1-(2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 디메틸아미드,
- <391> rac-2-{{sec-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <392> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-(2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <393> rac-2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-[1-(프로판-

2-술포닐)-피페리딘-4-일]-아세트아미드,

- <394> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-아세트아미드,
- <395> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-메탄술포닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <396> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-메탄술포닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <397> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{이소프로필-[2-(4-메탄술포닐-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <398> rac-2-{tert-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <399> rac-N-[1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-일]-메탄술포나미드,
- <400> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <401> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((1,2-디메틸-프로필)-(2-[4-(2-메탄술포닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온,
- <402> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노)-N-(1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드,
- <403> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노)-N-시클로부틸-아세트아미드,
- <404> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2,2-디메틸-프로필)-(2-[4-(2-메탄술포닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온 및
- <405> rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노)-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드.
- <406> 본 상세한 설명에서, 지시되는 경우, 각종 기가 하기로 이루어진 군으로부터 독립적으로 선택되는 치환기 1 내지 5 개, 또는 바람직하게는 1 내지 3 개로 치환될 수 있다: 저급 알킬, 저급-알케닐, 저급-알키닐, 디옥소-저급-알킬렌 (예를 들어, 벤조디옥실기를 형성함), 할로젠, 히드록시, CN, CF₃, NH₂, N(H, 저급-알킬), N(저급-알킬)₂, 아미노카르보닐, 카르복시, NO₂, 저급-알콕시, 티오-저급-알콕시, 저급-알킬술포닐, 아미노술포닐, 저급-알킬카르보닐, 저급-알킬카르보닐옥시, 저급-알콕시카르보닐, 저급-알킬-카르보닐-NH, 플루오로-저급-알킬, 플루오로-저급-알콕시, 저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시, 카르복시-저급-알콕시, 카르바모일-저급-알콕시, 히드록시-저급-알콕시, NH₂-저급-알콕시, N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시, N(저급-알킬)₂-저급-알콕시, 벤질옥시-저급-알콕시, 모노- 또는 디-저급 알킬 치환된 아미노-술포닐, 및 할로젠, 히드록시, NH₂, N(H, 저급-알킬) 또는 N(저급-알킬)₂로 임의 치환될 수 있는 저급-알킬. 알킬, 아릴, 헤테로아릴 및 헤테로사이클고리의 바람직한 치환기는 할로젠, 저급 알콕시, 저급 알킬 및 아미노이다.
- <407> 용어 “알킬” 이란, 1 내지 약 7 개의 탄소 원자를 갖는 기를 포함하는, 1 내지 약 20 개의 탄소 원자를 갖는 직쇄- 또는 분지쇄의 포화 탄화수소기를 지칭한다. 특정 구현예에서, 알킬 치환기는 저급 알킬 치환기일 수 있다. 용어 “저급 알킬” 이란, 탄소수 1 내지 6 의 알킬기를 지칭하고, 특정 구현예에서는 탄소수 1 내지 4 의 알킬기를 지칭한다. 알킬기의 예에는 이에 제한되는 것은 아니나, 메틸, 에틸, n-프로필, i-프로필, n-부틸, s-부틸, t-부틸, n-펜틸, 및 s-펜틸이 포함된다.
- <408> 본원에서 사용되는 바와 같이, “시클로알킬” 은 탄소 원자로만으로 이루어진 임의의 안정적인 모노시클릭 또는 폴리시클릭 시스템을 지칭하는 것으로 사용되며, 이들 중 임의의 고리는 포화되어 있고, 용어 “시클로알케닐” 이란 탄소 원자로만 이루어진 임의의 안정적인 모노시클릭 또는 폴리시클릭 시스템을 지칭하는 것으로 사용되며, 이의 적어도 한 고리는 부분적으로 불포화되어 있다. 시클로알킬의 예에는, 이에 제한되는 것은 아니나 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로헵틸, 아다만틸, 시클로옥틸, 바이시클로옥

탄, 예컨대 [2.2.2]바이시클로옥탄 또는 [3.3.0]바이시클로옥탄, 바이시클로노난, 예컨대 [4.3.0]바이시클로노난, 및 바이시클로데칸, 예컨대 [4.4.0]바이시클로데칸 (데칼린), 또는 스피로 화합물을 포함하는 바이시클로알킬이 포함된다. 시클로알케닐의 예에는 이에 제한되는 것은 아니나 시클로펜테닐 또는 시클로헥세닐이 포함된다.

- <409> 본원에서 사용되는 바와 같은 용어 "알케닐" 이란, 1 개의 이중 결합 및 2 내지 6, 바람직하게는 2 내지 4 개의 탄소 원자를 포함하는, 불포화, 직쇄 또는 분지쇄 지방족 탄화수소기를 의미한다. 이러한 "알케닐기" 의 예는 비닐 (에테닐), 알릴, 이소프로페닐, 1-프로페닐, 2-메틸-1-프로페닐, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 2-에틸-1-부테닐, 3-메틸-2-부테닐, 1-펜테닐, 2-펜테닐, 3-펜테닐, 4-펜테닐, 4-메틸-3-펜테닐, 1-헥세닐, 2-헥세닐, 3-헥세닐, 4-헥세닐 및 5-헥세닐이다.
- <410> 본원에서 사용되는 바와 같은 용어 "알킬닐" 이란, 1 개의 삼중 결합 및 2 내지 6, 바람직하게는 2 내지 4 개의 탄소 원자를 포함하는, 불포화, 직쇄 또는 분지쇄 지방족 탄화수소기를 의미한다. 이러한 "알킬닐기"의 예는 에티닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐, 1-부티닐, 2-부티닐, 3-부티닐, 1-펜티닐, 2-펜티닐, 3-펜티닐, 4-펜티닐, 1-헥시닐, 2-헥시닐, 3-헥시닐, 4-헥시닐 및 5-헥시닐이다.
- <411> 정의에서 사용되는 바와 같은 용어 "할로젠" 이란, 플루오르, 염소, 브롬 또는 요오드, 바람직하게는 플루오르 및 염소이다.
- <412> "아릴" 은 1가, 모노시클릭 또는 바이시클릭, 방향족 카르보시클릭 탄화수소 라디칼, 바람직하게 6-10 원 방향족 고리 시스템을 나타낸다. 바람직한 아릴기에는, 이에 제한되는 것은 아니나, 페닐, 나프틸, 톨릴 및 자일릴이 포함된다.
- <413> "헤테로아릴" 은 2 개 이하의 고리를 갖는 방향족 헤테로시클릭 고리 시스템을 나타낸다. 바람직한 헤테로아릴기에는, 이에 제한되는 것은 아니나, 티에닐, 푸릴, 인돌릴, 피롤릴, 피리디닐, 피라지닐, 옥사졸릴, 티아졸릴, 퀴놀리닐, 피리미디닐, 이미다졸 및 테트라졸릴이 포함된다.
- <414> 바이시클릭인 아릴 또는 헤테로아릴의 경우 하나의 고리는 아릴인 한편 다른 하나는 헤테로아릴일 수 있고, 둘 다 치환 또는 비치환된 것으로 이해되어야 한다.
- <415> "헤테로사이클" 이란, 치환된 또는 비치환된 5 내지 8 원, 모노- 또는 바이시클릭, 비(非) 방향족 탄화수소로, 여기서 1 내지 3 개의 탄소 원자는 질소, 산소 또는 황 원자로부터 선택되는 헤테로 원자로 대체된다. 그 예에는 피롤리딘-2-일; 피롤리딘-3-일; 피페리디닐; 모르폴린-4-일 등이 포함된다.
- <416> "헤테로원자" 란, N, O 및 S 로부터 선택된 원자를 의미한다.
- <417> "알콕시, 알콕실 또는 저급 알콕시" 는 산소 원자에 부착된 상기 저급 알킬기 중 임의의 것을 지칭한다. 통상적 저급 알콕시기에는 메톡시, 에톡시, 이소프로폭시 또는 프로폭시, 부틸옥시 등이 포함된다. 추가적으로 알콕시의 의미에 포함되는 것은 다중 알콕시 측쇄, 예를 들어, 에톡시 에톡시, 메톡시 에톡시, 메톡시 에톡시 에톡시 등, 및 치환된 알콕시 측쇄, 예를 들어 디메틸아미노 에톡시, 디에틸아미노 에톡시, 디메톡시-포스포릴 메톡시 등이다.
- <418> "메틸 술폰닐" 은 하기 기를 의미한다: $-(SO_2)-CH_3$ 기.
- <419> "술폰아미드" 또는 "아미노술폰닐" 이란, 하기 기를 의미한다: $-(SO_2)-NR'R''$ 기 (식 중, R' 및 R'' 은 독립적으로 H 또는 저급 알킬임).
- <420> "디옥소-저급-알킬렌" 은 $-O-$ 저급 알킬레닐- $O-$ 의 이와 리간드를 의미한다. 이러한 기는 예를 들어 이들이 결합하는 아릴기와 벤조디옥실기를 형성할 수 있다.
- <421> "아미노카르보닐" 은 하기 기를 나타낸다: $-(C=O)-NHR'R''$ 기 (식 중, R' 및 R'' 은 독립적으로 H 또는 저급 알킬임).
- <422> "카르복시" 는 하기 기를 의미한다: $-(C=O)-O-$ 기.
- <423> "티오-저급-알콕시" 는 하기 기를 의미한다: $-S-$ 저급 알킬기.
- <424> "저급-알킬술폰닐" 은 하기 기를 의미한다: $-(SO_2)-$ 저급 알킬기.
- <425> "저급-알킬카르보닐" 은 하기 기를 의미한다: $-(C=O)-$ 저급 알킬기.

- <426> “저급-알킬카르보닐옥시” 는 하기 기를 의미한다: $-O(C=O)-$ 저급 알킬기.
- <427> “저급-알콕시카르보닐” 은 하기 기를 의미한다: $-(C=O)-O-$ 저급 알킬기.
- <428> “저급-알킬-카르보닐-NH” 은 하기 기를 의미한다: $-NH-(C=O)-$ 저급 알킬기.
- <429> “저급-알콕시-카르보닐-저급-알콕시” 는 하기 기를 의미한다: $-O-$ 저급 알킬레닐- $(C=O)-O-$ 저급 알킬기.
- <430> “카르복시-저급-알콕시” 는 하기 기를 의미한다: $-O-$ 저급 알킬레닐- $(C=O)-OH$ 기.
- <431> “카르바모일-저급-알콕시” 는 하기 기를 의미한다: $-O-$ 저급 알킬레닐- $(C=O)-NR'R''$ 기 (식 중, R' 및 R'' 은 독립적으로 H 또는 저급 알킬임).
- <432> “N(H, 저급-알킬)-저급-알콕시” 는 하기 기를 의미한다: $-O-$ 저급 알킬레닐-NH(저급 알킬) 기.
- <433> “벤질옥시-저급-알콕시” 는 하기 기를 의미한다: $-O-$ 저급 알킬레닐-O-벤질 기.
- <434> “약학적으로 허용가능한” 예컨대 약학적으로 허용가능한 담체, 부형제, 등은 특정 화합물이 투여되는 대상에게 약물학적으로 허용가능하고 실질적으로 비독성임을 의미한다.
- <435> “약학적으로 허용가능한 염” 은, 본 발명의 화합물의 생물학적 효능 및 특성을 보유하고, 적절한 비독성 유기 또는 무기산, 또는 유기 또는 무기 염기로부터 형성되는 통상적 산-부가염 또는 염기-부가염을 지칭한다. 샘플 산-부가염은 무기산, 예컨대 염산, 히드로브롬산, 히드로요오드산, 황산, 술폰산, 인산 및 질산에서 유도되는 것, 유기산, 예컨대 p-톨루엔술폰산, 살리실산, 메탄술폰산, 옥살산, 숙신산, 시트르산, 말산, 락트산, 푸마르산, 트리플루오로 아세트산 등에서 유도되는 것을 포함한다. 샘플 염기-부가염은 암모늄, 칼륨, 나트륨 및, 4차 암모늄 히드록시드, 예컨대, 테트라메틸암모늄 히드록시드에서 유도되는 것을 포함한다. 약학적 화합물 (즉 약물) 의 염으로의 화학적 개질은 화합물의 개선된 물리적 및 화학적 안정성, 흡수성, 유동성 및 가공성을 획득하기 위하여 약제사들에게 익히 공지된 기술이다. 예를 들어, 문헌 [Ansel *et al*, Pharmaceutical Dosage Forms and Drug Delivery Systems (6th Ed. 1995) pp. 196 및 1456-1457] 을 참고한다.
- <436> 적어도 하나의 비대칭 탄소 원자를 가지는 화학식 I 의 화합물 뿐 아니라 이의 염은 라세믹 혼합물 또는 다른 입체이성질체로서 존재할 수 있다. 다양한 이성질체는 공지된 분리 방법, 예를 들어 크로마토그래피로 분리될 수 있다.
- <437> 본원에 개시되고 상기 화학식 I 에 포함되는 화합물은 토포머적 (tautomerism) 또는 구조적 이성질성을 가질 수 있다. 본 발명이 이러한 화합물의 토포머적 또는 구조적 이성질체 형태, 또는 이러한 형태의 혼합물을 포함하는 것을 의도하고, 상기 묘사된 화학식 I 의 토포머적 또는 구조적 이성질체 중 임의의 한가지에 제한되지 않는다.
- <438> 본 발명의 화합물은 세포 증식성 장애, 특히 종양 장애의 치료 또는 제어에 유용하다. 이들 화합물 및 상기 화합물을 함유하는 제형물은 고형 종양, 예를 들어 유방 종양, 결장 종양, 폐 종양 및 전립선 종양의 치료 또는 제어에 유용할 수 있다.
- <439> 본 발명에 따른 화합물의 치료학적 유효량이란, 치료되는 대상의 생존을 연기시키거나 질환의 증상을 예방, 경감 또는 완화시키는데 효과적인 화합물의 양을 의미한다. 치료학적 유효량 결정은 당 기술 범위 내에서 한다.
- <440> 본 발명에 따른 화합물의 치료학적 유효량 또는 투여량은 당해 분야에 공지된 방식으로 결정될 수 있으며, 넓은 범위 내에서 가변적일 수 있다. 이러한 투여량은 투여되는 특정 화합물(들), 투여 경로, 치료될 상태 뿐 아니라 치료받는 환자를 포함한 특정한 각각의 경우에 개별적인 요구사항에 맞게 조절될 수 있다. 일반적으로, 체중이 약 70 kg 인 성인에게 경구 또는 비경구 투여하는 경우, 1일 투여량은 약 10 mg 내지 약 10,000 mg, 바람직하게 약 200 mg 내지 약 1,000 mg 인 것이 적절할 것이며, 지시시 상한선을 넘을 수도 있다. 1일 투여량은 단일 용량 또는 분할된 용량으로 투여될 수 있고, 또는 비경구 투여의 경우, 연속적 주입으로 주어질 수도 있다.
- <441> 본 발명의 제형물은 경구, 비강, 국소 (협착 및 설하 포함), 직장, 질 및/또는 비경구 투여에 적합한 것을 포함한다. 제형물은 단위 투여량 형태로 간편하게 제공될 수 있으며, 약학 분야에 익히 공지된 임의 방법으로 제조될 수 있다. 단일 투여량 형태를 제조하도록 담체 재료와 조합될 수 있는 활성 성분의 양은 치료되는 호스트 및 투여의 특정 방식에 따라 매우 달라질 수 있다. 담체 물질과 조합하여 단일 투여량 형태를 제조

할 수 있는 활성 성분의 양은 일반적으로 치료학적 효과를 낼 수 있는 화학식 I 의 화합물의 양일 것이다.

일반적으로, 100 % 중에서, 이 양은 약 1 % 내지 약 99 %, 바람직하게 약 5 % 내지 약 70 %, 가장 바람직하게 약 10 % 내지 약 30 % 의 활성 성분 범위일 것이다.

<442> 이러한 제형물 또는 조성물의 제조 방법은 본 발명의 화합물과 담체, 및 임의로는 하나 이상의 보조 성분을 결합시키는 단계를 포함한다. 일반적으로, 제형물은 본 발명의 화합물을 액체 담체, 또는 미세하게 분쇄된 고체 담체 또는 둘 다와 균일하고 완전하게 결합시킨 후, 필요시 생성물을 성형하여 제조된다.

<443> 경구 투여에 적합한 본 발명의 제형물은 캡슐, 카세제, 향낭, 알약, 정제, 로젠지 (향 베이스를 사용함, 주로, 수크로오스 및 아카시아 또는 트래거캔스), 분말, 과립 형태로, 또는 수성 또는 비수성 액체 중 용액 또는 현탁액으로, 또는 수중유 또는 유중수 액체 유화액으로, 또는 엘릭시르 또는 시럽으로, 또는 향정 (불활성 베이스를 사용함, 예컨대 젤라틴 및 글리세린, 또는 수크로오스 및 아카시아) 및/또는 구강세정액 등일 수 있고, 각각 활성 성분으로서 본 발명의 화합물의 소정량을 함유한다. 본 발명의 화합물은 약당이, 연약 또는 페이스트로 투여될 수 있다.

<444> "유효량" 은 치료되는 대상의 생존을 연장시키거나 질환의 증상을 예방, 경감 또는 완화시키는데 효과적인 양을 의미한다.

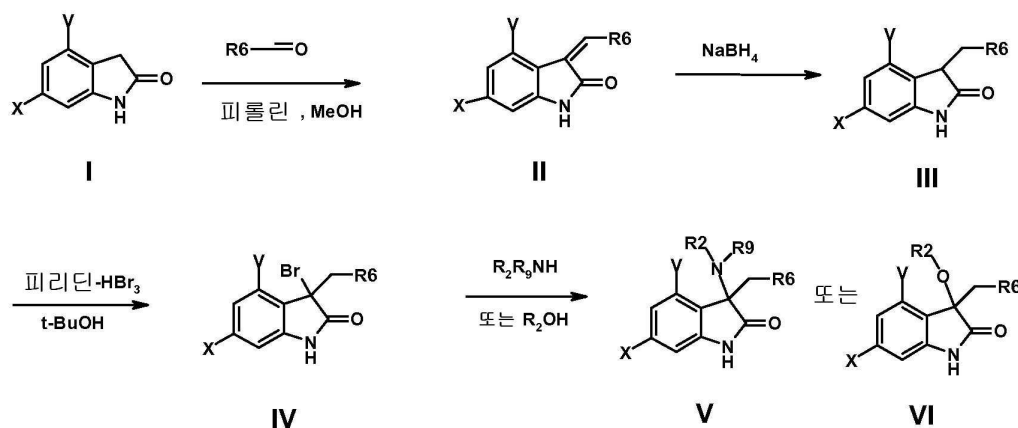
<445> "IC₅₀" 은 특정한 측정된 활성의 50 % 를 저해하는데 필요한 특정 화합물의 농도를 지칭한다. IC₅₀ 은 특하기에 기재된 바와 같이 측정될 수 있다.

<446> 본 발명의 화합물은 하기의 일반 도식에 따라 합성할 수 있다.

<447> 합성

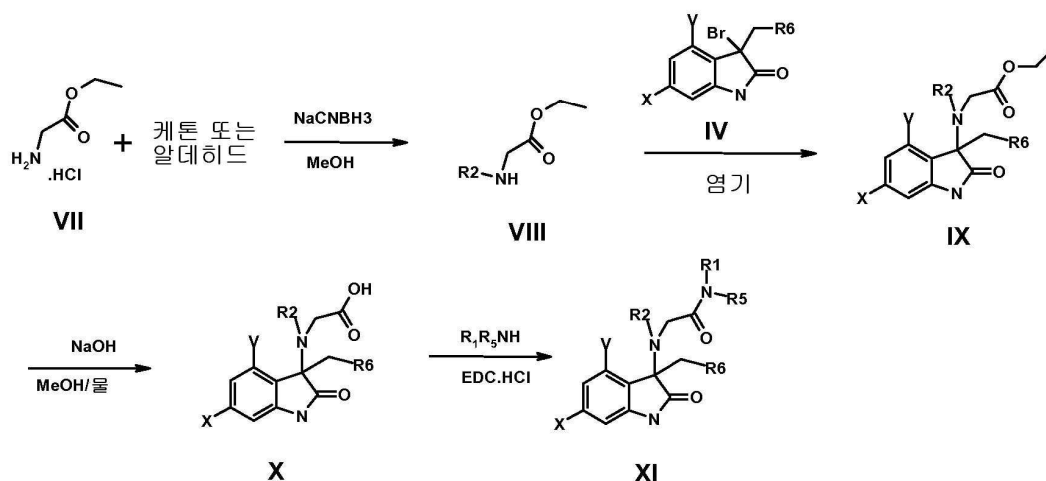
<448> 본 발명의 화합물은 하기 일반 도식에 따라 합성될 수 있다. 당업자에게 있어서, 화학식 I 의 화합물은 반응물 또는 시약을 일반적인 합성 경로에서 치환함으로써 제조될 수 있음이 용이하게도 명백할 것이다. 출발 물질은 시판중인 것을 통해 입수가가능하거나 또는 당업자에게 공지된 익히 확립된 문헌 내 방법으로 합성할 수 있다. 예를 들어, 6-치환된 옥소인돌 I 출발물질은 시판중 입수가가능하거나 상응하는 4-치환된 2-니트로-플루오로 또는 클로로벤젠으로부터 [Kraynack, E. A.; Dalgard, J. E.; Gaeta, F. C. A. Tetrahedron Letters, 1998, 39, 7679 - 7682] 에 따라 제조하였다. 3-모노-치환된 1,3-디히드로-인돌-2-온 II 는 여러 방법으로 합성할 수 있다. 이들에는 그 중에서도, [Hewawasam, P.; Erway, M.; Moon, S. L.; Knipe, J.; Weiner, H.; Boissard, C. G.; Post-Munson, D. J.; Gao, Q.; Huang, S.; Gribkoff, V. K.; Meanwell, N. A. J. Med. Chem. 2002, 45, 1487 - 1499 또는 Elliott, I. W.; Rivers, P. J. Org. Chem. 1964, 29, 2438 - 2440 및 Andreani, A.; Rambaldi, M.; Locatelli, A.; Bossa, R.; Galatulas, I.; Ninci, M. Eur. J. Med. Chem. 1990, 25, 187 - 190 (도식 1)] 의 방법이 포함된다. 옥소인돌 I 를 적절히 치환된 알데히드와, 가열 조건으로, 메탄올, 에탄올과 같은 양성자성 용매 중 염기의 존재하에서 반응시켜 중간체 II 를 수득할 수 있다. 통상적으로 사용되는 염기는 피롤리딘 또는 피페리딘이다. 그 다음에 중간체 II 를 메탄올 또는 에탄올 중 NaBH₄ 로 용이하게 환원시켜 중간체 IV 를 수득할 수 있다. 피리디늄 트리브로마이드에 의한 3-위치 브롬화를 실온에서 tert-부탄올 중에서 달성할 수 있다. 브로마이드의 R₂R₃NH 또는 R₂OH 로 후속하는 친핵성 치환으로 원하는 생성물 V 또는 VI 를 수득한다 (도식 1).

도식 1



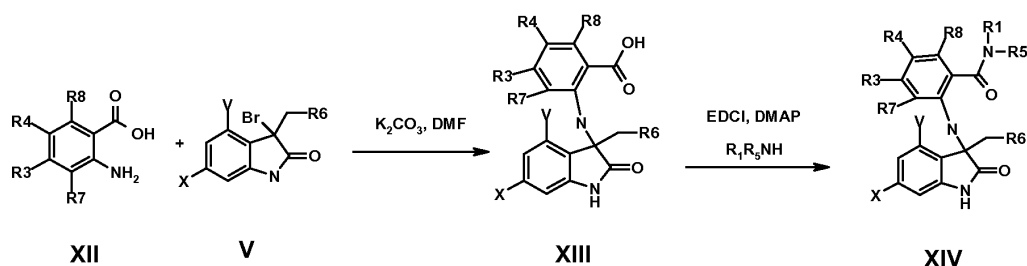
개질된 글리신 중간체 VIII 은, NaCNBH_3 을 이용해 각종 알데히드 또는 케톤으로 글리신 출발 물질 VII 의 환원성 아미노화로 제조할 수 있다. V 에서 브로마이드를 중간체 VIII 로 친핵성 치환하여 IX 을 획득한다. IX 의 가수분해로, 카르복실산 중간체 X 를 형성한다. 유도체화된 화합물 XI 는 카르복스아미드 형성에 대해 익히 공지된 커플링 방법을 이용해 산 X 로부터 출발하여 제조할 수 있다 (도식 2).

도식 2



도식 1 에서 기술한 방법과 유사한 방식으로, 안트라닐산 XIII 를 중간체 V 및 안트라닐산 XII 로부터 제조할 수 있다. XII 는 시판중에서 입수가능하거나 또는 익히 확립된 문헌 절차에 따라 용이하게 제조한다. 각종 화합물 XIV 는 산 XIII 및 아민 $\text{R}_1\text{R}_3\text{NH}$ 으로부터 카르복스아미드 형성의 익히 공지된 커플링 방법을 이용해 제조할 수 있다 (도식 3).

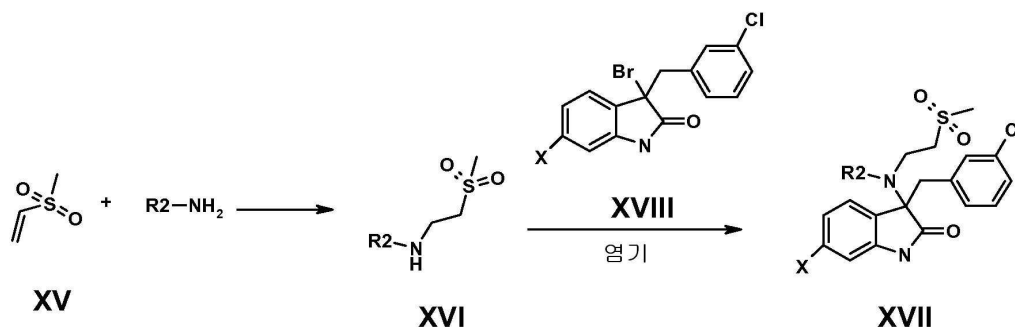
도식 3



술폰 유사체 XVII 는 도식 1 에서의 V 와 유사한 방식으로 중간체 XVI 및 XVIII 로부터 형성될 수 있다 (도식 4). 중간체 XVI 는 시판중에 이용가능한 α, β -불포화 XV 및 각종 아민 R_2NH_2 으로부터, Michael 부가형 반

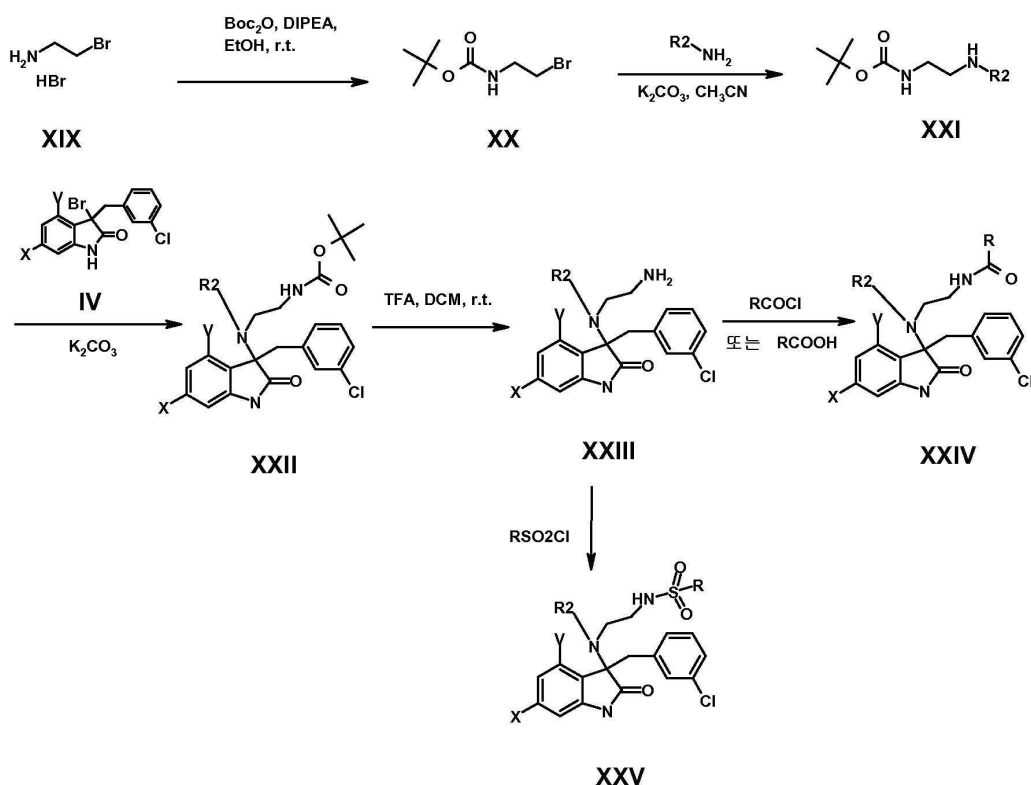
응으로써 1 단계로 합성된다.

<458> 도식 4



<459> 다양한 유도체 XXIV 및 XXV 는, 일반 도식 5 에 따라 달성될 수 있다. 중간체 XXI 는 시판중에서 이용가능한 화합물 XIX 로부터 출발하여 2 단계로 제조된다. 도식 1 의 방법과 유사하게 하여, 화합물 XXII 는 Br 을 XXI 로 친핵성 치환하여 형성된다. Boc 기의 트리플루오로산에 의한 탈보호화로 아민 중간체 XXIII 를 수득한다. 후속해서, 화합물 XXIV 또는 XXV 는, R₂NH 상에 유도체화 아실 또는 술폰닐기를 선택적으로 부착 시킴으로써 제조가능하다. R 은 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 알케닐, 헤테로사이클, 치환된 헤테로사이클이다.

<461> 도식 5

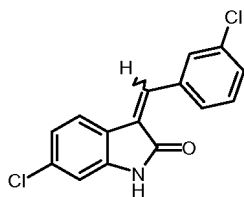


<462> 여기서, R 은 저급 알킬, 치환된 저급 알킬, 아릴, 치환된 아릴, 헤테로아릴, 치환된 헤테로아릴, 시클로알킬, 치환된 시클로알킬, 시클로알케닐, 치환된 알케닐, 헤테로사이클 또는 치환된 헤테로사이클이다.

<463> 하기 실시예 및 참고예는 본 발명의 이해를 돕기 위해 제공된 것으로, 이의 진정한 취지는 첨부된 청구항에 기술되어 있다.

<465> 실시예 1a

<466> 중간체 E/Z-6-클로로-3-(3-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 290.15

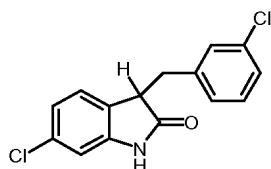
C₁₅H₉Cl₂NO

<467>

<468> 6-클로로옥소인돌 (16.7 g, 0.1 mol) (Crescent) 및 3-클로로벤즈알데히드 (14.1 g, 0.1 mol) (Aldrich) 의 메탄올 (100 mL) 중 혼합물에, 피롤리딘 (7.1g, 0.1 mol) (Aldrich) 을 적가했다. 혼합물을 이어서 70 °C 에서 3 시간 동안 가열했다. 4 °C 로 냉각한 후에, 생성된 침전물을 수집하고 건조시켜, 20 g 의 E/Z-6-클로로-3-(3-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 밝은 황색 고체로서 수득했다. MS: 291 (M+H)⁺.

<469> 실시예 1b

<470> 중간체 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 292.17

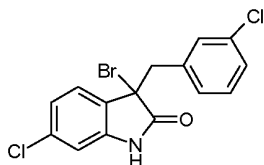
C₁₅H₁₁Cl₂NO

<471>

<472> 소듐 보로하이드라이드 (3.0 g, 79 mmol) (Aldrich) 를 E/Z-6-클로로-3-(3-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (19 g, 66 mmol) (상기 실시예 1a) 의 메탄올 (200 mL) 및 DMSO (50 mL) 중 현탁액에 소량 분획으로 기체 발생이 너무 격렬하지 않는 속도로 첨가했다. 첨가가 완료되었을 때, 혼합물을 실온에서 0.5 시간 내지 1 시간 동안 교반했다. 물 (200mL) 에 첨가한 후, 생성된 침전물을 수집하고 건조시켜 18 g 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 연한 황색 고체로서 수득했다. MS: 293 (M+H)⁺.

<473> 실시예 1c

<474> 중간체 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 371.06

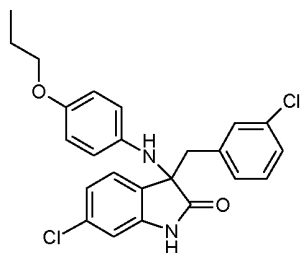
C₁₅H₁₀BrCl₂NO

<475>

<476> 피리디늄 브로마이드 퍼브로마이드 (21.7g, 68 mmol) (Aldrich) 를, rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (18 g, 62 mmol) (상기 실시예 1b) 의 t-BuOH (400 mL) 및 물 (2 mL) 중 용액에 한 분획으로 하여 실온에서 교반하면서 첨가했다. 실온에서 4 시간 교반한 후, 혼합물을 물 (500 mL) 로 희석하고, 1 시간 동안 교반했다. 생성 침전물을 수집하고 건조시켜, 22 g 의 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 담황색 고체로서 수득했다. MS: 371 (M+H)⁺.

<477> 실시예 1d

<478> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



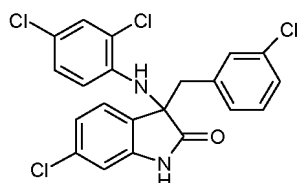
M. W. 441.36 $C_{24}H_{22}Cl_2N_2O_2$

<479>

<480> rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100 mg, 0.27 mmol) (상기 실시예 1c), 4-프로폭시-페닐아민 (61 mg, 0.41 mmol) 및 DIPEA (104.5 mg, 0.81 mmol) 의 프로판-2-올 (10mL) 중 혼합물을 실온에서 2 시간 교반했다. 그 다음 물 (10 mL) 을 첨가하고, 원하는 생성물을 침전시켜 낸 다음 여과시키고 건조시켜 98 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: 441 (M+H)⁺.

<481> 실시예 2

<482> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,4-디클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



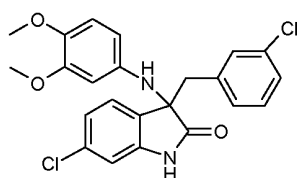
M. W. 452.17 $C_{21}H_{14}Cl_4N_2O$

<483>

<484> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 452 (M+H)⁺.

<485> 실시예 3

<486> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4-디메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 443.33 $C_{23}H_{20}Cl_2N_2O_3$

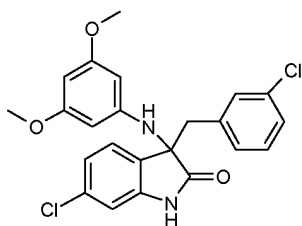
<487>

<488> 표제 화합물 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차

와 동일하게 하여 제조했다. MS: 443 (M+H)⁺.

<489> 실시예 4

<490> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,5-디메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



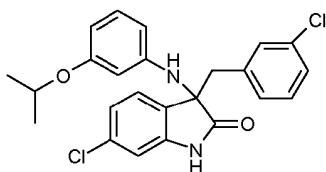
M. W. 443.33 C₂₃H₂₀Cl₂N₂O₃

<491>

<492> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 443 (M+H)⁺.

<493> 실시예 5

<494> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



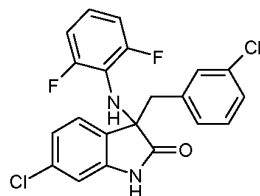
M. W. 441.36 C₂₄H₂₂Cl₂N₂O₂

<495>

<496> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 441 (M+H)⁺.

<497> 실시예 6

<498> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,6-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



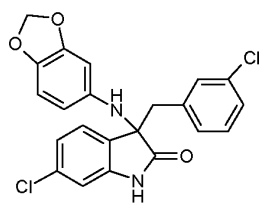
M. W. 419.26 C₂₁H₁₄Cl₂F₂N₂O

<499>

<500> 표제 화합물 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 419 (M+H)⁺.

<501> 실시예 7

<502> rac-3-(벤조[1,3]디옥솔-5-일아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 427.29

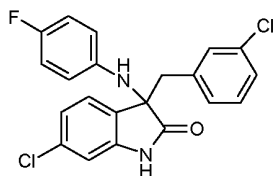
$C_{22}H_{16}Cl_2N_2O_3$

<503>

<504> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 427 (M+H)⁺.

<505> 실시예 8

<506> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 401.27

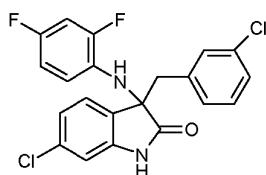
$C_{21}H_{15}Cl_2FN_2O$

<507>

<508> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 401 (M+H)⁺.

<509> 실시예 9

<510> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 419.26

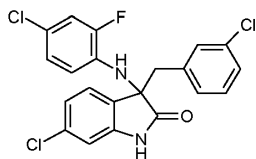
$C_{21}H_{14}Cl_2F_2N_2O$

<511>

<512> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 419 (M+H)⁺.

<513> 실시예 10

<514> rac-6-클로로-3-(3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

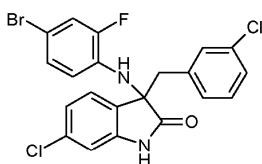


<515> M. W. 435.72 $C_{21}H_{14}Cl_3FN_2O$

<516> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 435 (M+H)⁺.

<517> 실시예 11

<518> rac-3-(4-브로모-2-플루오로-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

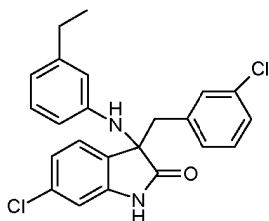


<519> M. W. 480.17 $C_{21}H_{14}BrCl_2FN_2O$

<520> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 480 (M+H)⁺.

<521> 실시예 12

<522> rac-6-클로로-3-(3-(3-클로로-벤질)-3-(3-에틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

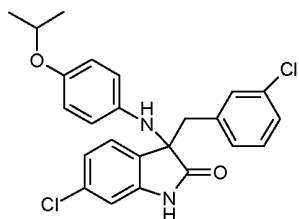


<523> M. W. 411.33 $C_{23}H_{20}Cl_2N_2O$

<524> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 411 (M+H)⁺.

<525> 실시예 13

<526> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-이소프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 441.36 $C_{24}H_{22}Cl_2N_2O_2$

<527>

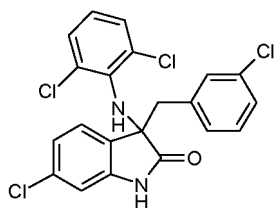
<528> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 441 (M+H)⁺. ¹H-NMR

(400 MHz, DMSO-d₆) δ 10.54 (s,1H), 7.22 (m,1H), 7.15 (m,2H), 7.02 (dd,1H),
6.86 (t,1H),
6.76 (d,1H), 6.64 (d,1H), 6.54 (m,2H), 6.18 (m,3H), 4.28 (m,1H), 3.24
(dd,2H),1.13 (d,6H).

<529>

<530> 실시예 14

<531> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,6-디클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



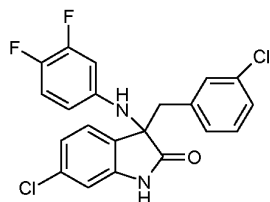
M. W. 452.17 $C_{21}H_{14}Cl_4N_2O$

<532>

<533> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 452 (M+H)⁺.

<534> 실시예 15

<535> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 419.26 $C_{21}H_{14}Cl_2F_2N_2O$

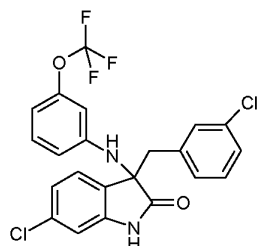
<536>

<537> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 419 (M+H)⁺. ¹H-NMR

(400 MHz, DMSO-d₆) δ 10.68 (s,1H), 7.22 (m,3H), 7.05 (m,2H), 6.84 (m,2H),
6.76 (d,1H),
6.68 (d,1H), 6.15 (m,1H), 5.96 (m,1H), 3.31(d,1H), 3.14 (d,1H).

실시예 16

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-트리플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



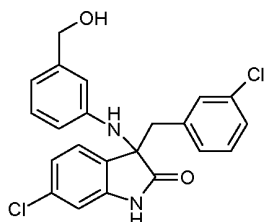
M. W. 467.28 C₂₂H₁₅Cl₂F₃N₂O₂

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 467 (M+H)⁺. ¹H-NMR

(400MHz, DMSO-d₆) δ 10.73(s, 1H), 7.22(m, 3H), 7.05(m, 3H), 6.86(t, 1H),
6.76(d, 1H), 6.68(d,1H), 6.46(m,1H), 6.19(dd,1H), 6.12(d,1H), 3.29(d,1H),
3.15(d,1H).

실시예 17

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

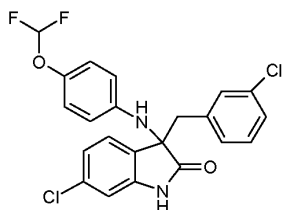


M. W. 413.31 C₂₂H₁₈Cl₂N₂O₂

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 413 (M+H)⁺.

실시예 18

<549> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 449.29 $C_{22}H_{16}Cl_2F_2N_2O_2$

<550>

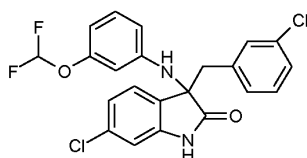
<551> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 449 (M+H)⁺.

<552> H^1 -NMR (400MHz, DMSO- d_6) δ 10.63(s, 1H), 7.20(m, 3H), 7.03(dd,
1H), 6.85(t, 1H), 6.80(d, 2H), 6.76(d, 1H), 6.70(d, 1H), 6.66(d, 1H), 6.22(m, 2H),
3.29(d, 1H), 3.15(d, 1H).

<553>

<554> 실시예 19

<555> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-디플루오로메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



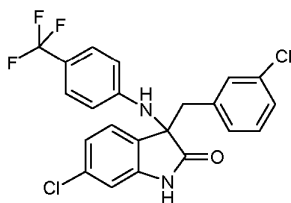
M. W. 449.29 $C_{22}H_{16}Cl_2F_2N_2O_2$

<556>

<557> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 449 (M+H)⁺.

<558> 실시예 20

<559> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



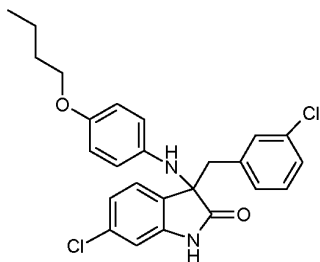
M. W. 451.28 $C_{22}H_{15}Cl_2F_3N_2O$

<560>

<561> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절
차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 451 (M+H)⁺.

<562> 실시예 21

<563> rac-3-(4-부톡시-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

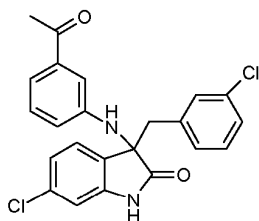


<564> M. W. 455.39 $C_{25}H_{24}Cl_2N_2O_2$

<565> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 455 (M+H)⁺.

<566> 실시예 22

<567> rac-3-(3-아세틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

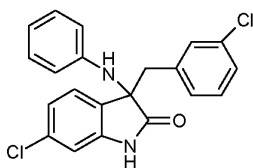


<568> M. W. 425.32 $C_{23}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<569> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 425 (M+H)⁺.

<570> 실시예 23

<571> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-페닐아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

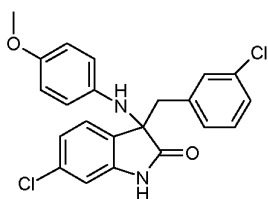


<572> M. W. 383.28 $C_{21}H_{16}Cl_2N_2O$

<573> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 383 (M+H)⁺.

<574> 실시예 24

<575> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 413.31 $C_{22}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<576>

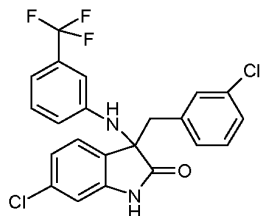
<577> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일하게 하여 제조했다. MS: 413 (M+H)⁺.

<578>

실시예 25

<579>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<580>

M. W. 451.28 $C_{22}H_{15}Cl_2F_3N_2O$

<581>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 동일한 절차로 제조했다. MS: 451 (M+H)⁺.

<582>

1H -NMR(400MHz, DMSO-d₆) δ 10.73(s, 1H), 7.22(m, 5H), 7.03(d, 1H),

6.86(t, 1H), 6.83(d,1H),6.78(d,1H), 6.70(d,1H), 6.57(s,1H), 6.35(dd,1H),
3.31(d,1H), 3.17(d,1H).

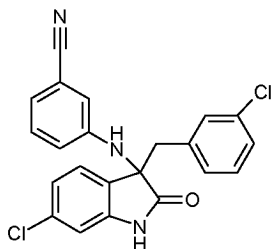
<583>

<584>

실시예 26

<585>

rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]-벤조니트릴의 제조



<586>

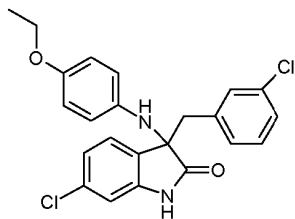
M. W. 408.29 $C_{22}H_{15}Cl_2N_3O$

<587>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 동일한 절차로 제조했다. MS: 408 (M+H)⁺.

<588> 실시예 27

<589> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-에톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



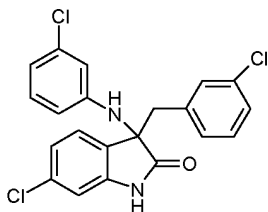
M. W. 427.33 $C_{23}H_{20}Cl_2N_2O_2$

<590>

<591> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 동일한 절차로써 제조했다. MS: 427 (M+H)⁺.

<592> 실시예 28

<593> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



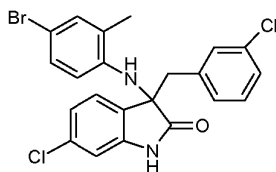
M. W. 417.73 $C_{21}H_{15}Cl_3N_2O$

<594>

<595> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 417 (M+H)⁺.

<596> 실시예 29

<597> rac-3-(4-브로모-2-메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



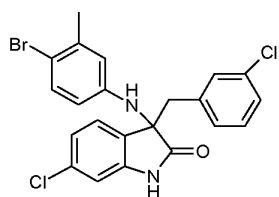
M. W. 476.20 $C_{22}H_{17}BrCl_2N_2O$

<598>

<599> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 476 (M+H)⁺.

<600> 실시예 30

<601> rac-3-(4-브로모-3-메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



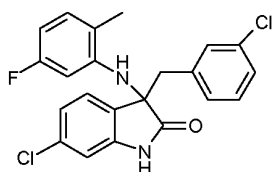
M. W. 476.20 $C_{22}H_{17}BrCl_2N_2O$

<602>

<603> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 476 (M+H)⁺.

<604> 실시예 31

<605> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(5-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



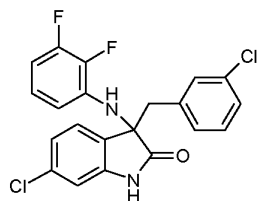
M. W. 415.30 $C_{22}H_{17}Cl_2FN_2O$

<606>

<607> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로써 제조했다. MS: 415 (M+H)⁺.

<608> 실시예 32

<609> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2,3-디플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



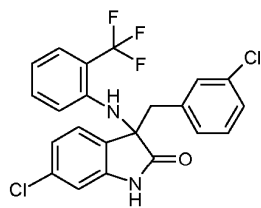
M. W. 419.26 $C_{21}H_{14}Cl_2F_2N_2O$

<610>

<611> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 419 (M+H)⁺.

<612> 실시예 33

<613> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-트리플루오로메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



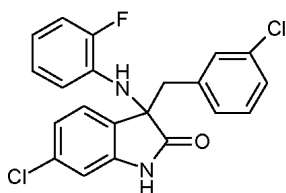
M. W. 451.28 $C_{22}H_{15}Cl_2F_3N_2O$

<614>

<615> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 451 (M+H)⁺.

<616> 실시예 34

<617> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<618>

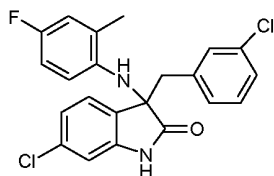
M. W. 401.27 $C_{21}H_{15}Cl_2FN_2O$

<619>

<620> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 401 (M+H)⁺.

<621> 실시예 35

<622> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-플루오로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



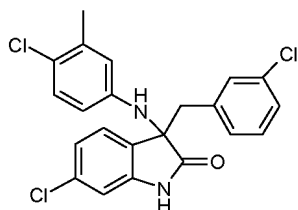
M. W. 415.30 $C_{22}H_{17}Cl_2FN_2O$

<623>

<624> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 415 (M+H)⁺.

<625> 실시예 36

<626> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-클로로-3-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



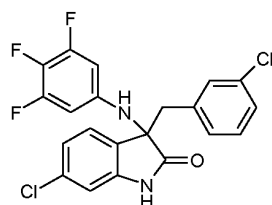
M. W. 431.75 $C_{22}H_{17}Cl_3N_2O$

<627>

<628> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 431 (M+H)⁺.

<629> 실시예 37

<630> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3,4,5-트리플루오로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 437.25 $C_{21}H_{13}Cl_2F_3N_2O$

<631>

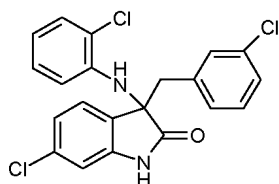
<632> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 437 (M+H)⁺.

<633> H^1 -NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.76 (s, 1H), 7.22(m,4H), 7.07(dd,2H),

<634> 6.84(t,1H), 6.76(d,1H), 6.71(d,1H), 5.96 (m,2H), 3.31(d,1H), 3.14(d,1H).

<635> 실시예 38

<636> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-클로로-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



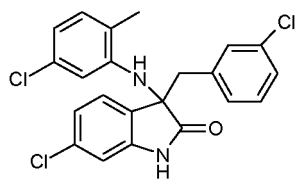
M. W. 417.73 $C_{21}H_{15}Cl_3N_2O$

<637>

<638> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 417 (M+H)⁺.

<639> 실시예 39

<640> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(5-클로로-2-메틸-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



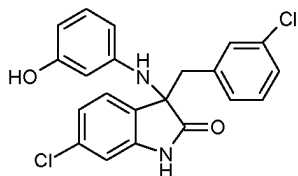
M. W. 431.75 $C_{22}H_{17}Cl_3N_2O$

<641>

<642> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 431 (M+H)⁺.

<643> 실시예 40

<644> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



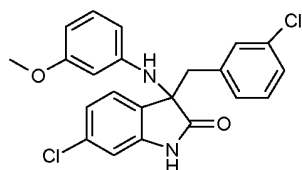
M. W. 399.28 $C_{21}H_{16}Cl_2N_2O_2$

<645>

<646> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 399 (M+H)⁺.

<647> 실시예 41

<648> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-메톡시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



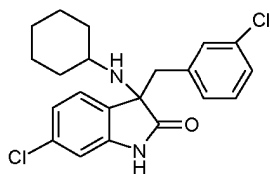
M. W. 413.31 $C_{22}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<649>

<650> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1, 3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질
차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 413 (M+H)⁺.

<651> 실시예 42

<652> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 389.33

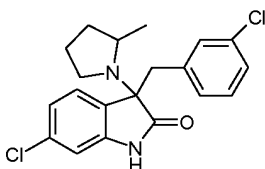
C₂₁H₂₂Cl₂N₂O

<653>

<654> rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100 mg, 0.27 mmol) (상기 실시예 1c), 시클로헥실아민 (40 mg, 0.41mmol) 및 DIPEA (104.5 mg, 0.81mmol) 의 디메틸 포르마이드 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 2 시간 교반했다. 이어서, 물 (10 mL) 을 첨가하고, 수성 층을 에틸 아세테이트 (3x10 mL) 로 추출했다. 조합된 유기층을 농축하고, 잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해 51 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: 389 (M+H)⁺.

<655> 실시예 43

<656> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-메틸-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 375.30

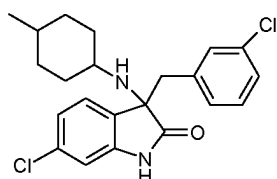
C₂₀H₂₀Cl₂N₂O

<657>

<658> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 375 (M+H)⁺.

<659> 실시예 44

<660> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-메틸-시클로헥실아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 403.36

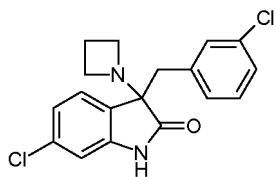
C₂₂H₂₄Cl₂N₂O

<661>

<662> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 403 (M+H)⁺.

<663> 실시예 45

<664> rac-3-아제티딘-1-일-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

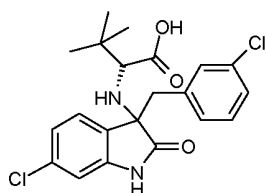


<665> M. W. 347.25 C₁₈H₁₆Cl₂N₂O

<666> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 347 (M+H)⁺.

<667> 실시예 46

<668> rac-(2R)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]3,3-디메틸-부티르산의 제조

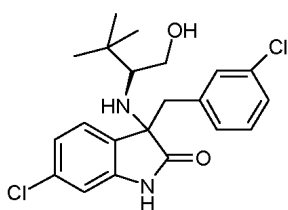


<669> M. W. 421.33 C₂₁H₂₂Cl₂N₂O₃

<670> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 421 (M+H)⁺.

<671> 실시예 47

<672> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-히드록시메틸-2,2-디메틸-프로필아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



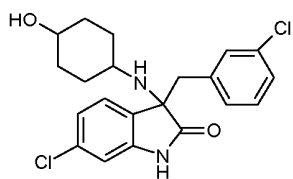
<673>

<674> M. W. 407.34 C₂₁H₂₄Cl₂N₂O₂

<675> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 407 (M+H)⁺.

<676> 실시예 48

<677> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-히드록시-시클로헥실아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 405.33 $C_{21}H_{22}Cl_2N_2O_2$

<678>

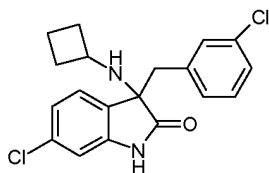
<679> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 405 (M+H)⁺.

<680>

실시예 49

<681>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로부틸아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 361.27 $C_{19}H_{18}Cl_2N_2O$

<682>

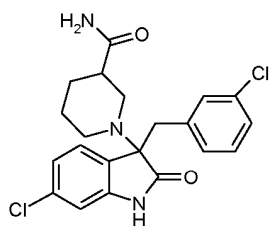
<683> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 361 (M+H)⁺.

<684>

실시예 50

<685>

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 아미드의 제조



M. W. 418.33 $C_{21}H_{21}Cl_2N_3O_2$

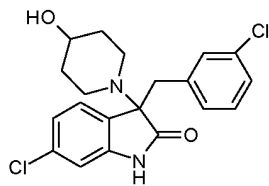
<686>

<687> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 418 (M+H)⁺.

<688>

실시예 51

<689> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 391.30

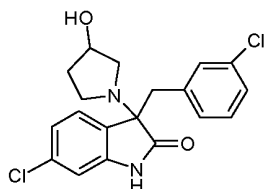
$C_{20}H_{20}Cl_2N_2O_2$

<690>

<691> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 391 (M+H)⁺.

<692> 실시예 52

<693> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 377.27

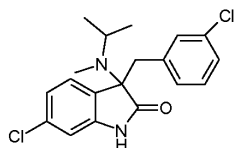
$C_{19}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<694>

<695> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 377 (M+H)⁺.

<696> 실시예 53

<697> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 363.29

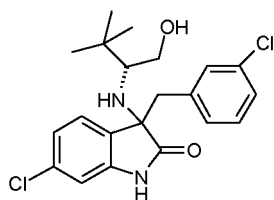
$C_{19}H_{20}Cl_2N_2O$

<698>

<699> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 363 (M+H)⁺.

<700> 실시예 54

<701> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1R)-히드록시메틸-2,2-디메틸-프로필아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

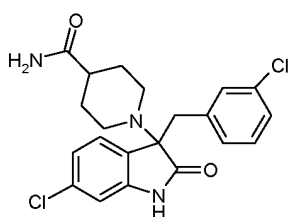


M. W. 407.34 **C₂₁H₂₄Cl₂N₂O₂**

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 407 (M+H)⁺.

실시예 55

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조

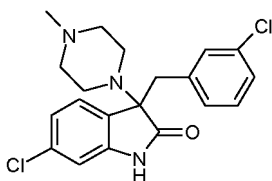


M. W. 418.33 **C₂₁H₂₁Cl₂N₃O₂**

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 418 (M+H)⁺.

실시예 56

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-메틸-피페라진-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

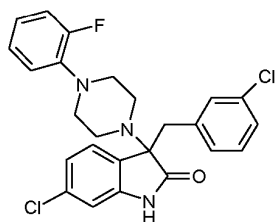


M. W. 390.32 **C₂₀H₂₁Cl₂N₃O**

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 390 (M+H)⁺.

실시예 57

<713> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-플루오로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



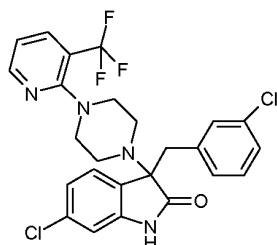
M. W. 470.38 $C_{25}H_{22}Cl_2FN_3O$

<714>

<715> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 470 (M+H)⁺.

<716> 실시예 58

<717> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-트리플루오로메틸-피리딘-2-일)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



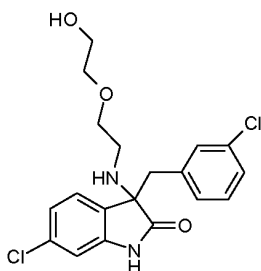
M. W. 521.37 $C_{25}H_{21}Cl_2F_3N_4O$

<718>

<719> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 521 (M+H)⁺.

<720> 실시예 59

<721> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(2-히드록시-에톡시)-에틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



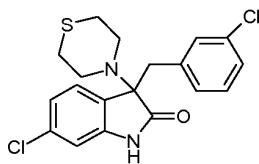
M. W. 395.29 $C_{19}H_{20}Cl_2N_2O_3$

<722>

<723> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 395 (M+H)⁺.

<724> 실시예 60

<725> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-티오모르폴린-4-일-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

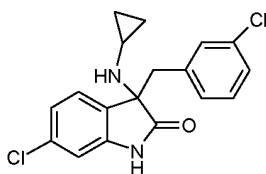


<726> M. W. 393.34 $C_{19}H_{18}Cl_2N_2OS$

<727> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 393 (M+H)⁺.

<728> 실시예 61

<729> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로프로필아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

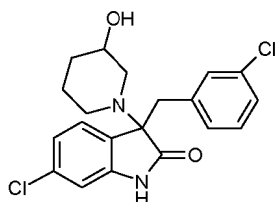


<730> M. W. 347.25 $C_{18}H_{16}Cl_2N_2O$

<731> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 347 (M+H)⁺.

<732> 실시예 62

<733> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



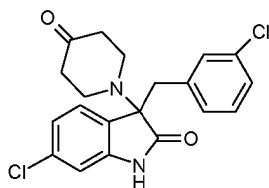
M. W. 391.30 $C_{20}H_{20}Cl_2N_2O_2$

<734>

<735> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 391 (M+H)⁺.

<736> 실시예 63

<737> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-옥소-피페리딘-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 389.28 $C_{20}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<738>

<739> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동

일한 절차로 제조했다. MS: 390 (M+H)⁺. H¹-

NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.46(s, 1H), 7.40 (d, 1H), 7.13(m, 3H), 6.89(s, 1H), 6.80(d, 1H), 6.59 (s, 1H), 3.37 (dd, 2H), 2.88 (s, 4H), 2.33(s, 4H).

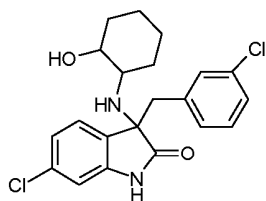
<740>

<741>

실시예 64

<742>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-시클로헥실아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<743>

M. W. 405.33

C₂₁H₂₂Cl₂N₂O₂

<744>

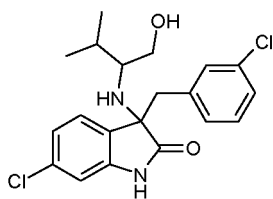
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 405 (M+H)⁺.

<745>

실시예 65

<746>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(1-히드록시메틸-2-메틸-프로필아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<747>

M. W. 393.32

C₂₀H₂₂Cl₂N₂O₂

<748>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 393 (M+H)⁺. H¹-

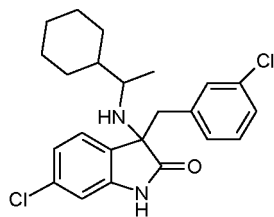
NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.39(s, 1H), 7.20 (m, 1H), 7.18(t, 1H), 7.00(m, 3H), 6.80(m, 1H), 6.66(t, 1H), 4.21 (t, 1H), 3.29 (m, 1H), 3.19(m, 1H), 3.31(d, 1H), 2.83(d, 1H), 2.47(m, 1H), 1.88(m, 1H), 1.60 (m, 1H), 0.70(dd, 6H).

<749>

<750>

실시예 66

<751> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(1-시클로헥실-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 417.38

$C_{23}H_{26}Cl_2N_2O$

<752>

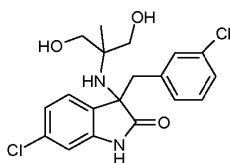
<753> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 417 (M+H)⁺.

<754>

실시예 67

<755>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-1-히드록시메틸-1-메틸-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 395.29

$C_{19}H_{20}Cl_2N_2O_3$

<756>

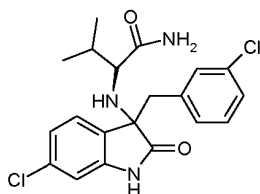
<757> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 395 (M+H)⁺.

<758>

실시예 68

<759>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]-3-메틸-부티르아미드의 제조



M. W. 406.32

$C_{20}H_{21}Cl_2N_3O_2$

<760>

<761> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 406 (M+H)⁺. H¹-

NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.36(s, 1H), 7.30 (d, 1H), 7.13(m, 3H), 6.96(t, 1H), 6.87(t, 1H), 6.78(m, 2H), 6.57(s, 1H), 3.33 (m,1H), 3.17(dd, 2H), 2.84(d,1H),1.72(m,1H), 0.80(dd, 6H).

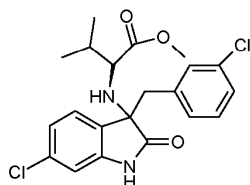
<762>

<763>

실시예 69

<764>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-부티르산 메틸 에스테르의 제조



M. W. 421.33

$C_{21}H_{22}Cl_2N_2O_3$

<765>

<766>

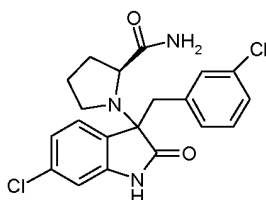
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 421 (M+H)⁺.

<767>

실시예 70

<768>

rac-(S)-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피롤리딘-2-카르복실산 아미드의 제조



M. W. 404.30

$C_{20}H_{19}Cl_2N_3O_2$

<769>

<770>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 404 (M+H)⁺. H¹-

<771>

NMR (400MHz,DMSO-d₆) δ 10.38(s, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.56(s, 1H), 7.28(s, 1H),

7.08(m,3H),6.79(s,1H), 6.70(d,1H), 6.55(s,1H), 4.40(d,1H), 3.19(dd,2H),

2.75(m,1H), 2.21(m,1H),1.90(m,2H), 1.60(m,2H).

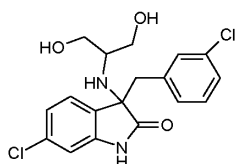
<772>

<773>

실시예 71

<774>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-1-히드록시메틸-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 381.26

$C_{18}H_{18}Cl_2N_2O_3$

<775>

<776>

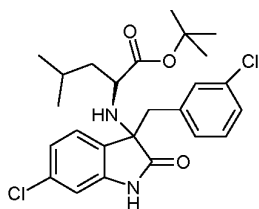
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 381 (M+H)⁺

<777>

실시예 72

<778>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W. 477.44

$C_{25}H_{30}Cl_2N_2O_3$

<779>

<780>

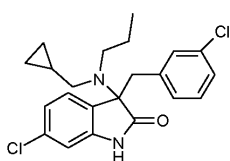
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 477 (M+H)⁺.

<781>

실시예 73

<782>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로프로필메틸-프로필-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 403.36

$C_{22}H_{24}Cl_2N_2O$

<783>

<784>

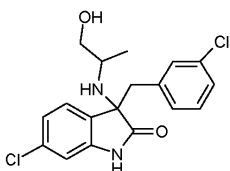
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 403 (M+H)⁺.

<785>

실시예 74

<786>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(2-히드록시-1-메틸-에틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 365.26

$C_{18}H_{18}Cl_2N_2O_2$

<787>

<788>

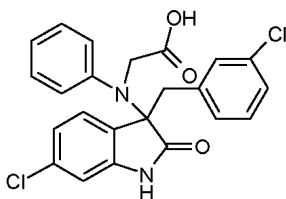
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 365 (M+H)⁺.

<789>

실시예 75

<790>

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트산의 제조



M. W. 441.32

$C_{23}H_{18}Cl_2N_2O_3$

<792>

<793>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동

일한 절차로 제조했다. MS: 441 (M+H)⁺. H¹-

NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ12.45(s,1H),10.42 (s, 1H), 7.44(d, 1H), 7.16(m, 4H), 6.96(m, 1H), 6.93(m,3H), 6.76(m,1H), 6.67 (d,1H), 6.64(d,1H), 4.00(dd,2H), 3.31(dd,2H).

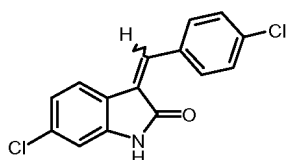
<794>

<795>

실시예 76a

<796>

중간체 E/Z-6-클로로-3-(4-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 290.15

C₁₅H₉Cl₂NO

<797>

<798>

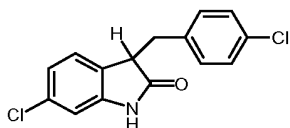
6-클로로옥소인돌 (16.2 g, 92 mmol) (Crescent) 및 4-클로로벤즈알데히드 (12.9 g, 92 mmol) (Aldrich) 의 메탄올 (100 mL) 중 혼합물에, 피롤리딘 (6.55 g, 92 mol) (Aldrich) 을 적가했다. 혼합물을 그 다음에 70 °C 에서 3 시간 동안 가열했다. 4 °C 까지 냉각시킨 후, 생성 침전물을 수집 및 건조시켜, 21 g 의 E/Z-6-클로로-3-(4-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 밝은 황색 고체로서 수득했다. MS: 291 (M+H)⁺.

<799>

실시예 76b

<800>

중간체 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 292.17

C₁₅H₁₁Cl₂NO

<801>

<802>

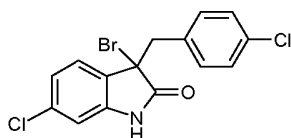
소듐 보로하이드라이드 (3.0 g, 79 mmol) (Aldrich) 를 6-클로로-3-(4-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (19 g, 66 mmol) (상기 실시예 76a) 의 메탄올 (200 mL) 및 DMSO (50 mL) 중 현탁액에 소량 분획하여 기체 발생이 너무 격렬하지 않는 속도로 첨가했다. 첨가를 완료했을 때, 혼합물을 실온에서 0.5 시간 내지 1 시간 동안 교반했다. 물 (200mL) 을 첨가한 후, 생성 침전물을 수집 및 건조시켜, 18.3 g 의 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 연한 황색 고체로서 수득했다. MS: 293 (M+H)⁺.

<803>

실시예 76c

<804>

중간체 rac-3-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 371.06

C₁₅H₁₀BrCl₂NO

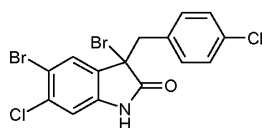
<805>

<806>

표제 화합물을 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 371(M+H)⁺.

<807> 실시예 76d

<808> 중간체 rac-3,5-디브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



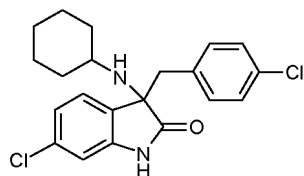
M. W. 449.96 $C_{15}H_9Br_2Cl_2NO$

<809>

<810> 브롬 (2.2g, 14.4mmol) 의 디클로로메탄 (10 mL) 중 용액을 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (2.0 g, 6.85 mmol) 의 디클로로메탄 (50mL) 중 용액에 적가했다. 반응 혼합물을 실온에서 1 시간 교반한 다음 물 (3 x 50 mL) 로 세정, Na_2SO_4 로 건조 및 진공하 농축시켜, 2.2 g 의 rac-3,5-디브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 고체로서 수득했다. MS: 451(M+H)⁺.

<811> 실시예 76e

<812> rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 389.33 $C_{21}H_{22}Cl_2N_2O$

<813>

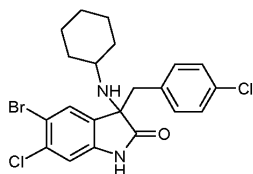
<814> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 389 (M+H)⁺. H^1 -

NMR (400MHz, 아세톤 -d₆) δ 7.30(d, 1H), 7.10 (d, 2H), 7.05(dd, 1H), 6.80(d, 2H), 6.72(d, 1H), 3.00 (dd,2H), 2.20(m, 1H), 1.15(m, 5H), 1.00(m, 5H).

<815>

<816> 실시예 77

<817> rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



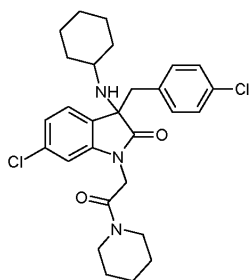
M. W. 468.22 $C_{21}H_{21}BrCl_2N_2O$

<818>

<819> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 469 (M+H)⁺.

<820> 실시예 78

<821> rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



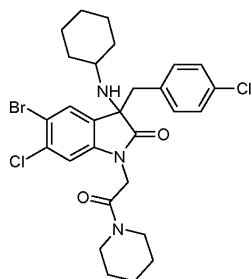
M. W. 514.50

$C_{28}H_{33}Cl_2N_3O_2$

2-클로로-1-피페리딘-1-일-에탄논 (41mg, 31mmol) 및 KI (43 mg, 0.26mmol) 의 디메틸포름아이드 (5mL) 중 혼합 물에, 실시예 76c 에서 제조한 rac-3-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100mg, 0.26 mmol) 를 첨가했다. 실온에서 2 시간 동안 교반한 후, 물 (10 mL) 을 첨가하고, 미정제물 (crude) 를 에틸 아세테이트 (3x 20 mL) 로 추출했다. 조합된 유기 용액을 진공하에서 농축시켰다. 잔류물을 제조 용 HPLC 로 정제해 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: 514 (M+H)⁺.

실시예 79

rac-5-브로모-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 593.40

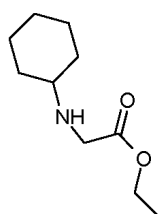
$C_{28}H_{32}BrCl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(4-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1-(2-옥소-2-피페리딘-1-일-에틸)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

MS: 594 (M+H)⁺; ¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 7.42(s, 1H), 7.19(m, 2H), 7.09(s, 1H), 6.84(d, 2H), 4.33(dd, 2H), 3.40 (m, 4H), 3.00(dd, 2H), 2.62(d, 1H), 2.20(m, 1H), 1.57(m, 10H), 0.90 (m, 6H).

실시예 80a

중간체 시클로헥실아미노-아세트산 에틸 에스테르의 제조



M. W. 185.27

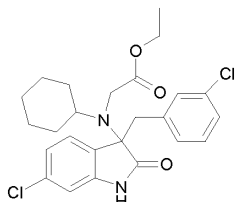
$C_{10}H_{19}NO_2$

시클로헥실아민 (45g, 0.45mol) 의 디클로로메탄 (100mL) 중 용액에, 0℃ 에서 디클로로메탄 (150 mL) 중 브로

모-아세트산 에틸 에스테르(15g, 0.09mol) 을 서서히 첨가했다. 첨가 후, 혼합물을 실온에서 1 시간 동안 교반한 다음 물 (3 x 200 mL) 로 세정했다. 유기 용액을 Na₂SO₄ 로 건조하고 진공하에서 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피 (DCM : MeOH = 30:1) 로 정제해 시클로헥실아미노-아세트산 에틸 에스테르를 오일로서 수득했다. MS: 186(M+H)⁺.

<833> 실시예 80b

<834> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르의 제조



<835> M. W. 475.42 C₂₅H₂₈Cl₂N₂O₃

<836> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-1H-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 476 (M+H)⁺;

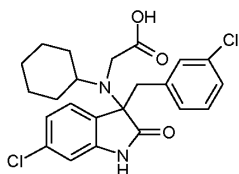
<837> H¹-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.75(s, 1H), 7.50(d, 1H), 7.11(dd, 1H), 7.04(m, 1H),

6.93(t,1H), 1H), 6.78(t,1H), 6.66(d,2H), 4.35(d,1H), 4.18 (q,2H), 3.59(d,1H),

<838> 3.31(d,1H), 3.17(d,1H), 2.66(m,1H), 1.66(m,6H), 1.30 (t,3H), 1.00(m,4H).

<839> 실시예 81

<840> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산의 제조



<841> M. W. 447.37 C₂₃H₂₄Cl₂N₂O₃

<842> 메탄올 (120mL) 및 물 (30mL) 의 혼합물에, rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르 (5 g, 105 mmol) 및 KOH (0.8 g, 210 mmol) 를 첨가했다. 반응 혼합물을 하룻밤 가열 환류한 후, 미정제 물을 농축했다. 이어서, 물 (100 mL) 을 첨가했다. 혼합물을 HCl 을 이용해 PH = 4 로 산성화시키고, 에틸 아세테이트 (100 mL x 3)로 추출했다. 조합된 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조하고, 진공하 농축시켜, 4.7g 의 rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산을 밝은 황색 고체로서 수득했다. MS: 447(M+H)⁺.

<843> 실시예 82

<844> rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

$$\text{C}_{29}\text{H}_{34}\text{Cl}_2\text{N}_4\text{O}_3$$

<846>

<847>

<848>

CC(C)NC(=O)N(C(C)C)C(=O)N(C1CCCCC1)C(=O)c2cc(Cl)ccc2C(=O)c3cc(Cl)ccc3

<849>

$$\text{C}_{30}\text{H}_{38}\text{Cl}_2\text{N}_4\text{O}_3$$

<850>

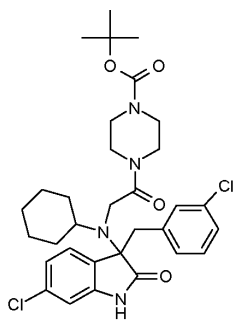
^1H -NMR (400MHz, CDCl_3) δ 7.45(d, 1H), 7.26(s, 2H), 7.00 (dd, 1H), 6.96(t, 1H), 6.83(t, 1H), 6.67(s, 1H), 6.55(d, 1H), 6.47(d, 1H), 4.42 (d, 1H), 4.28(m, 1H), 3.92(m, 1H), 3.59(d, 1H), 3.17(dd, 2H), 2.64(m, 1H), 1.57(m, 6H), 1.35(dd, 6H), 1.15(dd, 6H), 0.90(m, 4H).

<851>

<852>

<853>

- 78 -



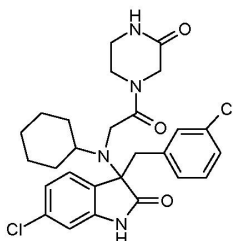
M. W. 615.61

$C_{32}H_{40}Cl_2N_4O_4$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 616 (M+H)⁺.

실시예 85

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-옥소-2-(3-옥소-피페라진-일)-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



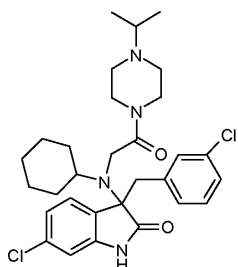
M. W. 529.47

$C_{27}H_{30}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 529 (M+H)⁺.

실시예 86

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-(4-이소프로필-피페라진-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



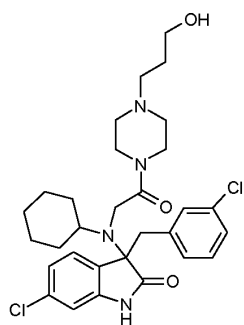
M. W. 557.57

$C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 557 (M+H)⁺.

실시예 87

<865> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-{2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

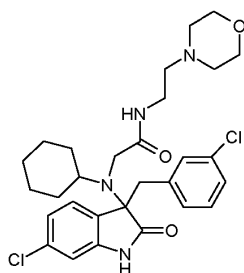


<866> M. W. 573.57 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

<867> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 574 (M+H)⁺.

<868> 실시예 88

<869> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아세트아미드의 제조

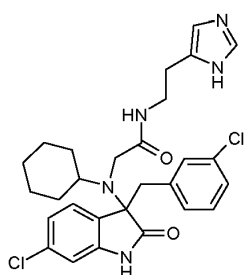


<870> M. W. 559.54 $C_{29}H_{36}Cl_2N_4O_3$

<871> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 559 (M+H)⁺.

<872> 실시예 89

<873> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드의 제조



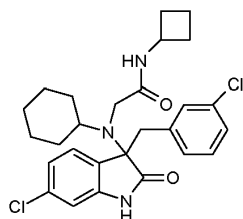
<874> M. W. 540.50 $C_{28}H_{31}Cl_2N_5O_2$

<875> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 540 (M+H)⁺.

<876> 실시예 90

<877> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



<878> M. W. 500.47 C₂₇H₃₁Cl₂N₃O₂

<879> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 500 (M+H)⁺.

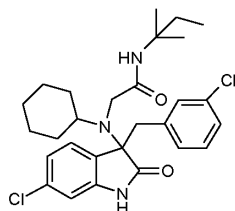
<880> H¹-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ 10.36(s,

1H), 8.12(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.12(m, 3H), 6.70 (s,1H), 6.66(d,1H), 6.50(s,1H), 4.32(m,1H), 3.91(d,1H), 3.48(d,1H), 3.21(dd,2H), 2.47(m,1H), 2.12(m,4H), 1.38(m,12H).

<881>

<882> 실시예 91

<883> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(1,1-디메틸-프로필)-아세트아미드의 제조

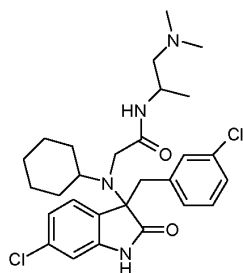


<884> M. W. 516.52 C₂₈H₃₅Cl₂N₃O₂

<885> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 516 (M+H)⁺.

<886> 실시예 92

<887> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-디메틸아미노-1-메틸-에틸)-아세트아미드의 제조



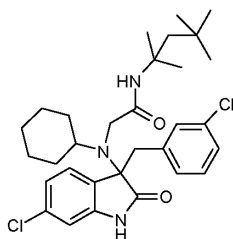
M. W. 531.53

$C_{28}H_{36}Cl_2N_4O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 531 (M+H)⁺.

실시예 93

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(1,1,3,3-테트라메틸-부틸)-아세트아미드의 제조



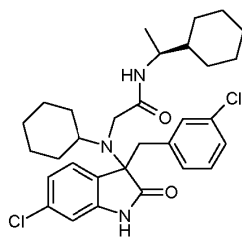
M. W. 558.60

$C_{31}H_{41}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 558 (M+H)⁺.

실시예 94

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-[(1S)-시클로헥실-에틸]-아세트아미드의 제조



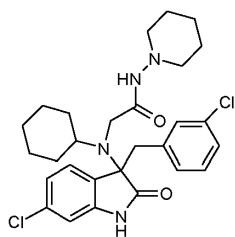
M. W. 556.58

$C_{31}H_{39}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 556 (M+H)⁺.

실시예 95

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-피페리딘-1-일-아세트아미드의 제조



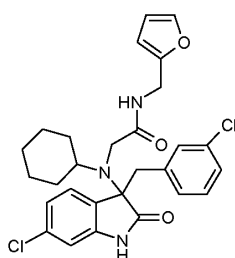
M. W. 529.51

$C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 529 (M+H)⁺.

실시예 96

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-푸란-2-일메틸-아세트아미드의 제조



M. W. 526.47

$C_{28}H_{29}Cl_2N_3O_3$

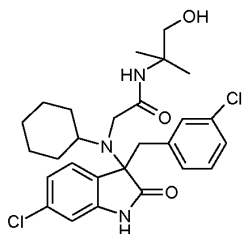
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 526 (M+H)⁺.

¹H-NMR (400MHz, DMSO-d₆) δ10.30 (s,

1H), 8.40(t, 1H), 7.80(d, 1H), 7.52(q, 1H), 7.13 (m,2H), 7.03(t,1H), 6.67(t,1H), 6.58(d,1H), 6.52(d,1H), 6.38(m,2H), 4.44 (m,2H), 4.13(d,1H), 3.50(d,1H), 3.17(dd,2H), 2.42(m,1H), 1.12(m,10H).

실시예 97

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-(2-히드록시-1,1-디메틸-에틸)-아세트아미드의 제조



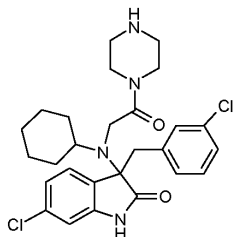
M. W. 518.49

$C_{27}H_{33}Cl_2N_3O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 518 (M+H)⁺.

<912> 실시예 98

<913> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<914> M. W. 515.49

$C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_2$

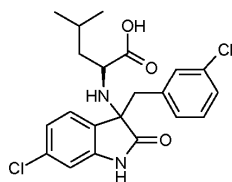
<915> 트리플루오로아세트산 (1 mL) 에, rac-4-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로!-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-아세틸)-피페라진-1-카르복실산-부틸 에스테르(100 mg, 0.163 mmol) 를 첨가했다. 혼합물을 실온에서 1 시간 동안 교반한 후, 미정제물을 진공하에서 농축시켜 68 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 고체로서 수득했다.

MS: 515(M+H)⁺; ¹H-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 9.86(s, 1H), 8.82(s, 1H), 7.52(d, 1H), 7.09(d,1H), 6.96(d,1H), 6.87(t,1H), 6.75(s,1H), 6.62(s,1H), 6.51(d,1H), 3.99(m,6H), 3.30(m,6H), 2.82(m,1H), 1.22(m,10H).

<916>

<917> 실시예 99

<918> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산의 제조



<919> M. W. 421.33

$C_{21}H_{22}Cl_2N_2O_3$

<920> 수용액 K₂CO₃ (1.6 μL, 1N) 에, (2S)-아미노-4-메틸-펜탄산 (106 mg, 0.81 mmol), 에 이어 디옥산 (5mL) 중 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (200mg, 0.54mmol) 을 첨가했다. 혼합물을 실온에서 4 시간 동안 교반한 후, 반응 혼합물을 진공 하 농축했다. 물 (10mL) 을 첨가하고, 미정제물을 HCl 로 pH =4 로 산성화하였다. 혼합물을 에틸 아세테이트 (3 x 10mL) 로 추출했다. 조합된 유기층을 진공하 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피 (DCM : MeOH = 80:1) 로 정제해, 184 mg 의 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산을 백색 고체로서 수득했다.

MS: 421(M+H)⁺.

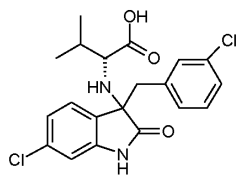
¹H-NMR (400MHz,

CDCl₃) δ 10.04 (s, 1H), 7.12(m, 5H), 6.93(t, 1H), 6.76(m, 2H), 3.32(m,1H), 3.16(dd,2H), 1.89 (m,1H), 1.50(m,2H), 0.90(dd,6H).

<921>

<922> 실시예 100

<923> rac-(2R)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-부티르산의 제조



M. W. 407.30

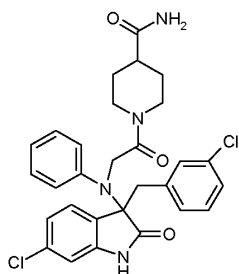
C₂₀H₂₀Cl₂N₂O₃

<924>

<925> 표제 화합물을 rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 407 (M+H)⁺.

<926> 실시예 101

<927> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



M. W. 551.48

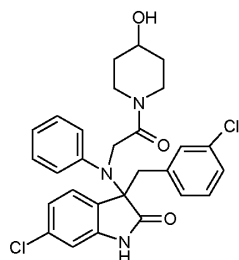
C₂₉H₂₈Cl₂N₄O₃

<928>

<929> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 551 (M+H)⁺.

<930> 실시예 102

<931> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{[2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 524.45

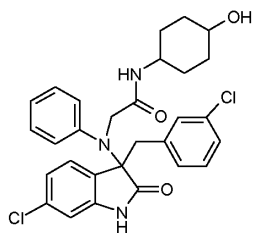
C₂₈H₂₇Cl₂N₃O₃

<932>

<933> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 524 (M+H)⁺.

<934> 실시예 103

<935> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-(4-히드록시-시클로헥실)-아세트아미드의 제조



M. W. 538.48

$C_{29}H_{29}Cl_2N_3O_3$

<936>

<937>

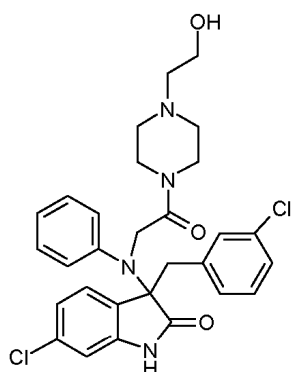
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 538 (M+H)⁺.

<938>

실시예 104

<939>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-옥소-에틸}-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 553.49 $C_{29}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<940>

<941>

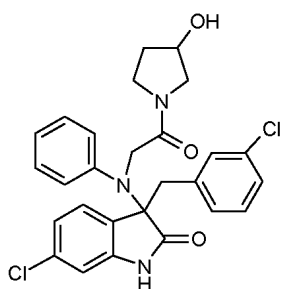
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 553 (M+H)⁺.

<942>

실시예 105

<943>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-([2-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 510.42

$C_{27}H_{25}Cl_2N_3O_3$

<944>

<945>

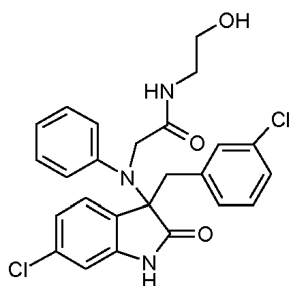
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 510 (M+H)⁺.

<946>

실시예 106

<947>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-(2-히드록시-에틸)-아세트아미드의 제조



M. W. 484.39 $C_{25}H_{23}Cl_2N_3O_3$

<948>

<949>

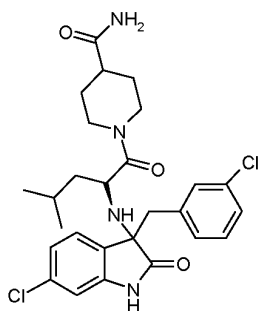
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 484 (M+H)⁺.

<950>

실시예 107

<951>

rac-{(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜타노일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



M. W. 531.49 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<952>

<953>

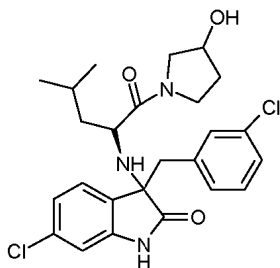
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 531 (M+H)⁺.

<954>

실시예 108

<955>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(3-히드록시-피롤리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 490.43 $C_{25}H_{29}Cl_2N_3O_3$

<956>

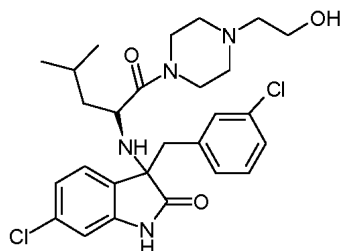
<957>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 490 (M+H)⁺.

<958> 실시예 109

<959> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((1S)-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-카르보닐]-3-메틸-부틸아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<960>

M. W. 533.50 C₂₇H₃₄Cl₂N₄O₃

<961>

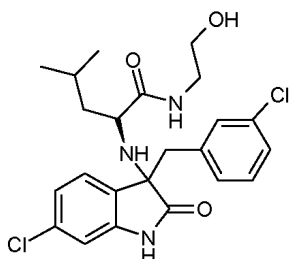
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 532 (M+H)⁺.

<962>

실시예 110

<963>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 (2-히드록시-에틸)-아미드의 제조



<964>

M. W. 464.40 C₂₃H₂₇Cl₂N₃O₃

<965>

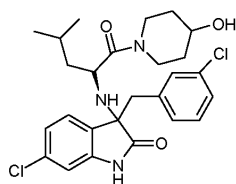
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 464 (M+H)⁺.

<966>

실시예 111

<967>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(1S)-(4-히드록시-피페리딘-1-카르보닐)-3-메틸-부틸아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<968>

M. W. 504.46 C₂₆H₃₁Cl₂N₃O₃

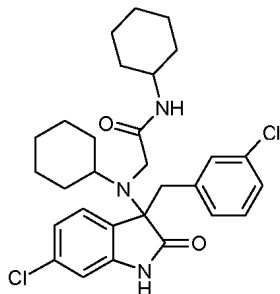
<969>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 504 (M+H)⁺.

<970> 실시예 112

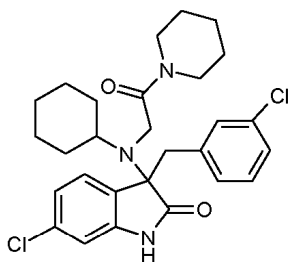
<971> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조

M. W. 528.53 $\text{C}_{29}\text{H}_{35}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_2$

<973> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 528 (M+H)⁺.

<974> 실시예 113

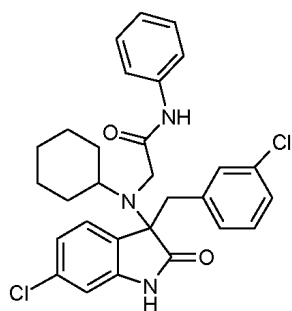
<975> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-페닐-아세트아미드의 제조

M. W. 514.50 $\text{C}_{28}\text{H}_{33}\text{Cl}_2\text{N}_3\text{O}_2$

<977> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

<978> 실시예 114

<979> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-페닐-아세트아미드의 제조



M. W. 522.48 $C_{29}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<980>

<981>

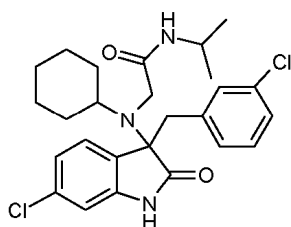
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 522 (M+H)⁺.

<982>

실시예 115

<983>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-페닐-아세트아미드의 제조



M. W. 488.46 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<984>

<985>

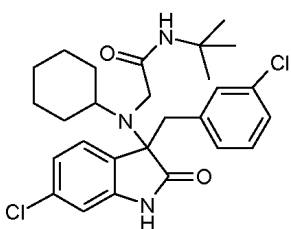
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488 (M+H)⁺.

<986>

실시예 116

<987>

rac-N-tert-부틸-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트아미드의 제조



M. W. 502.49 $C_{27}H_{33}Cl_2N_3O_2$

<988>

<989>

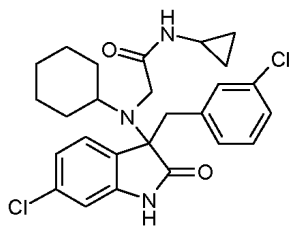
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 502 (M+H)⁺.

<990>

실시예 117

<991>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드의 제조

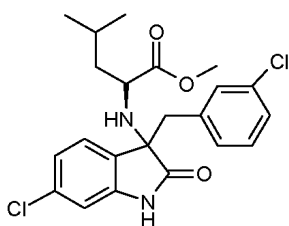


M. W. 486.45 $C_{26}H_{29}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 486 (M+H)⁺.

실시예 118

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 메틸 에스테르의 제조

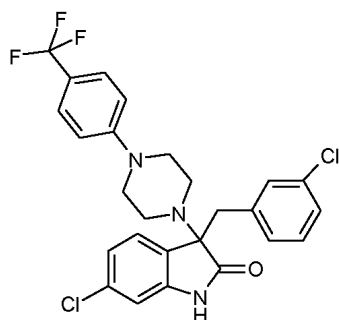


M. W. 435.35 $C_{22}H_{24}Cl_2N_2O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 435(M+H)⁺

실시예 119

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐) 피페라진-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 520.39 $C_{26}H_{22}Cl_2F_3N_3O$

rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100mg, 0.270mmol), 1-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진 (75mg, 0.324mmol) 및 DIPEA (42 mg, 0.324 mmol) 의 아세트니트릴 (3 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 미정제물을 농축하고 잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해 76mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다.

MS: 520 (M+H)⁺. H¹-NMR (400MHz, CDCl₃) δ 7.584(s, 1H), 7.493(d, 2H),

7.240(d, 1H), 7.081(t, 2H), 7.011(t, 1H), 6.908(d, 3H), 6.766(d, 1H), 6.684(d, 1H), 3.431(d, 1H), 3.329-3.206(m, 5H), 2.947(t, 4H).

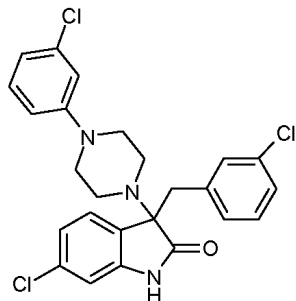
<1003>

<1004>

실시예 120

<1005>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(3-클로로-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1006>

M. W. 486.83 $C_{25}H_{22}Cl_3N_3O$

<1007>

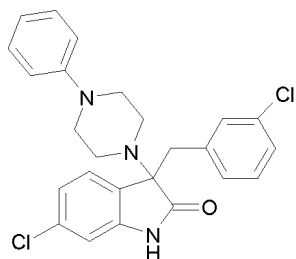
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 486 (M+H)⁺.

<1008>

실시예 121

<1009>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-페닐-피페라진-1-일)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1010>

M. W. 452.39 $C_{25}H_{23}Cl_2N_3O$

<1011>

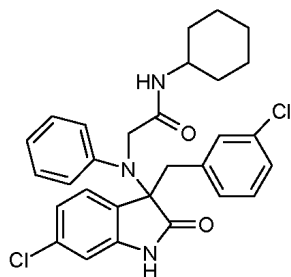
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 452 (M+H)⁺.

<1012>

실시예 122

<1013>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드의 제조



<1014>

M. W. 522.48 $C_{29}H_{29}Cl_2N_3O_2$

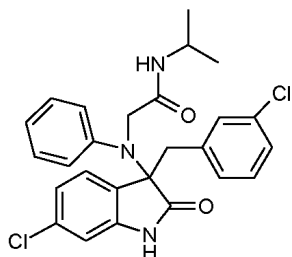
<1015>

rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트산 (70 mg, 0.159 mmol), 시클로헥실아민 (19 mg, 0.191 mmol) EDC.HCl (36 mg, 0.191 mmol), HOBt (26 mg, 0.191 mmol) 및

DIPEA (25 mg, 0.191 mmol) 의 아세트니트릴 (3 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 반응 혼합물을 농축하고 잔류물을 크로마토그래피로 정제해, 45 mg 의 rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로헥시-아세트아미드를 황색 고체로서 수득했다. MS m/z 522 (M+H)⁺.

<1016> 실시예 123

<1017> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-이소프로필-아세트아미드의 제조

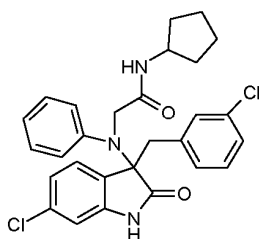


<1018> M. W. 482.41 C₂₆H₂₅Cl₂N₃O₂

<1019> 표제 화합물을 rac-2-([6-클로로-3-(3- 클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 482 (M+H)⁺.

<1020> 실시예 124

<1021> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로펜틸-아세트아미드의 제조

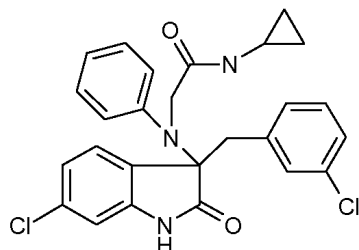


<1022> M. W. 508.45 C₂₈H₂₇Cl₂N₃O₂

<1023> 표제 화합물을 rac-2-([6-클로로-3-(3- 클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 508 (M+H)⁺.

<1024> 실시예 125

<1025> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로프로필-아세트아미드의 제조



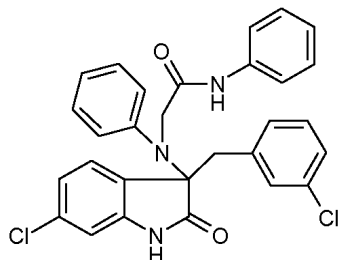
<1026> M. W. 480.40 C₂₆H₂₃Cl₂N₃O₂

<1027> 표제 화합물을 rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로

헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 480 (M+H)⁺.

<1028> 실시예 126

<1029> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-페닐-아세트아미드의 제조



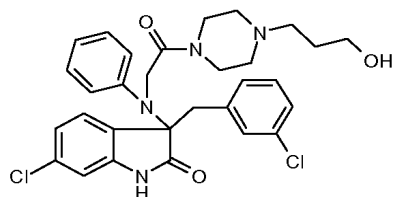
<1030>

M. W. 516.43 C₂₉H₂₃Cl₂N₃O₂

<1031> 표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 516 (M+H)⁺.

<1032> 실시예 127

<1033> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-페닐-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



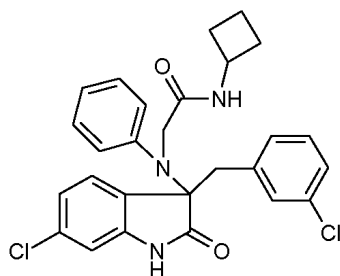
<1034>

M. W. 567.52 C₃₀H₃₂Cl₂N₄O₃

<1035> 표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 567 (M+H)⁺.

<1036> 실시예 128

<1037> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



<1038>

M. W. 494.43 C₂₇H₂₅Cl₂N₃O₂

<1039> 표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로

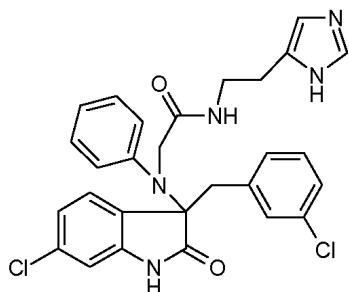
헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 494 (M+H)⁺.

<1040>

실시예 129

<1041>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-[2-(3H-이미다졸-4-일)-에틸]-아세트아미드의 제조



M. W. 534.45 C₂₈H₂₅Cl₂N₅O₂

<1042>

<1043>

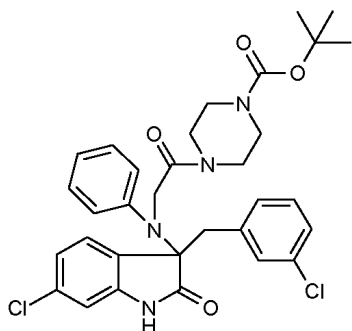
표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 535 (M+H)⁺.

<1044>

실시예 130

<1045>

rac-4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인도-3-일]-페닐-아미노}-아세틸)-피페라진-1-카복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W. 609.56 C₃₂H₃₄Cl₂N₄O₄

<1046>

<1047>

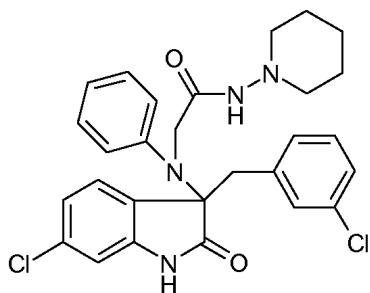
표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 609 (M+H)⁺.

<1048>

실시예 131

<1049>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-피페리딘-1-일-아세트아미드의 제조



M. W. 523.47 $C_{28}H_{28}Cl_2N_4O_2$

<1050>

<1051>

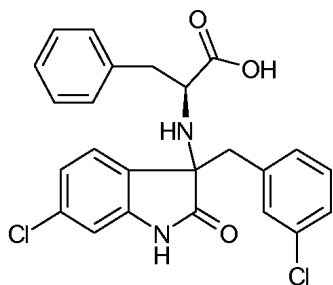
표제 화합물을 rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 523 (M+H)⁺.

<1052>

실시예 132

<1053>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-페닐-프로피온산의 제조



M. W. 455.34 $C_{24}H_{20}Cl_2N_2O_3$

<1054>

<1055>

0℃ 에서 NaOH (1N, 10 mL) 의 수용액에, L-2-아미노-3-페닐-프로피온산 (1.47g, 8.92 mmol) 에 이어, 3,6-디클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (3g, 8.1mmol) 의 1,4-디옥산 (3 mL) 중 용액을 첨가했다. 반응 혼합물을 0℃ 에서 4 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축시키고, 디에틸 에테르로 추출했다. 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조, 여과 및 농축시켰다.

<1056>

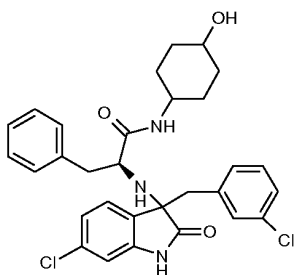
잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해, rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-페닐-프로피온산을 수득했다. MS m/z 455(M+H)⁺.

<1057>

실시예 133

<1058>

rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(4-히드록시-시클로헥실)-3-페닐-프로피온아미드의 제조



M. W. 552.51 $C_{30}H_{31}Cl_2N_3O_3$

<1059>

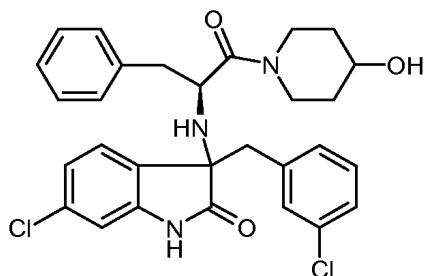
<1060>

표제 화합물을 rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노)-N-시클로

로핵시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 552 (M+H)⁺.

<1061> 실시예 134

<1062> rac-3-[(1S)-벤질-2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



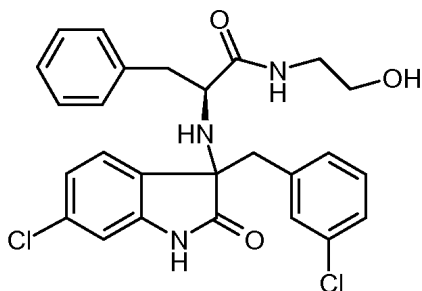
M. W. 538.48 C₂₉H₂₉Cl₂N₃O₃

<1063>

<1064> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로핵시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 538 (M+H)⁺.

<1065> 실시예 135

<1066> rac-(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-히드록시-에틸)-3-페닐-프로피온아미드의 제조



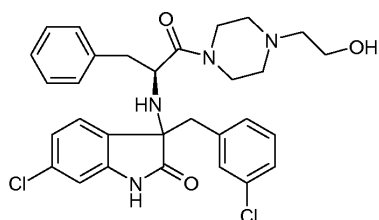
M. W. 498.41 C₂₆H₂₅Cl₂N₃O₃

<1067>

<1068> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로핵시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 498 (M+H)⁺.

<1069> 실시예 136

<1070> rac-3-[(1S)-벤질-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



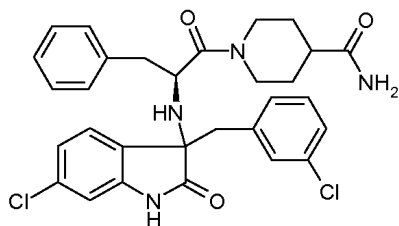
M. W. 567.52 C₃₀H₃₂Cl₂N₄O₃

<1071>

<1072> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-N-시클로핵시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 567 (M+H)⁺.

<1073> 실시예 137

<1074> rac-1-[(2S)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-페닐-프로피오닐]-피페리딘-4-카르복실산 아마이드의 제조

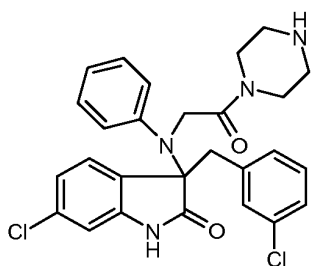


<1075> M. W. 565.50 $C_{30}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<1076> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노]-N-시클로헥시-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 565 (M+H)⁺.

<1077> 실시예 138

<1078> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



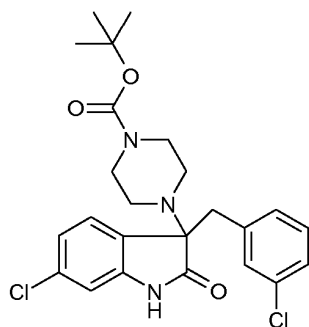
<1079> M. W. 509.44 $C_{27}H_{26}Cl_2N_4O_2$

<1080> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노]-아세트산 (70 mg, 0.159 mmol), 피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (36 mg, 0.191 mmol), EDC.HCl (36 mg, 0.191 mmol), HOBt (26 mg, 0.191 mmol) 및 DIPEA (42 mg, 0.191 mmol) 의 아세토니트릴 (3 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 반응 혼합물을 농축하고 디클로로메탄으로 추출했다. 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조, 여과 및 농축했다.

<1081> 잔류물을 트리플루오로아세트산 (5 mL) 중에 용해시키고, 실온에서 0.5 시간 동안 교반했다. 그 다음, 용액을 농축하고 잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해 5.8 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 황색 고체로서 수득했다. MS m/z 509 (M+H)⁺.

<1082> 실시예 139

<1083> rac-4-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W. 476.41 $C_{24}H_{27}Cl_2N_3O_3$

<1084>

<1085>

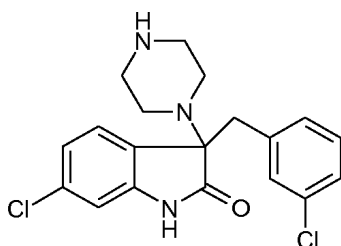
rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (1 g, 2.703 mmol), 피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (0.604 g, 3.24 mmol) 및 DIPEA (0.419 g, 3.24 mmol) 의 아세토니트릴 (20 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 반응 혼합물을 농축하고 디클로로메탄으로 추출했다. 유기층을 Na_2SO_4 로 건조, 여과 및 농축시켜 1.1 g 의 rac-4-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 수득했다. MS m/z 476 (M+H)⁺.

<1086>

실시예 140

<1087>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-피페라진-1-일-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 376.29 $C_{19}H_{19}Cl_2N_3O$

<1088>

<1089>

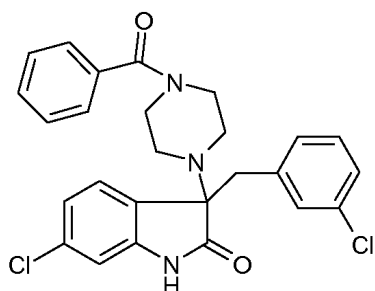
rac-4-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페라진-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (900 mg, 1.89 mmol) 의 트리플루오로아세트산 (10 mL) 중 혼합물을 실온에서 0.5 시간 동안 교반했다. 그 다음, 용액을 농축하고 디클로로메탄으로 추출했다. 유기층을 Na_2SO_4 로 건조, 여과 및 농축시켜 0.6 g 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-피페라진-1-일-1,3-디히드로-인돌-2-온을 황색 고체로서 수득했다. MS m/z 376 (M+H)⁺.

<1090>

실시예 141

<1091>

rac-3-(4-벤조일-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 480.40 $C_{26}H_{23}Cl_2N_3O_2$

<1092>

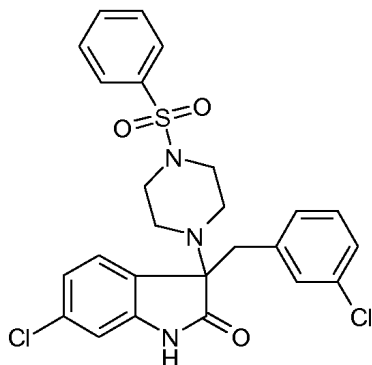
<1093>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-피페라진-1-일-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100 mg, 0.266 mmol), 벤조일 클로라이드 (37 mg, 0.266 mmol) 및 DIPEA (34 mg, 0.266 mmol) 의 아세토니트릴 (3 mL) 중 혼합물을 실온에서 하

룻밤 교반했다. 그 다음 혼합물을 농축하고 잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해, 29 mg 의 rac-3-(4-벤조일-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 얻은 오렌지색 고체로서 수득했다. MS m/z 480 (M+H)⁺.

<1094> 실시예 142

<1095> rac-3-(4-벤젠술폰닐-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



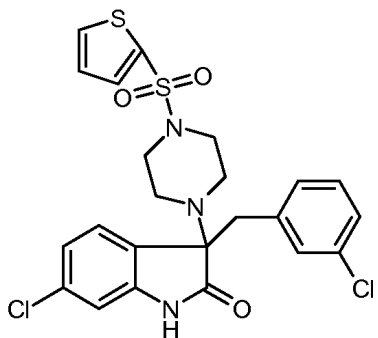
M. W. 516.45 C₂₅H₂₃Cl₂N₃O₃S

<1096>

<1097> 표제 화합물을 rac-3-(4-벤조일-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질량분포와 동일한 질량분포에 따라 제조했다. MS m/z 516 (M+H)⁺.

<1098> 실시예 143

<1099> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(티오펜-2-술폰닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



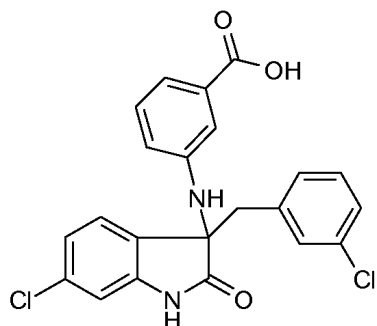
M. W. 522.48 C₂₃H₂₁Cl₂N₃O₃S₂

<1100>

<1101> 표제 화합물을 rac-3-(4-벤조일-피페라진-1-일)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질량분포와 동일한 질량분포에 따라 제조했다. MS m/z 522 (M+H)⁺.

<1102> 실시예 144

<1103> rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산의 제조.



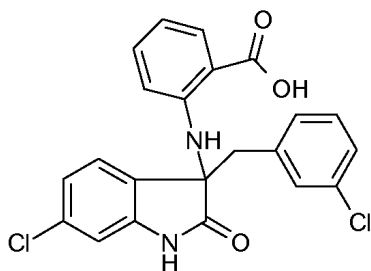
M. W. 427.29 $C_{22}H_{16}Cl_2N_2O_3$

<1104>

<1105> rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1, 3-디히드로-인돌-2-온 (740 mg, 2 mmol), 3-아미노-벤조산 (301 mg, 2.2 mmol) 및 K_2CO_3 (552 mg, 4 mmol) 의 DMF (5mL) 중 혼합물을 0.5 시간 동안 교반한 다음 물 (100 mL) 에 부었다. 생성 용액을 아세트산으로 산성화시키고 여과했다. 필터 케이크를 물로 세정하고 건조시켜 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산을 담황색 고체로서 수득했다. MS m/z 425 (M-H)⁻.

<1106> 실시예 145

<1107> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산의 제조



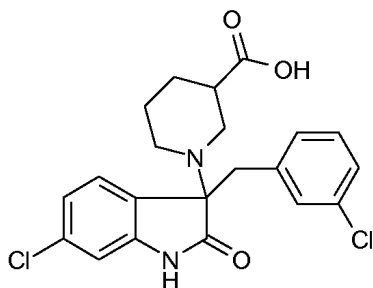
M. W. 427.29 $C_{22}H_{16}Cl_2N_2O_3$

<1108>

<1109> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 425 (M-H)⁻.

<1110> 실시예 146

<1111> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산의 제조



M. W. 419.31 $C_{21}H_{20}Cl_2N_2O_3$

<1112>

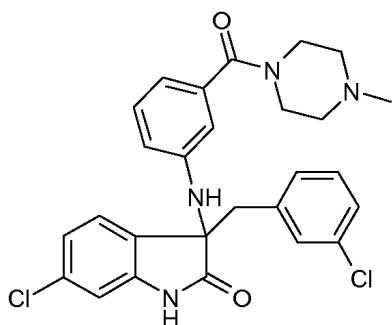
<1113> 피페리딘-3-카르복실산 (600 mg, 4.5 mmol) 및 NaOH (360 mg, 9 mmol) 의 물 (5mL) 및 디옥산 (5mL) 중 혼합물에, rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1, 3-디히드로-인돌-2-온 (1.1g, 3 mmol) 을 첨가했다. 혼

합물을 실온에서 1 시간 동안 교반한 다음 물 (30 mL) 로 희석했다. 생성 용액을 염산을 이용해 pH = 7 로 중화시키고, 디클로로메탄으로 추출했다. 유기상을 Na₂SO₄ 로 건조, 여과 및 농축시켜, rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산을 수득했다.

수율: (0.9 g, 71%). MS: [M-H]⁻ = 417.

실시예 147

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 509.44 C₂₇H₂₆Cl₂N₄O₂

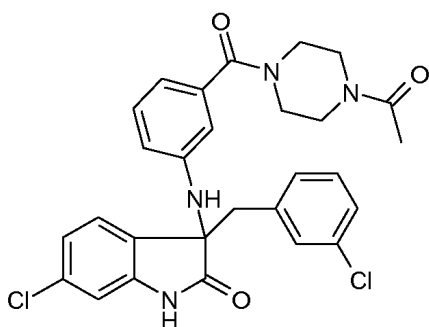
rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산 (60 mg, 0.14 mmol), 1-메틸-피페라진 (56 mg, 0.56 mmol) 및 EDCI (54 mg, 0.28 mmol) 의 디클로로메탄 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 반응 혼합물을 제조용 HPLC 로 정제해, rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 분말로서 수득했다.

¹H NMR (CDCl₃, 400MHz): δ7.21-6.74 (m, 9H), 6.49 (d, 1H), 6.17 (s, 1H), 4.70 (s,

1H), 3.80-3.45 (br, 8H), 3.28-3.15 (q, 2H), 2.66 (s, 3H). MS: [M+H]⁺ = 509

실시예 148

rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.

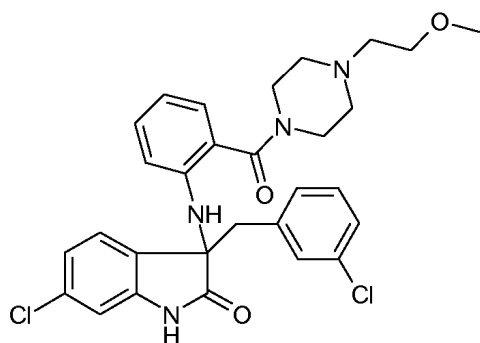


M. W. 537.45 C₂₈H₂₆Cl₂N₄O₃

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 537

실시예 149

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 553.49 $C_{29}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<1127>

<1128>

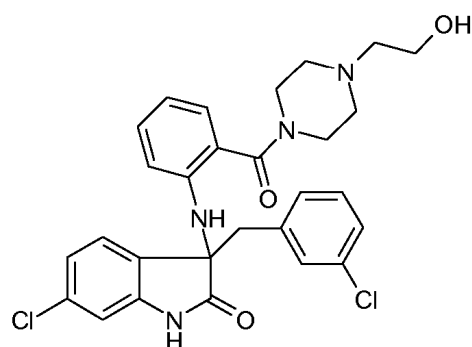
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 553$

<1129>

실시예 150

<1130>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 539.47 $C_{28}H_{28}Cl_2N_4O_3$

<1131>

<1132>

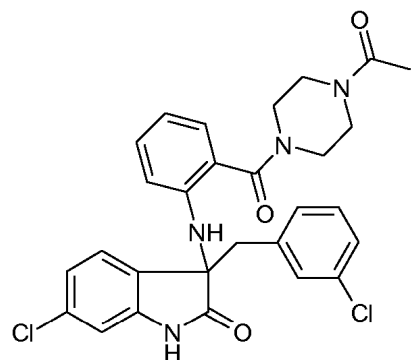
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 539$

<1133>

실시예 151

<1134>

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



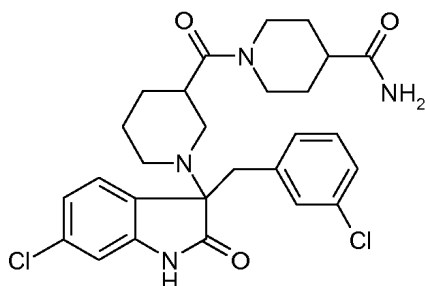
M. W. 537.45 $C_{28}H_{26}Cl_2N_4O_3$

<1135>

<1136> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 537$

<1137> 실시예 152

<1138> rac-1-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



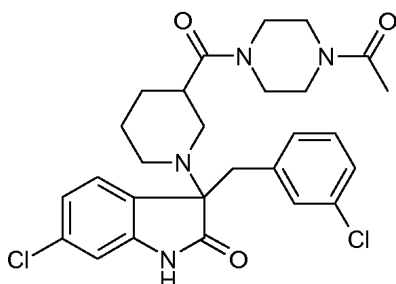
M. W. 528.48 $C_{28}H_{31}Cl_2N_3O_3$

<1139>

<1140> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 529$

<1141> 실시예 153

<1142> rac-3-[3-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



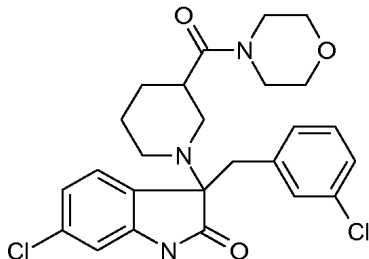
M. W. 529.47 $C_{27}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<1143>

<1144> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 529$

<1145> 실시예 154

<1146> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 488.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_3$

<1147>

<1148> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-

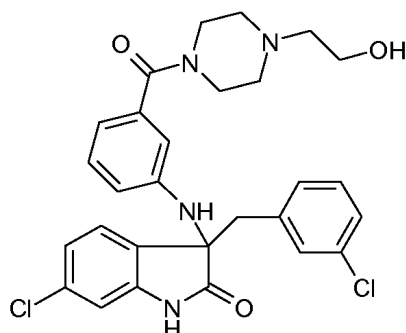
1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 488$

<1149>

실시예 155

<1150>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1151>

M. W. 539.47 $C_{28}H_{28}Cl_2N_4O_3$

<1152>

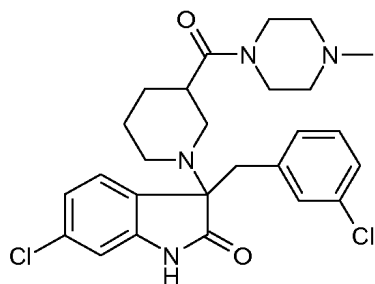
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 539$

<1153>

실시예 156

<1154>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.



<1155>

M. W. 501.46 $C_{26}H_{30}Cl_2N_4O_2$

<1156>

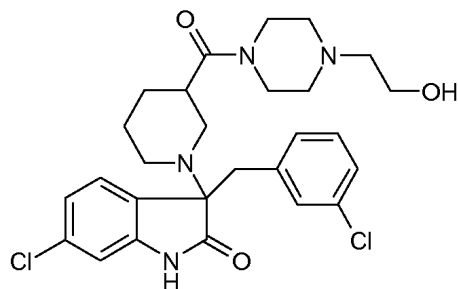
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 501$

<1157>

실시예 157

<1158>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



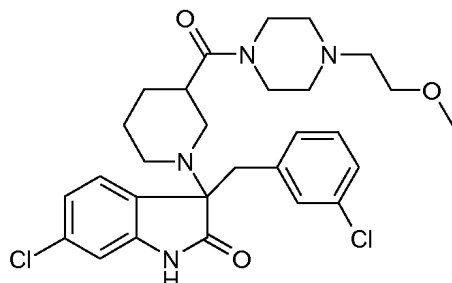
<1159>

M. W. 531.49 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<1160> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 531$

<1161> 실시예 158

<1162> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



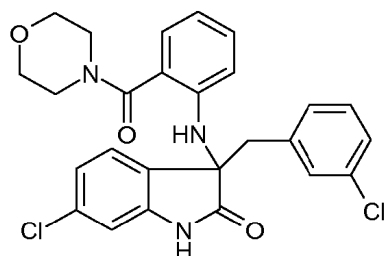
M. W. 545.51 $C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<1163>

<1164> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 545$.

<1165> 실시예 159

<1166> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.



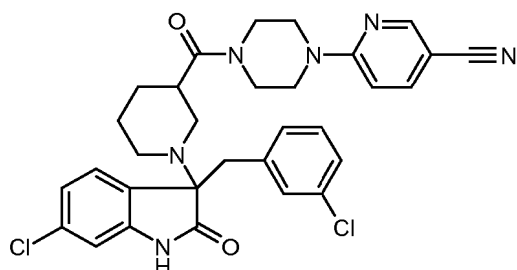
M. W. 496.40 $C_{26}H_{23}Cl_2N_3O_3$

<1167>

<1168> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 496$.

<1169> 실시예 160

<1170> rac-6-(4-{1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-피페라진-1-일)-니코티노니트릴의 제조.



M. W. 589.53 $C_{31}H_{30}Cl_2N_6O_2$

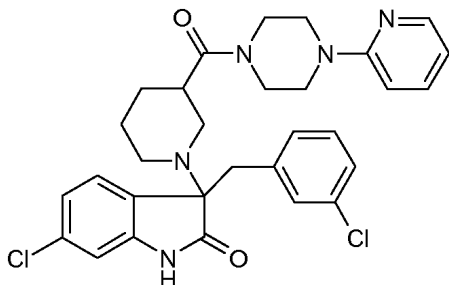
<1171>

<1172> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-

1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 589$.

<1173> 실시예 161

<1174> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.

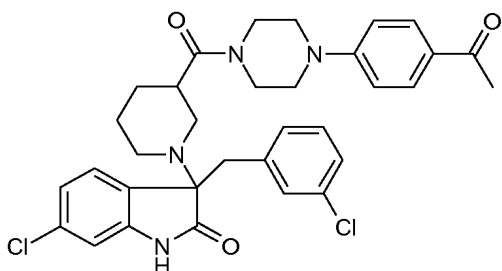


<1175> M. W. 564.52 $C_{30}H_{31}Cl_2N_5O_2$

<1176> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 564$

<1177> 실시예 162

<1178> rac-3-{3-[4-(4-아세틸-페닐)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.

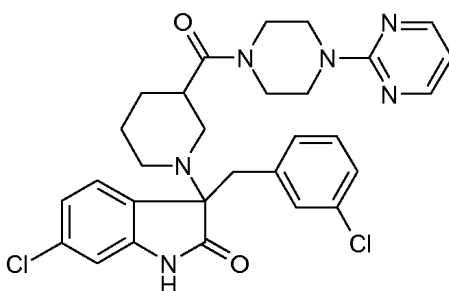


<1179> M. W. 605.57 $C_{33}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<1180> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 605$.

<1181> 실시예 163

<1182> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(4-피리미딘-2-일-피페라진-1-카르보닐)-피페리딘-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



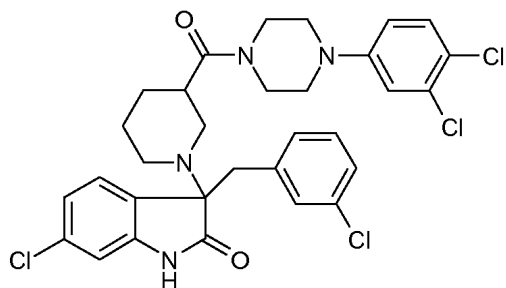
<1183> M. W. 565.51 $C_{29}H_{30}Cl_2N_6O_2$

<1184> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-

1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 565$.

<1185> 실시예 164

<1186> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(3,4-디클로로-페닐)-피페라진-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



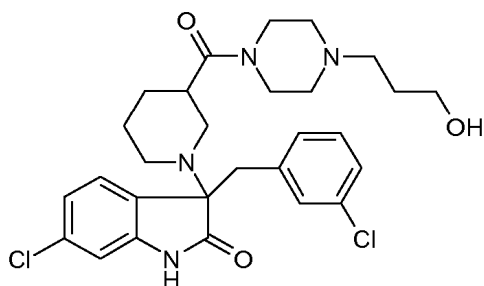
M. W. 632.42 $C_{31}H_{30}Cl_4N_4O_2$

<1187>

<1188> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 631$.

<1189> 실시예 165

<1190> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(3-히드록시-프로필)-피페라진-1-카르보닐]-피페리딘-1-일}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.



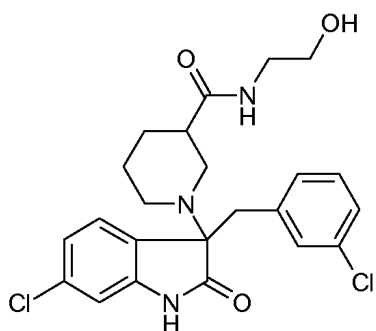
M. W. 545.51 $C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<1191>

<1192> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 545$.

<1193> 실시예 166

<1194> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-히드록시-에틸)-아미드의 제조.



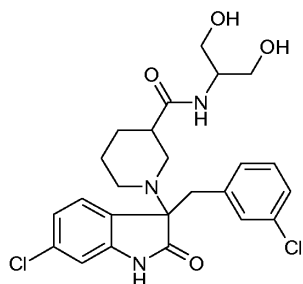
M. W. 462.38 $C_{23}H_{25}Cl_2N_3O_3$

<1195>

<1196> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 462$.

<1197> 실시예 167

<1198> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-히드록시-1-히드록시메틸-에틸)-아미드의 제조

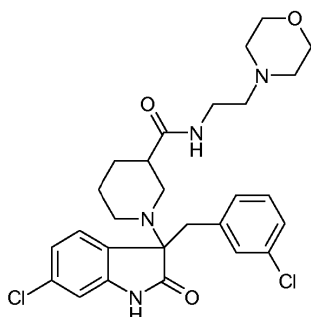


<1199> M. W. 492.41 $C_{24}H_{27}Cl_2N_3O_4$

<1200> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 492$.

<1201> 실시예 168

<1202> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드의 제조

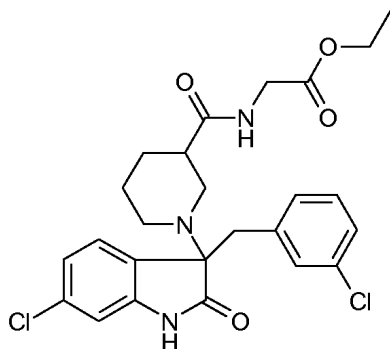


<1203> M. W. 531.49 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<1204> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 531$.

<1205> 실시예 169

<1206> rac-({1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르보닐}-아미노)-아세트산 에틸 에스테르의 제조.

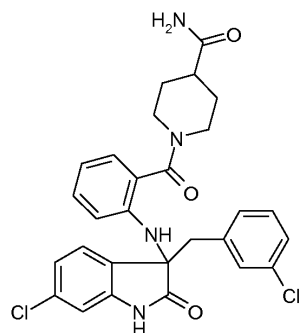


M. W. 504.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_4$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 504$.

실시예 170

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조

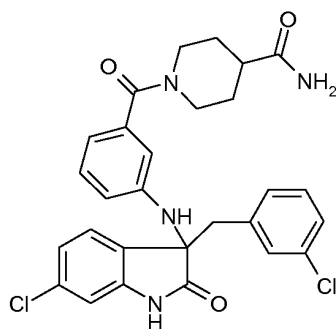


M. W. 537.45 $C_{28}H_{26}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 537$.

실시예 171

rac-1-{3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조.

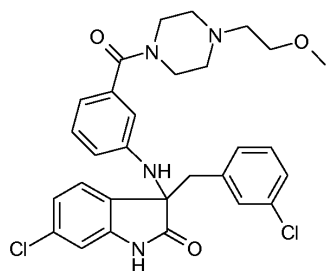


M. W. 537.45 $C_{28}H_{26}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 537$.

<1217> 실시예 172

<1218> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조.



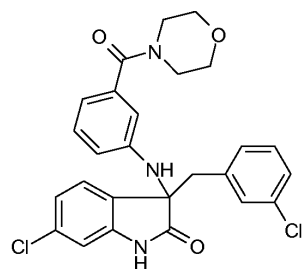
M. W. 553.49 $C_{29}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<1219>

<1220> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 553$.

<1221> 실시예 173

<1222> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



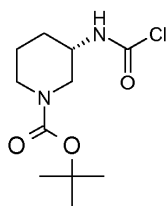
M. W. 496.40 $C_{26}H_{23}Cl_2N_3O_3$

<1223>

<1224> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 496$.

<1225> 실시예 174a

<1226> 중간체 (3S)-(클로로-카르보닐-아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



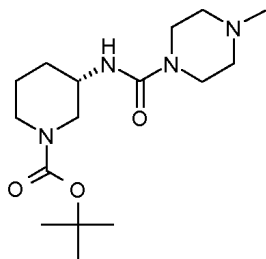
M. W. 262.74 $C_{11}H_{19}ClN_2O_3$

<1227>

<1228> -10 °C 에서 트리포스겐 (3 g, 10 mmol) 의 디클로로메탄 (150 mL) 중 용액에, 피리딘 (1.6 mL, 20 mmol) 에 이어, (S)-3-아미노-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (4g, 20 mmol) 의 디클로로메탄 (5mL) 중 용액을 첨가했다. 혼합물을 실온까지 가온되게 하고 실온에서 4 시간 교반했다. 그 다음 혼합물을 -10°C 까지 다시 냉각시키고, HCl (1N, 20 mL) 을 첨가했다. 혼합물을 -10°C 에서 0.5 시간 동안 교반한 후, 혼합물을 분배 (partition) 했다. 유기층을 포화 $NaHCO_3$ 로 세정, Na_2SO_4 로 건조, 진공 하 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 2 g 의 (3S)-(클로로-카르보닐-아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 갈색 오일로서 수득했다.

<1229> 실시예 174b

<1230> 중간체 (3S)-[(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-아미노]-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



<1231>

M. W. 326.44 C₁₆H₃₀N₄O₃

<1232>

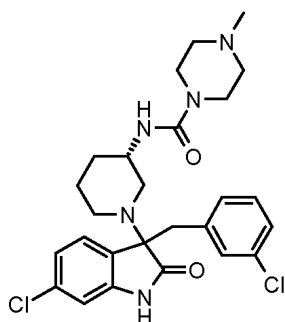
(3S)-(클로로-카르보닐-아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (300 mg, 1.14 mmol), 1-메틸-피페라진 (100 mg, 1 mmol) 및 Na₂CO₃ (1g, 9.4 mmol) 의 디클로로메탄 (5mL)) 중 혼합물을 실온에서 4 시간 동안 교반했다. 그 다음 혼합물을 디클로로메탄 (10 mL) 로 희석, 물로 세정, Na₂SO₄ 로 건조 및 농축시켜, 300 mg 의 (3S)-[(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-아미노]-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 황색 오일로 수득했다.

<1233>

실시예 174c

<1234>

rac-(4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드)의 제조.



<1235>

M. W. 516.48 C₂₆H₃₁Cl₂N₅O₂

<1236>

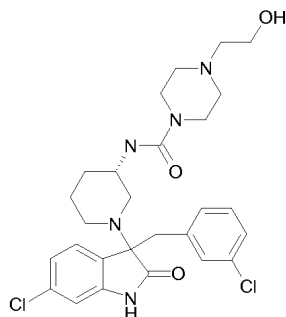
(3S)-[(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-아미노]-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (50 mg, 0.15 mmol) 를 TFA (2mL) 중에 용해시키고, 0.5 시간 동안 교반했다. 혼합물을 진공 하 농축시키고, 잔류물을 디옥산 (2mL) 및 DMF (0.5mL) 중에 용해시켰다. 상기 용액에, rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (40 mg, 0.11 mmol) 및 DIPEA (220 mg, 1.7 mmol) 를 첨가했다. 생성 혼합물을 1 시간 동안 교반하고, 진공하에서 농축했다. 잔류물을 제조용 HPLC 로 정제해, 29 mg 의 rac-(4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드)를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 516

<1237>

실시예 175

<1238>

rac-4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드)의 제조



<1239>

<1240>

<1241>

<1242>

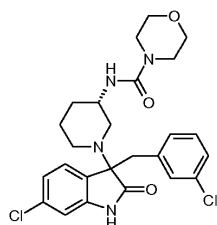
<1243>

M. W. 546.50 $C_{27}H_{33}Cl_2N_5O_3$

표제 화합물을 rac-4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 546$

실시예 176

rac-모르폴린-4-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드의 제조



<1244>

<1245>

<1246>

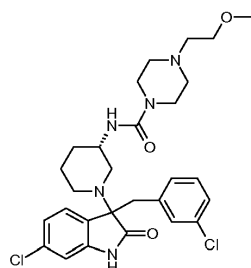
<1247>

M. W. 503.43 $C_{25}H_{28}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 503$.

실시예 177

rac-4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드의 제조



<1248>

<1249>

<1250>

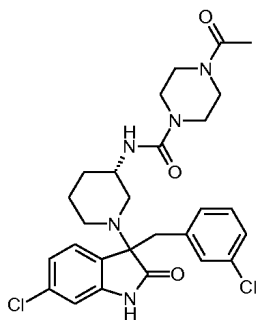
<1251>

M. W. 560.53 $C_{28}H_{35}Cl_2N_5O_3$

표제 화합물을 rac-4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 560$.

실시예 178

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드의 제조



M. W. 544.49 $C_{27}H_{31}Cl_2N_5O_3$

<1252>

<1253>

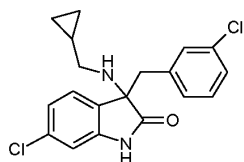
표제 화합물을 rac-4-메틸-피페라진-1-카르복실산 {1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-(3S)-일}-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 544$.

<1254>

실시예 179

<1255>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로프로필메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 361.27

$C_{19}H_{18}Cl_2N_2O$

<1256>

<1257>

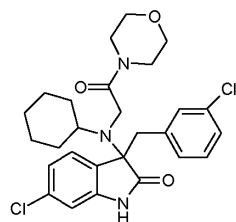
시클로프로판메틸아민 (142 mg, 2.0 mmol)의 디클로로메탄 (20 mL) 중 용액에, rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (0.37 g, 0.99 mmol)을 첨가했다. 혼합물을 실온에서 1 시간 동안 교반한 후, 디클로로메탄 (20 mL)의 또 다른 부분을 첨가했다. 혼합물을 물 (20 mLx 2)로 세정했다. 유기층을 분리하고, Na_2SO_4 로 건조 및 농축시켜, 0.34 g의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로프로필메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 361$

<1258>

실시예 180

<1259>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 516.47

$C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_3$

<1260>

<1261>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일-시클로헥실-아미노-아세트산 (22 mg) 및 모르폴린 (6 mg)의 디클로로메탄 (2 mL) 중 혼합물에, N-(3-디메틸아미노프로필)-N'-에틸카르보다이미드 히드로클로라이드 (19 mg) 및 4-디메틸아미노피리미딘 (12 mg)을 첨가했다. 3 시간 동안 실온에서 교반한 후, 혼합물을 크로마토그래피로 정제해 20 mg의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 516$.

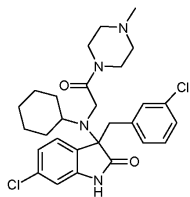
<1262>

실시예 181

<1263>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{시클로헥실-[2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로

-인돌-2-온의 제조



M. W. 529.51

$C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_2$

<1264>

<1265>

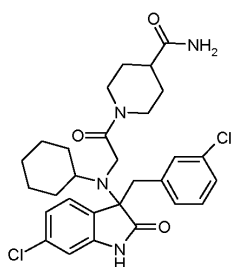
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 529$.

<1266>

실시예 182

<1267>

rac-1-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아미드의 제조



M. W. 557.53

$C_{29}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<1268>

<1269>

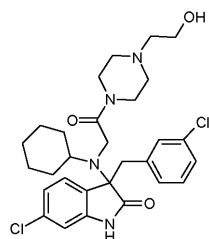
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 557$.

<1270>

실시예 183

<1271>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-(2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 559.54

$C_{29}H_{36}Cl_2N_4O_3$

<1272>

<1273>

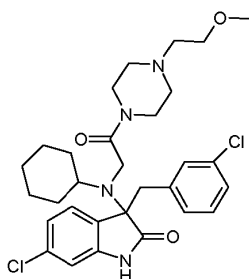
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 559$.

<1274>

실시예 184

<1275>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-(2-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



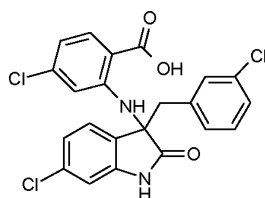
M. W. 573.57

$C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 573$.

실시예 185

rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-일아미노]-벤조산의 제조



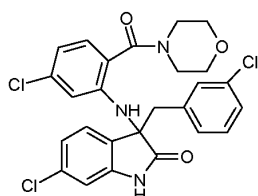
M. W. 461.74

$C_{22}H_{15}Cl_3N_2O_3$

2-아미노-4-클로로 벤조산 (171 mg, 1 mmol) 및 K_2CO_3 (200 mg, 1.4 mmol) 의 DMF (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 혼합물을 이어서 얼음 물에 부은 후 HCl (1N) 을 pH 가 7 이 될 때까지 첨가했다. 혼합물을 디클로로메탄 (50 ml x 3) 으로 추출했다. 유기상을 분리하고, Na_2SO_4 로 건조 및 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 320 mg 의 rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산을 백색 고체로서 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 461$.

실시예 186

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 530.84

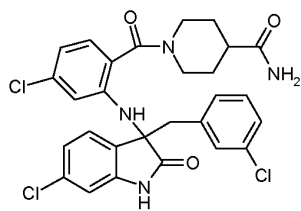
$C_{26}H_{22}Cl_3N_3O_3$

4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산 (23 mg, 0.05 mmol), 모르폴린 (26 mg, 0.3 mmol) 및 EDCI (15 mg, 0.08 mmol) 의 디클로로메탄 (1 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 미정제물을 이어서 크로마토그래피로 정제해 22 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 530$.

실시예 187

rac-1-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-

4-카르복실산 아미드의 제조



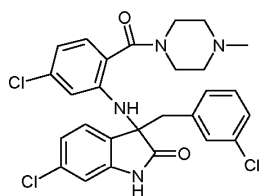
M. W. 571.90

$C_{28}H_{25}Cl_3N_4O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 570.9$.

실시예 188

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(4-메틸-피페라진-1-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



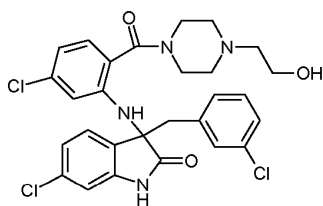
M. W. 543.88

$C_{27}H_{25}Cl_3N_4O_2$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 542.9$.

실시예 189

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



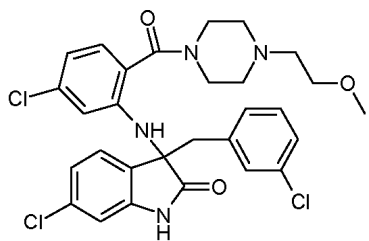
M. W. 573.91

$C_{28}H_{27}Cl_3N_4O_3$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 573$.

실시예 190

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-[4-(2-메톡시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

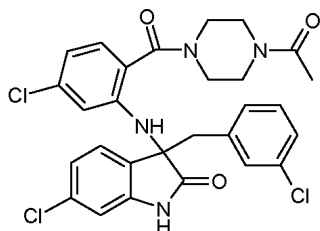


M. W. 587.94 **C₂₉H₂₉Cl₃N₄O₃**

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 587.

실시예 191

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

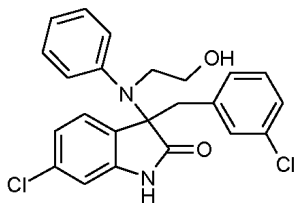


M. W. 571.90 **C₂₈H₂₅Cl₃N₄O₃**

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 571.

실시예 192

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-히드록시-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

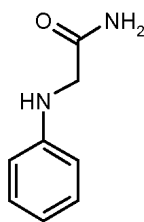


M. W. 427.33 **C₂₃H₂₀Cl₂N₂O₂**

rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (370mg, 1mmol), N-페닐에탄올아민 (165 mg, 1.2 mmol) 및 K₂CO₃ (276 mg, 2 mmol) 의 DMF (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 3 시간 동안 교반했다. 혼합물을 물 (30mL) 에 붓고, 에틸 아세테이트 (10 mL x 3) 로 추출했다. 유기층을 분리, Na₂SO₄ 로 건조 및 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 51 mg 의 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2-히드록시-에틸)-페닐-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온을 백색 고체로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 427.

실시예 193a

<1312> 중간체 2-페닐아미노-아세트아미드의 제조



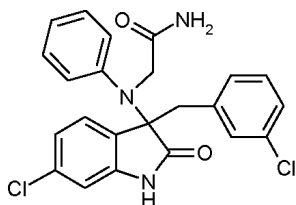
M. W. 150.18 $C_8H_{10}N_2O$

<1313>

<1314> 2-클로로아세트아미드 (3.1 g), 아닐린 (3.1 g), K_2CO_3 (4.5 g) 및 KI (1g) 의 아세트니트릴 (50 mL) 및 물 (10 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 용매를 약 20 ml 까지 진공하에서 증발시키고, 잔류물을 물 (40 mL) 에 부었다. 용액을 에틸 아세테이트 (3 x 20 mL) 로 추출, Na_2SO_4 로 건조 및 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 0.48 g 의 2-페닐아미노-아세트아미드를 수득했다..

<1315> 실시예 193b

<1316> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트아미드의 제조



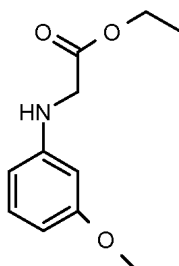
M. W. 440.33 $C_{23}H_{19}Cl_2N_3O_2$

<1317>

<1318> rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (370 mg, 1 mmol), 2-페닐아미노-아세트아미드 (200 mg, 1.33 mmol) 및 K_2CO_3 (300 mg, 2.2 mmol) 의 DMF (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 1 시간 동안 교반했다. 혼합물을 물 (30ml) 에 붓고, 에틸 아세테이트 (10 mL x 3) 로 추출했다. 유기상을 분리, Na_2SO_4 로 건조 및 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해, 60 mg 의 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트아미드를 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 439.8$.

<1319> 실시예 194a

<1320> 중간체 (3-메톡시-페닐아미노)-아세트산 에틸 에스테르의 제조



M. W. 209.25 $C_{11}H_{15}NO_3$

<1321>

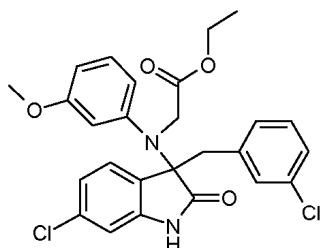
<1322> 3-메톡시아닐린 (3.7 g), 에틸 브로모아세테이트 (5 g) 및 트리에틸아민 (4 g) 의 디클로로메탄 (30 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 혼합물을 물 (50ml) 로 세정, Na_2SO_4 로 건조 및 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 1.7 g 의 (3-메톡시-페닐아미노)-아세트산 에틸 에스테르를 수득했다.

¹HNMR: δ 1.33 (3H), 3.796 (3H),

3.92 (2H), 4.26 (2H), 6.21 (1H), 6.29 (1H), 6.36 (1H), 7.13 (1H).

실시예 194b

rac-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-메톡시-페닐)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르의 제조

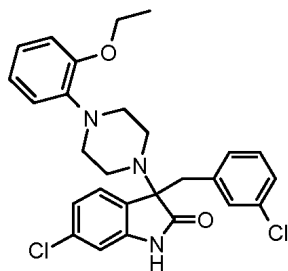


M. W. 499.40 C₂₆H₂₄Cl₂N₂O₄

표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-페닐-아미노}-아세트아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 499.

실시예 195

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(2-에톡시-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

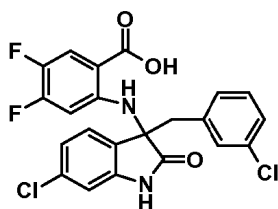


M. W. 496.4 C₂₇H₂₇Cl₂N₃O₄

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-(4-트리플루오로메틸-페닐)-피페라진-1-일]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 496 (M+H)⁺.

실시예 196

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-벤조산의 제조

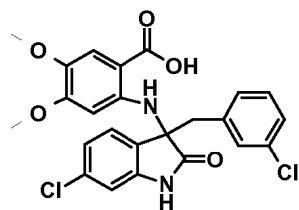


M. W. 463.27 C₂₂H₁₄Cl₂F₂N₂O₃

표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS m/z 461 (M-H)⁻.

<1337> 실시예 197

<1338> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디메톡실-벤조산의 제조

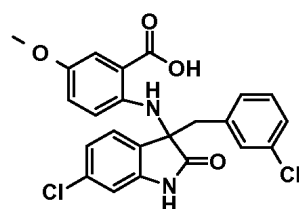


<1339> M. W. 487.34 $C_{24}H_{20}Cl_2N_2O_5$

<1340> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 질
차와 동일한 질차로 제조했다. MS m/z 487 (M+H)⁺.

<1341> 실시예 198

<1342> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메톡실-벤조산의 제조

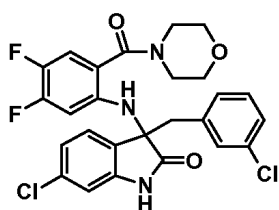


<1343> M. W. 457.32 $C_{23}H_{18}Cl_2N_2O_4$

<1344> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 질
차와 동일한 질차로 제조했다. MS m/z 457 (M+H)⁺.

<1345> 실시예 199

<1346> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-
2-온의 제조

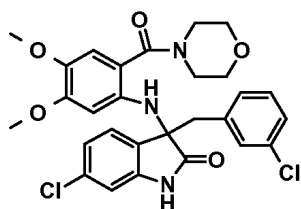


<1347> M. W. 532.38 $C_{26}H_{21}Cl_2F_2N_3O_3$

<1348> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드
로-인돌-2-온과 유사한 질차에 따라 제조했다. MS m/z 532 (M+H)⁺

<1349> 실시예 200

<1350> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4,5-디메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-
2-온의 제조



<1351>

<1352>

M. W. 556.45 $C_{28}H_{27}Cl_2N_3O_5$

<1353>

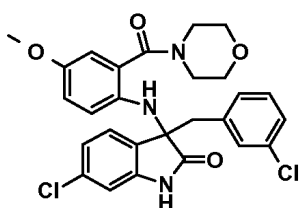
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 556 (M+H)⁺.

<1354>

실시예 201

<1355>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[4-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1356>

M. W. 526.42 $C_{27}H_{25}Cl_2N_3O_4$

<1357>

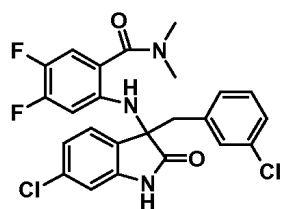
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 526 (M+H)⁺.

<1358>

실시예 202

<1359>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N,N'-디메틸-벤즈아미드의 제조



<1360>

M. W. 490.34 $C_{24}H_{19}Cl_2F_2N_3O_2$

<1361>

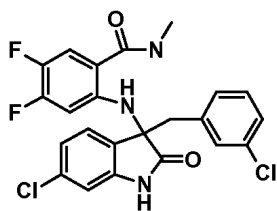
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 490 (M+H)⁺.

<1362>

실시예 203

<1363>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-메틸-벤즈아미드의 제조



M. W. 476.31 $C_{23}H_{17}Cl_2F_2N_3O_2$

<1364>

<1365>

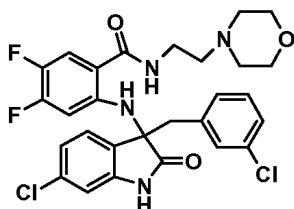
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 476 (M+H)⁺.

<1366>

실시예 204

<1367>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드의 제조



M. W. 575.45 $C_{28}H_{26}Cl_2F_2N_4O_3$

<1368>

<1369>

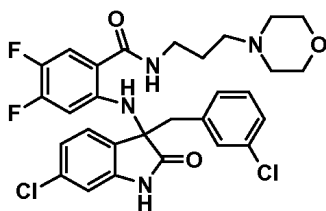
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 575 (M+H)⁺.

<1370>

실시예 205

<1371>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4,5-디플루오로-N-(2-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드의 제조



M. W. 589.47 $C_{29}H_{28}Cl_2F_2N_4O_3$

<1372>

<1373>

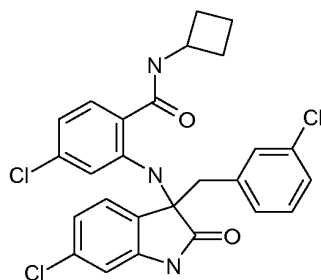
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS m/z 589 (M+H)⁺.

<1374>

실시예 206

<1375>

rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드의 제조



M.W. 514.84 $C_{26}H_{22}Cl_3N_3O_2$

<1376>

<1377>

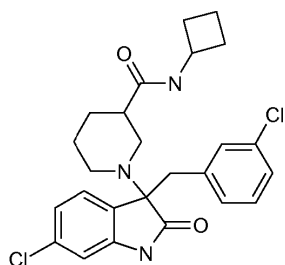
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 514$.

<1378>

실시예 207

<1379>

rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



M.W. 472.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_2$

<1380>

<1381>

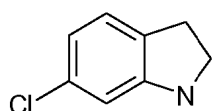
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{3-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 529$

<1382>

실시예 208a

<1383>

중간체 6-클로로-2,3-디히드로-1H-인돌의 제조



<1384>

<1385>

M.W. 153.61 C_8H_8ClN

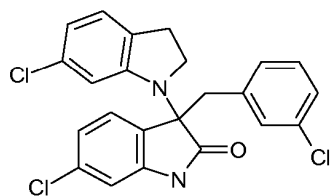
<1386>

소듐 보로히드라이드 (2.0 g, 53 mmol) (Aldrich) 를 소량 분획으로, 기체 발생이 너무 격렬하지 않는 속도로, 빙냉조 (ice-water bath) 내에서 냉각한 6-클로로-1H-인돌 (1.0 g, 6.6mmol) (Aldrich) 의 TFA (10mL) 중 혼합물에 첨가하였다. 첨가를 완료했을 때, 혼합물을 실온으로 가온시켰고, 하룻밤 교반했다. 생성 혼합물을 진공 하 농축시키고 잔류물을 DCM 중에서 용해했다. 유기층을 Na_2CO_3 용액으로 세정, Na_2SO_4 로 건조, 및 농축시켜 0.6g 미정제 6-클로로-2,3-디히드로-1H-인돌을 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 154$

<1387>

실시예 208b

<1388> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



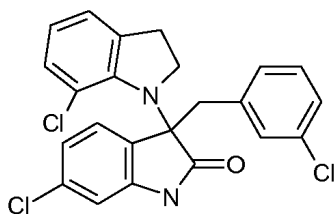
M.W. 443.76 C₂₃H₁₇Cl₃N₂O

<1389>

<1390> rac-3-브로모-6-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100 mg, 0.27 mmol) (상기 실시예 1c), 6-클로로-2,3-디히드로-1H-인돌 (62mg, 0.45mmol) 및 K₂CO₃ (110 mg, 0.80 mmol) 의 DMF (1mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 그 다음, 물 (10 mL) 을 첨가하고, 원하는 생성물을 침전시켜 내었다. 미정제 생성물을 제조용-HPLC 로 정제해 55mg rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온을 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 443

<1391> 실시예 209

<1392> rac-7,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



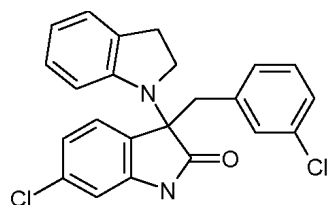
M.W. 443.76, C₂₃H₁₇Cl₃N₂O

<1393>

<1394> 표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 443

<1395> 실시예 210

<1396> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



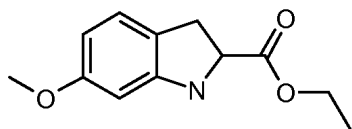
M.W. 409.32, C₂₃H₁₈Cl₂N₂O

<1397>

<1398> 표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 409

<1399> 실시예 211a

<1400> 중간체 rac-6-메톡시-2,3-디히드로-1H-인돌-2-카르복실산 에틸 에스테르의 제조

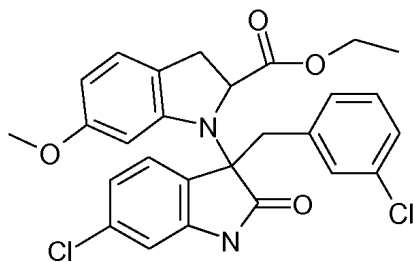


<1401> M.W. 221.26, C₁₂H₁₅NO₃

<1402> 소듐 시아노보로하이드라이드 (750mg, 12 mmol) (Aldrich) 를 소량 분획으로, 기체 발생이 너무 격렬하지 않은 속도로, 빙냉조에서 냉각한 6-메톡시-1H-인돌-2-카르복실산 에틸 에스테르 (500mg, 2.4mmol) (Aldrich) 의 TFA (10mL) 중 혼합물에 첨가했다. 첨가가 완료되었을 때, 혼합물을 실온까지 가온되게 하였고, 2.5 시간 동안 교반했다. 생성 혼합물을 진공 하 농축하고 잔류물을 DCM 중에서 용해했다. 유기층을 Na₂CO₃ 용액으로 세정하고, Na₂SO₄ 로 건조, 및 농축시켜, 400mg rac-6-메톡시-2,3-디히드로-1H-인돌-2-카르복실산 에틸 에스테르를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 222

<1403> 실시예 211b

<1404> 중간체 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르의 제조

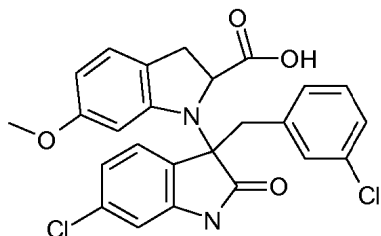


<1405> M.W. 511.41, C₂₇H₂₄Cl₂N₂O₄

<1406> 표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 511

<1407> 실시예 211c

<1408> 중간체 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산의 제조



M.W. 483.36, C₂₅H₂₀Cl₂N₂O₄

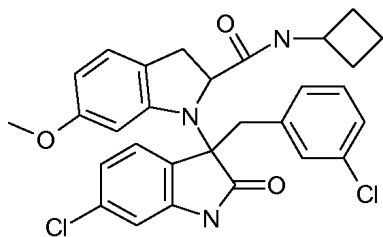
<1409>

<1410> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 메틸 에스테르 (250mg, 0.5mmol), NaOH (40mg, 1.0mmol) 의 메탄올 (4mL) 및 물 (2mL) 중 혼합물을 3 시간 동안 가열 환류 했다. 이어서 혼합물을 진공 하 농축하여 메탄올을 제거했다. 물 (10mL) 을 잔류물에 첨가했다. 생성 혼합물을 아세트산으로 산성화하고, 에틸 아세테이트로 추출했다. 유기층을 물로 세정하고, Na₂SO₄ 로 건조, 진공 하 농축시켜, 250mg rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-

2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산을 수득했다. MS: $[M-H]^- = 481$

<1411> 실시예 211d

<1412> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



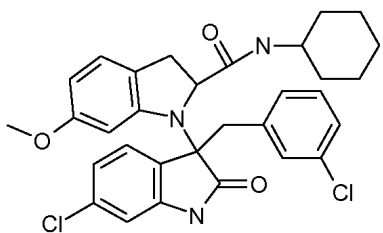
M.W. 536.46, $C_{29}H_{27}Cl_2N_3O_3$

<1413>

<1414> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 536$

<1415> 실시예 212

<1416> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로헥실아미드의 제조



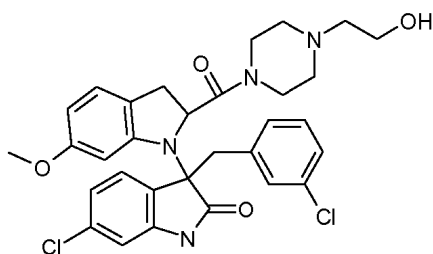
M.W. 564.52, $C_{31}H_{31}Cl_2N_3O_3$

<1417>

<1418> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 564$

<1419> 실시예 213

<1420> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



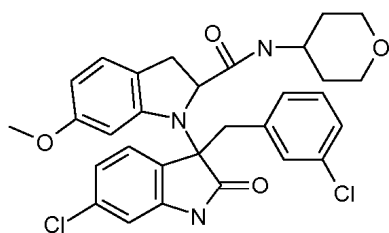
M.W. 595.53, $C_{31}H_{32}Cl_2N_4O_4$

<1421>

<1422> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 595$

<1423> 실시예 214

<1424> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

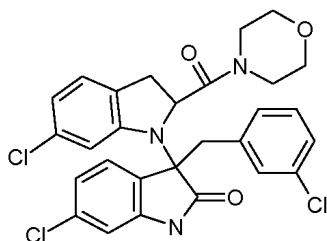


<1425> M.W. 566.49, C₃₀H₂₉Cl₂N₃O₄

<1426> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 566

<1427> 실시예 215

<1428> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

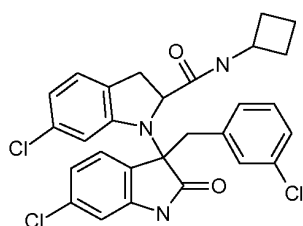


<1429> M.W. 556.88, C₂₈H₂₄Cl₃N₃O₃

<1430> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 556

<1431> 실시예 216

<1432> rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조

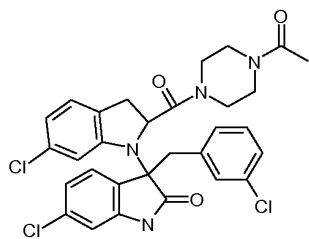


<1433> M.W. 540.88, C₂₈H₂₄Cl₃N₃O₂

<1434> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 542

<1435> 실시예 217

<1436> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



M.W. 597.93, C₃₀H₂₇Cl₃N₄O₃

<1437>

<1438>

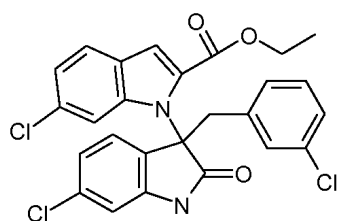
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 597

<1439>

실시예 218a

<1440>

중간체 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르의 제조



M.W. 513.81, C₂₆H₁₉Cl₃N₂O₃

<1441>

<1442>

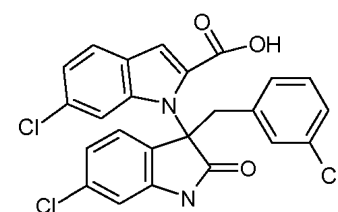
rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르 (1.0g, 1.9mmol) 및 DDQ (0.73g, 3.2mmol) 의 톨루엔 (50mL) 중 용액을 90℃ 까지 4 시간 가열했다. 이어서, 혼합물을 실온으로 냉각시키고 NaOH 용액 (10%) 및 물로 세정했다. 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조, 진공 하 농축시켜 0.9g rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 에틸 에스테르를 황색 고체로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 513

<1443>

실시예 218b

<1444>

중간체 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산의 제조



M.W. 485.76, C₂₄H₁₅Cl₃N₂O₃

<1445>

<1446>

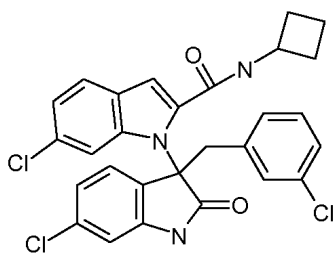
표제 화합물을 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 483

<1447>

실시예 218c

<1448>

rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



M.W. 538.87, C₂₈H₂₂Cl₃N₃O₂

<1449>

<1450>

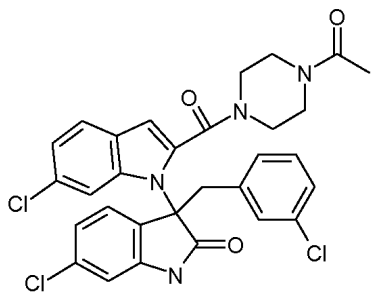
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 538

<1451>

실시예 219

<1452>

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



M.W. 595.92, C₃₀H₂₅Cl₃N₄O₃

<1453>

<1454>

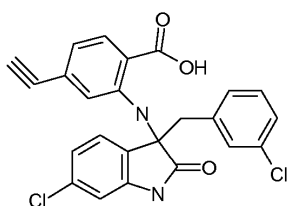
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 595

<1455>

실시예 220

<1456>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-에티닐-벤조산의 제조



M.W. 451.31, C₂₄H₁₆Cl₂N₂O₃

<1457>

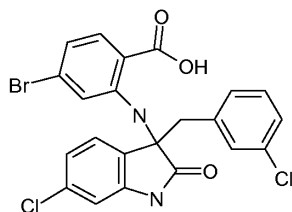
<1458>

표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 449

<1459>

실시예 221

<1460> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산의 제조

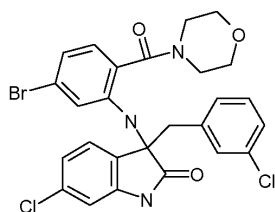


<1461> M.W. 506.19, C₂₂H₁₅BrCl₂N₂O₃

<1462> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 503

<1463> 실시예 222

<1464> rac-3-[5-브로모-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

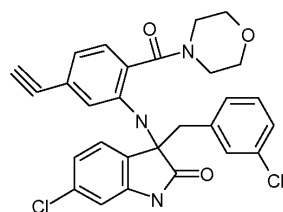


<1465> M.W. 575.29, C₂₆H₂₂BrCl₂N₃O₃

<1466> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 574

<1467> 실시예 223

<1468> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-에티닐-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

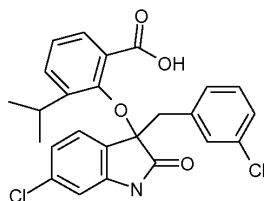


<1469> M.W. 520.42, C₂₈H₂₃Cl₂N₃O₃

<1470> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 520

<1471> 실시예 224

<1472> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-3-이소프로필-벤조산의 제조



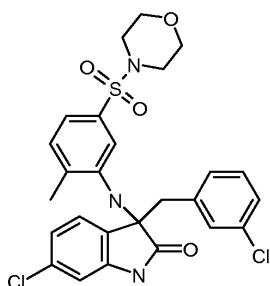
M.W. 470.36, C₂₅H₂₁Cl₂NO₄

<1473>

<1474> 2-히드록실-3-이소프로필 벤조산 및
 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온으로부터, 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 468

<1475> 실시예 225

<1476> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-메틸-5-(모르폴린-4-술포닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



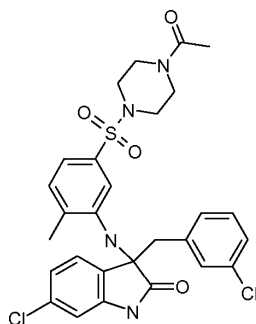
M.W. 546.48, C₂₆H₂₅Cl₂N₃O₄S

<1477>

<1478> 표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 546

<1479> 실시예 226

<1480> rac-3-[5-(4-아세틸-피페라진-1-술포닐)-2-메틸-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M.W. 587.53, C₂₈H₂₈Cl₂N₄O₄S

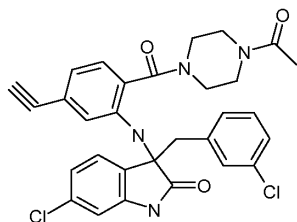
<1481>

<1482> 표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 587

<1483> 실시예 227

<1484> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-에티닐-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인

돌-2-온의 제조

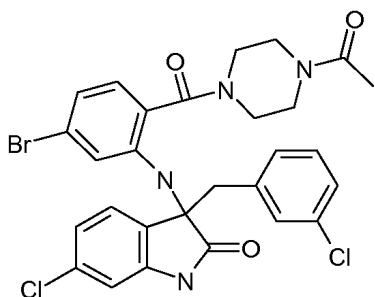


M.W. 561.47, C₃₀H₂₆Cl₂N₄O₃

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 561

실시예 228

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

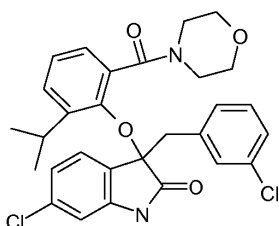


M.W. 616.35, C₂₈H₂₅BrCl₂N₄O₃

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 615

실시예 229

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-이소프로필-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

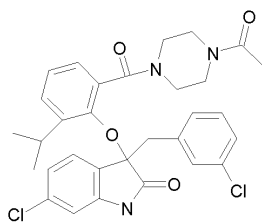


M.W. 539.46, C₂₉H₂₈Cl₂N₂O₄

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 539

실시예 230

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

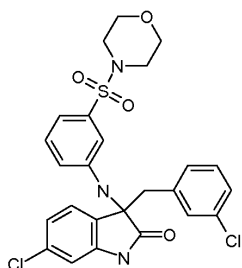


M.W. 580.52, C₃₁H₃₁Cl₂N₃O₄

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 580

실시예 231

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3-(모르폴린-4-술포닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

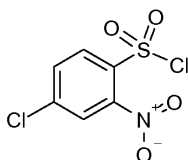


M.W. 532.45, C₂₅H₂₃Cl₂N₃O₄S

표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 532

실시예 232a

중간체 4-클로로-2-니트로-벤젠술포닐 클로라이드의 제조

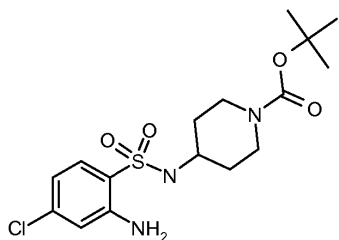


M.W. 256.07, C₆H₃Cl₂NO₄S

4-클로로-2-니트로-페닐아민 (2.0g, 11.6mmol) (Aldrich) 의 TFA (30mL) 및 진한 염산 (3mL) 중 혼합물을 -5℃ 로 냉각한 다음, NaNO₂ 의 물 (5mL) 중 용액을 온도가 5℃ 를 초과하지 않는 속도로 적가했다. 첨가를 완료했을 때, 혼합물을 0℃ 에서 추가 5 분 동안 교반한 다음, 아세트산 (40mL), 아황산 (40mL), CuCl₂ (824mg, 6.1mmol) 및 CuCl (50mg, 0.5mmol) 의 혼합물에 부었는데, 상기는 미리 0℃ 로 냉각했다. 전체를 실온에서 40 분 동안 교반하고, 물 (100mL) 로 희석, 여과했다. 필터 케이크를 물로 세정, 진공 하 건조시켜 1.5g 4-클로로-2-니트로-벤젠술포닐 클로라이드를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 256

실시예 232b

<1508> 중간체 4-(2-아미노-4-클로로-벤젠술폰닐아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조

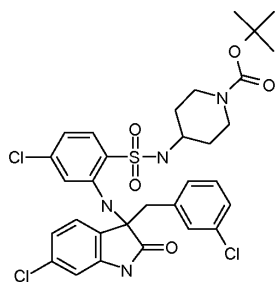


<1509> M.W. 389.90, C₁₆H₂₄ClN₃O₄S

<1510> 4-클로로-2-니트로-벤젠술폰닐 클로라이드 (255mg, 1mmol), 4-아미노-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (200mg, 1mmol) 및 K₂CO₃ (276mg, 2mmol) 의 DCM (3mL) 중 혼합물을 실온에서 1 시간 동안 교반했다. 혼합물을 진공 하 농축시키고, 잔류물을 메탄올 중에 용해한 다음, Ra-Ni (0.5g) 및 히드라진 (1mL, 17mmol) 을 첨가했다. 생성 혼합물을 실온에서 2 시간 동안 교반하고, 여과하고 진공 하 농축했다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피로 정제해 380mg 4-(2-아미노-4-클로로-벤젠술폰닐아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 담백색 고체로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 390

<1511> 실시예 232c

<1512> rac-4-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤젠술폰닐아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조

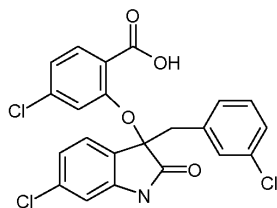


<1513> M.W. 680.06, C₃₁H₃₃Cl₃N₄O₅S

<1514> 4-(2-아미노-4-클로로-벤젠술폰닐아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (20mg, 0.051mmol), rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (30mg, 0.081mmol) 및 K₂CO₃ (30mg, 0.22mmol) 의 DCM (1mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 혼합물을 컬럼 크로마토그래피로 정제해 22mg rac-4-{4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤젠술폰닐아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 679

<1515> 실시예 233

<1516> rac-4-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-벤조산의 제조

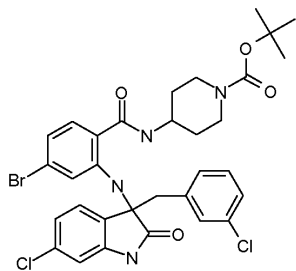


<1517> M.W. 462.72, C₂₂H₁₄Cl₃NO₄

<1518> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 460

<1519> 실시예 234

<1520> rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조

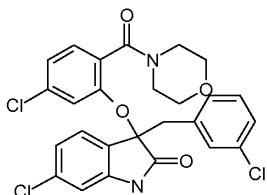


<1521> M.W. 688.45, C₃₂H₃₃BrCl₂N₄O₄

<1522> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 687

<1523> 실시예 235

<1524> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페녹시]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

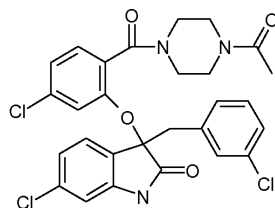


<1525> M.W. 531.83, C₂₆H₂₁Cl₃N₂O₄

<1526> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 531

<1527> 실시예 236

<1528> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-클로로-페녹시]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

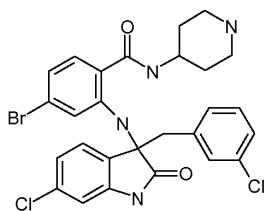


<1529> M.W. 572.88, C₂₈H₂₄Cl₃N₃O₄

<1530> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 572

<1531> 실시예 237

<1532> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-피페리딘-4-일-벤즈아미드의 제조



M.W. 588.34, C₂₇H₂₅BrCl₂N₄O₂

<1533>

<1534>

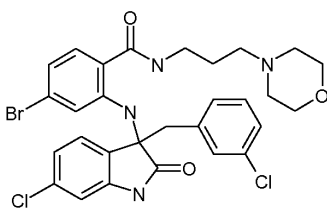
rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (30mg, 0.044mmol) 의 DCM (2mL) 중 용액에, TFA (0.5mL) 를 첨가했다. 혼합물을 3 시간 동안 교반, 농축했다. 잔류물을 DCM 중에 용해, 생성 용액을 Na₂CO₃ 용액으로 세정, Na₂SO₄ 로 건조, 농축해 22mg rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-피페리딘-4-일-벤즈아미드를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 587

<1535>

실시예 238

<1536>

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-모르폴린-4-일-프로필)-벤즈아미드의 제조



M.W. 632.39, C₂₉H₂₉BrCl₂N₄O₃

<1537>

<1538>

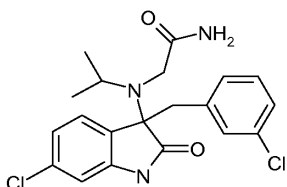
표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 631

<1539>

실시예 239

<1540>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트아미드의 제조



M.W. 406.32, C₂₀H₂₁Cl₂N₃O₂

<1541>

<1542>

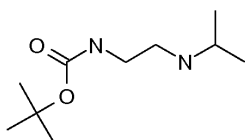
표제 화합물을 rac-6,6'-디클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 406

<1543>

실시예 240a

<1544>

중간체 (2-이소프로필아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르의 제조



<1545>

<1546>

M.W. 202.30, C₁₀H₂₂N₂O₂

<1547>

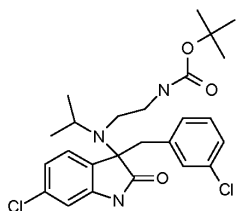
이소프로필아민 (7mL, 75mmol), K₂CO₃ (2.7g, 20mmol) 의 아세토니트릴 (20mL) 중 혼합물에, (2-브로모-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르 (3.4g, 15mmol) 의 아세토니트릴 (10mL) 중 용액을 적가했다. 생성 혼합물을 60℃ 로 1.5 시간 동안 가열하고, 진공 하 농축했다. 잔류물을 DCM 중에 용해하고, 여과하고 농축시켜, 3g 2-이소프로필아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르를 얻은 황색 오일로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 203

<1548>

실시예 240b

<1549>

중간체 rac-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르의 제조



<1550>

M.W. 492.45, C₂₅H₃₁Cl₂N₃O₃

<1551>

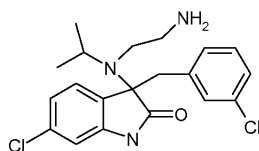
(2-이소프로필아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르 (100mg, 0.5mmol), rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (185mg, 0.5mmol) 및 K₂CO₃ (138mg, 1mmol) 의 DCM (1mL) 및 아세토니트릴 (2mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 혼합물을 농축하고 컬럼 크로마토그래피로 정제해 180mg rac-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 492

<1552>

실시예 240c

<1553>

rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1554>

<1555>

M.W. 392.33, C₂₀H₂₃Cl₂N₃O

<1556>

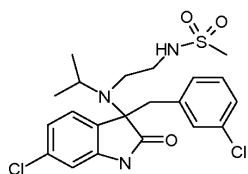
rac-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르 (100mg, 0.2mmol) 의 DCM (10mL) 중 용액에, TFA (0.3mL) 를 첨가했다. 혼합물을 실온에서 2 시간 동안 교반한 다음 NaOH 용액 (5%) 및 물로 세정했다. 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조, 진공 하 농축시켜 60mg rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 392

<1557>

실시예 241

<1558>

rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술폰아미드의 제조



M.W. 470.42, C₂₁H₂₅Cl₂N₃O₃S

<1559>

<1560>

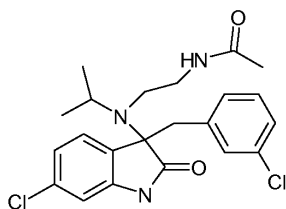
rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (50mg, 0.13mmol) 및 K₂CO₃ (35mg, 0.25mmol) 의 DCM (2mL) 중 혼합물에, 메틸술폰닐 클로라이드 (16mg, 0.14mmol) 를 첨가했다. 생성 용액을 실온에서 2 시간 동안 교반한 다음, 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해, 65mg rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술폰폰아미드를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 470

<1561>

실시예 242

<1562>

rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아세트아미드의 제조



M.W. 434.37, C₂₂H₂₅Cl₂N₃O₂

<1563>

<1564>

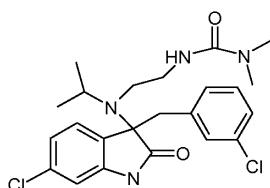
표제 화합물을 rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 434

<1565>

실시예 243

<1566>

rac-3-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-1,1-디메틸-우레아의 제조



M.W. 463.41, C₂₃H₂₈Cl₂N₄O₂

<1567>

<1568>

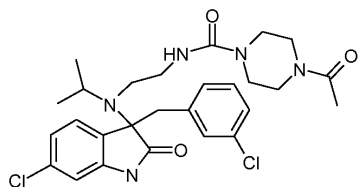
표제 화합물을 rac-N-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 463

<1569>

실시예 244

<1570>

rac-4-아세틸-피페라진-1-카복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드의 제조



M.W. 546.50, C₂₇H₃₃Cl₂N₅O₃

<1571>

<1572>

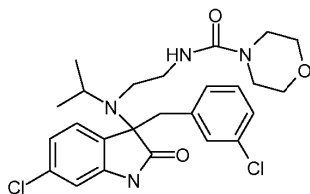
표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 546

<1573>

실시예 245

<1574>

rac-모르폴린-4-카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드의 제조



M.W. 505.45, C₂₅H₃₀Cl₂N₄O₃

<1575>

<1576>

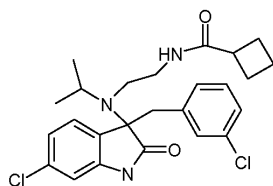
표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 505

<1577>

실시예 246

<1578>

rac-시클로부탄카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드의 제조



M.W. 474.43, C₂₅H₂₉Cl₂N₃O₂

<1579>

<1580>

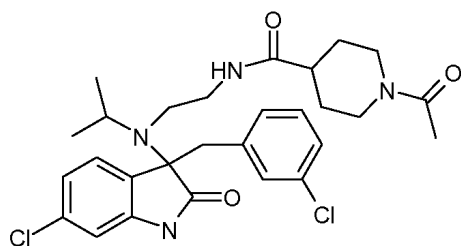
rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (60mg, 0.15mmol), 시클로부탄카르복실산 (18.4mg, 0.18mmol), EDCI (37mg, 0.19mmol), HOBt (30mg, 0.19mmol) 및 DIPEA (40μL, 0.225) 의 DCM (2mL) 중 혼합물을 실온에서 2 시간 동안 교반했다. 혼합물을 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해 60mg rac-시클로부탄카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 474

<1581>

실시예 247

<1582>

rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드의 제조



M.W. 545.51, C₂₈H₃₄Cl₂N₄O₃

<1583>

<1584>

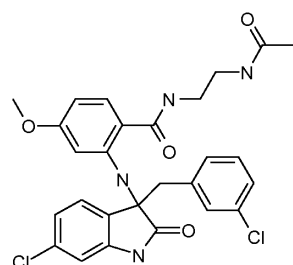
표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 545

<1585>

실시예 248

<1586>

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메톡시-벤즈아미드의 제조



M.W. 541.44, C₂₇H₂₆Cl₂N₄O₄

<1587>

<1588>

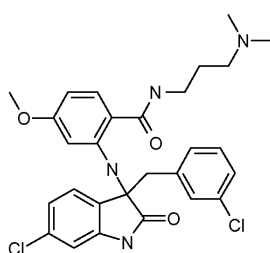
표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 541

<1589>

실시예 249

<1590>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-4-메톡시-벤즈아미드의 제조



M.W. 541.48, C₂₈H₃₀Cl₂N₄O₃

<1591>

<1592>

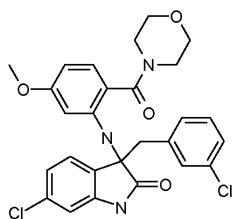
표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 541

<1593>

실시예 250

<1594>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

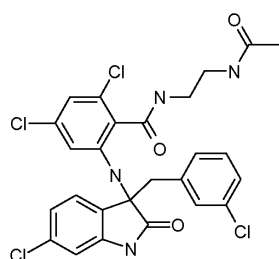


M.W. 526.42, $C_{27}H_{25}Cl_2N_3O_4$

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 526$

실시예 251

rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드의 제조

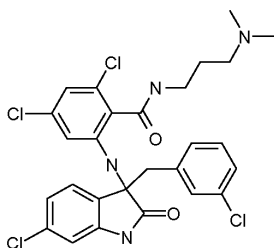


M.W. 580.30, $C_{26}H_{22}Cl_4N_4O_3$

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 579$

실시예 252

rac-2,4-디클로로-6-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드의 제조

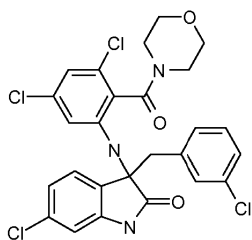


M.W. 580.35, $C_{27}H_{26}Cl_4N_4O_2$

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 579$

실시예 253

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[3,5-디클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

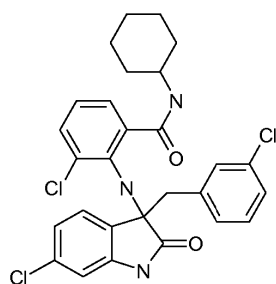


M.W. 565.29, C₂₆H₂₁Cl₄N₃O₃

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 564

실시예 254

rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-벤즈아미드의 제조

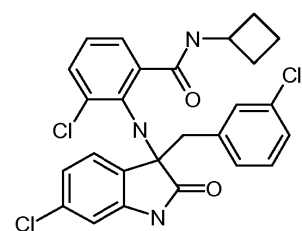


M.W. 542.90, C₂₈H₂₆Cl₃N₃O₂

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 542

실시예 255

rac-3-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-벤즈아미드의 제조

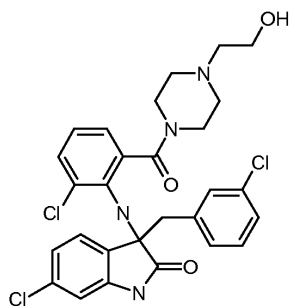


M.W. 514.84, C₂₆H₂₂Cl₃N₃O₂

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 514

실시예 256

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-클로로-6-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

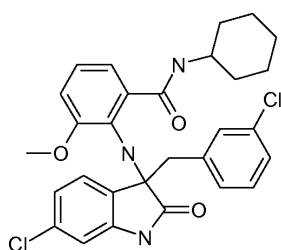


M.W. 573.91, C₂₈H₂₇Cl₃N₄O₃

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 573

실시예 257

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로헥실-3-메톡시-벤즈아미드의 제조

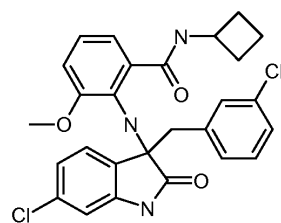


M.W. 538.48, C₂₉H₂₉Cl₂N₃O₃

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 538

실시예 258

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-3-메톡시-벤즈아미드의 제조

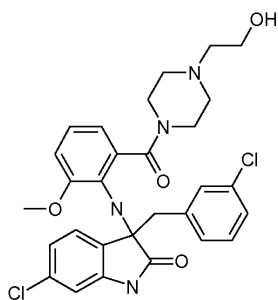


M.W. 510.42, C₂₇H₂₅Cl₂N₃O₃

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 510

실시예 259

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M.W. 569.49, C₂₉H₃₀Cl₂N₄O₄

<1631>

<1632>

표제

화합물을

rac-시클로부탄카르복실산

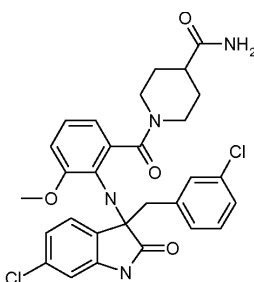
(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 569

<1633>

실시예 260

<1634>

rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메톡시-벤조일}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



M.W. 567.48, C₂₉H₂₈Cl₂N₄O₄

<1635>

<1636>

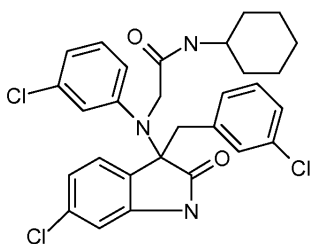
표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 567

<1637>

실시예 261

<1638>

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조



M. W. 556.918

C₂₉H₂₈Cl₃N₃O₂

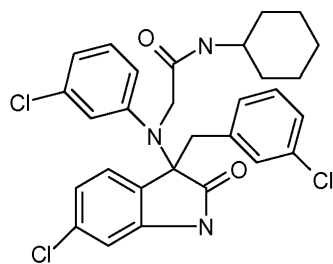
<1639>

<1640>

[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세트산 100mg, 0.211mmol), 시클로헥실아민 (25mg, 0.253mmol), EDC.HCl (48mg, 0.253mmol), HOBt (34mg, 0.253mmol) 및 DIPEA (82mg, 0.633mmol) 의 아세트니트릴 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 미정제물을 이어서 제조용-HPLC 로 정제해 48 mg 의 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드를 황색 고체로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 556.

<1641> 실시예 262

<1642> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

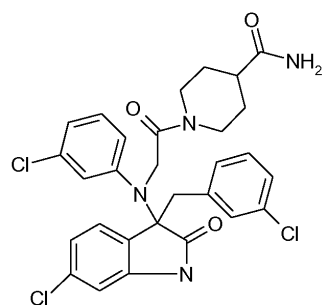


<1643> M. W. 528.865 $C_{27}H_{24}Cl_3N_3O_2$

<1644> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 528(M+H)⁺.

<1645> 실시예 263

<1646> rac-1-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세틸}-피페리딘-4-카복실산 아미드의 제조

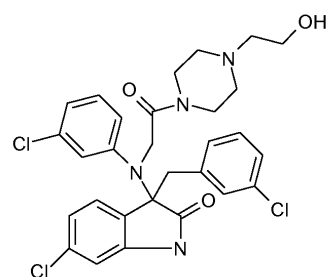


<1647> M. W. 585.916 $C_{29}H_{27}Cl_3N_4O_3$

<1648> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 585(M+H)⁺.

<1649> 실시예 264

<1650> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((3-클로로-페닐)-(2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

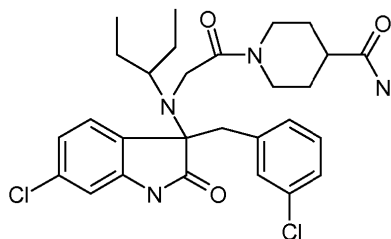


<1651> M. W. 587.932 $C_{29}H_{29}Cl_3N_4O_3$

<1652> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 587(M+H)⁺.

<1653> 실시예 265

<1654> rac-1-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



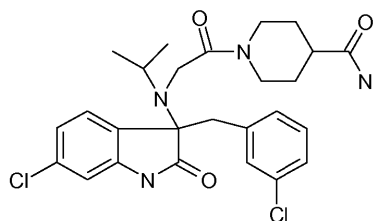
M. W. 545.508 $C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<1655>

<1656> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 545(M+H)⁺.

<1657> 실시예 266

<1658> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



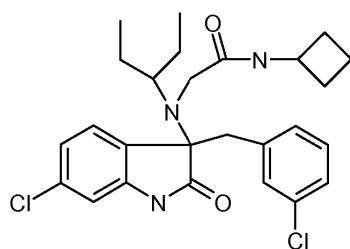
M. W. 517.454 $C_{26}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<1659>

<1660> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 517(M+H)⁺.

<1661> 실시예 267

<1662> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



<1663>

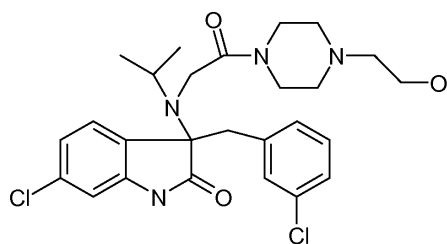
M. W. 488.456 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1664>

<1665> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488(M+H)⁺.

<1666> 실시예 268

<1667> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-({2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-이소프로필-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 519.47 $C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<1668>

<1669>

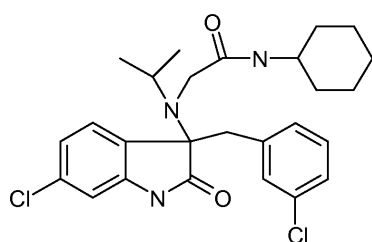
표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 519(M+H)⁺.

<1670>

실시예 269

<1671>

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조



M. W. 488.456 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1672>

<1673>

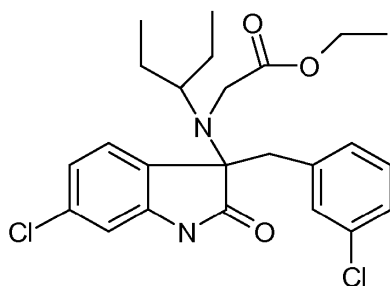
표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488(M+H)⁺.

<1674>

실시예 270

<1675>

rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-아세트산 에틸 에스테르의 제조



M. W. 463.402 $C_{24}H_{28}Cl_2N_2O_3$

<1676>

<1677>

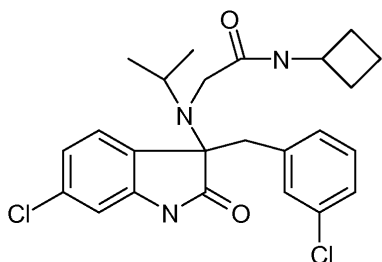
표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 463(M+H)⁺.

<1678>

실시예 271

<1679>

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

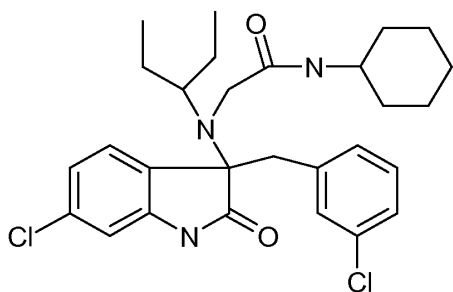


M. W. 460.402 $C_{24}H_{27}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 460(M+H)⁺.

실시예 272

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조

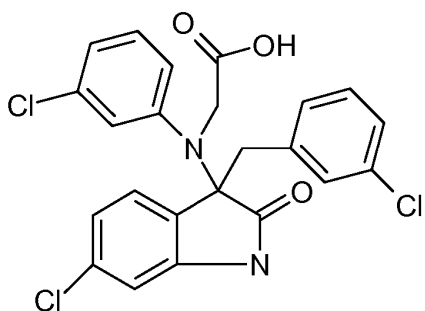


M. W. 516.509 $C_{24}H_{27}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 516(M+H)⁺.

실시예 273

rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세트산의 제조



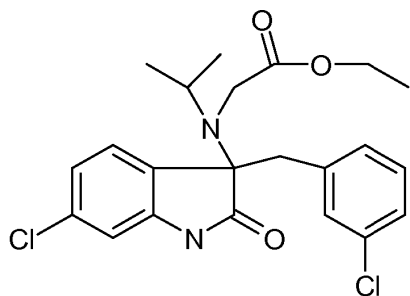
M. W. 475.757 $C_{23}H_{17}Cl_3N_2O_3$

실온에서, (3-클로로-페닐아미노)-아세트산 (1.25g, 6.8mmol) 을 10ml 1N K₂CO₃ 수용액 중에 용해한 다음, 3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (2.5g, 6.8mmol) 및 10ml 1,4-디옥산을 서서히 첨가했다. 약 3 시간 동안 교반한 후에, 용액을 농축하고 수 층을 CH₂Cl₂ 로 추출했다. 유기층을 건조하고, 농축시켜 미정제 생성물을 수득하고, 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해, 1.2g 황색 고체 rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-아세트산을 수득했다.

MS: 475(M+H)⁺.

<1691> 실시예 274

<1692> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르의 제조

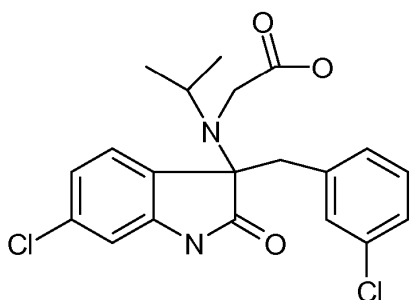


<1693> M. W 435.349 $C_{22}H_{24}Cl_2N_2O_3$

<1694> 실온에서, 3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (4.57g, 12.3mmol) 및 이소프로필아미노-아세트산 에틸 에스테르 (2.15g, 14.8mmol), DIPEA (2.14ml) 를 약 40ml 디클로로메탄 중에서 혼합했다. 약 3 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축하고 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 4.7g 고체의 rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르를 수득했다. MS: 435(M+H)⁺.

<1695> 실시예 275

<1696> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산의 제조



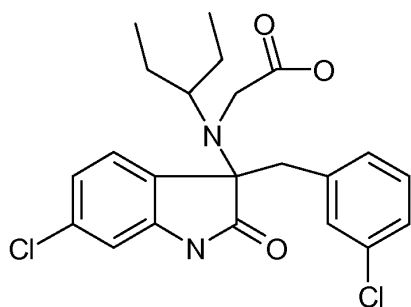
<1697> M. W 407.295 $C_{20}H_{20}Cl_2N_2O_3$

<1698> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르 (4.5g, 10.4mmol) 를 MeOH 및 KOH 수용액의 혼합물 중에 용해했다. 상기 혼합된 용액을 하룻밤 환류한 다음 용액을 농축했다. 수 층의 PH 를 5-6 으로 조절한 다음, 수 층을 디클로로메탄으로 추출했다. 유기층을 건조, 농축 및 크로마토그래피로 정제해 3.2g 고체의 rac- {{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산을 수득했다.

<1699> MS: 407(M+H)⁺.

<1700> 실시예 276

<1701> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1-에틸-프로필)-아미노}-아세트산의 제조



M. W 435.349 $C_{22}H_{24}Cl_2N_2O_3$

<1702>

<1703>

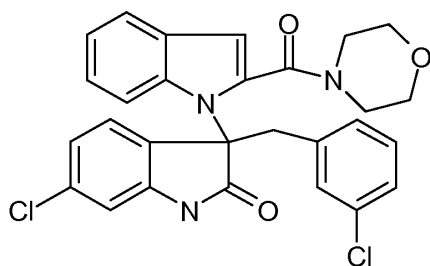
표제 화합물을 rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 435(M+H)⁺.

<1704>

실시예 277

<1705>

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



M. W 520.414 $C_{28}H_{23}Cl_2N_3O_3$

<1706>

<1707>

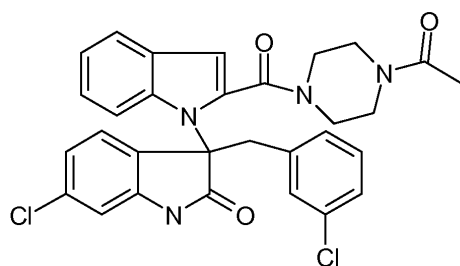
실온에서, 6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온 (60mg, 0.115mmol) 및 DDQ (47mg, 0.207mmol) 를 5ml 톨루엔 중에 용해했다. 하룻밤 교반한 후, 용액을 농축한 다음 잔류물을 EtOAc 중에 용해했다. 유기층을 10% NaOH 수용액으로 세정하고 건조, 농축시켜 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 20mg 황색 고체의 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온을 수득했다. MS: 520(M+H)⁺.

<1708>

실시예 278

<1709>

rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



M. W 561.466 $C_{30}H_{26}Cl_2N_4O_3$

<1710>

<1711>

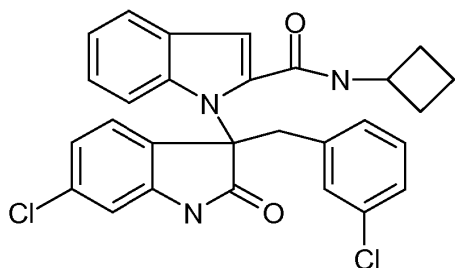
표제 화합물을 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 동일한 절차로써 제조했다.

<1712>

MS: 561(M+H)⁺.

<1713> 실시예 279

<1714> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



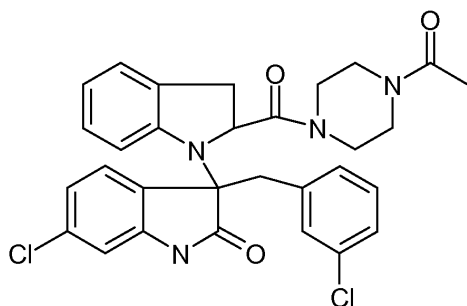
<1715> M. W 504.415 $C_{28}H_{23}Cl_2N_3O_2$

<1716> 표제 화합물을 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온과 동일한 절차로 제조했다.

<1717> MS: 504(M+H)⁺.

<1718> 실시예 280

<1719> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

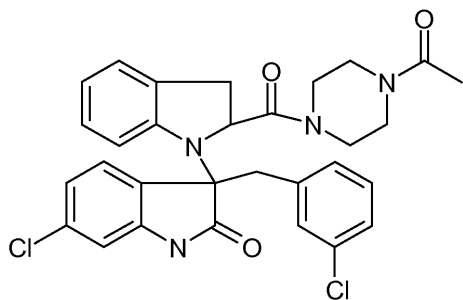


<1720> M. W 563.482 $C_{30}H_{28}Cl_2N_4O_3$

<1721> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 563(M+H)⁺.

<1722> 실시예 281

<1723> rac-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

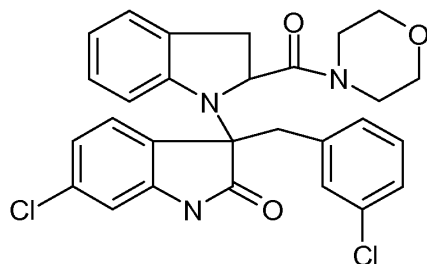


<1724> M. W 563.482 $C_{30}H_{28}Cl_2N_4O_3$

<1725> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 563(M+H)⁺.

<1726> 실시예 282

<1727> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

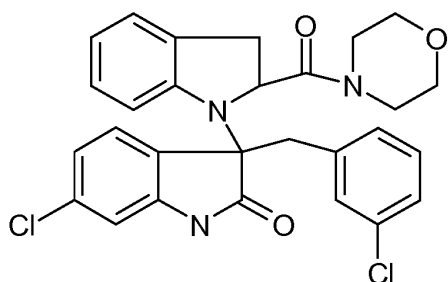


<1728> M. W 522.429 $C_{28}H_{25}Cl_2N_3O_3$

<1729> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 522(M+H)⁺.

<1730> 실시예 283

<1731> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-2,3,1',3'-테트라히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조



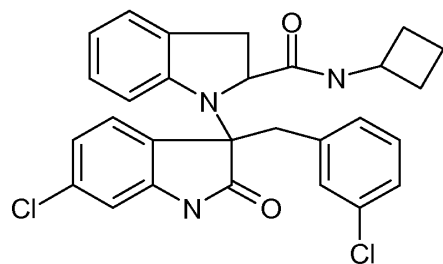
M. W 522.429 $C_{28}H_{25}Cl_2N_3O_3$

<1732>

<1733> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 522(M+H)⁺.

<1734> 실시예 284

<1735> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



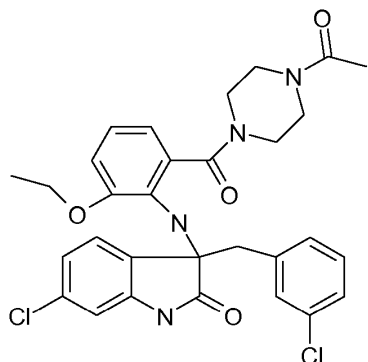
M. W 506.43 $C_{28}H_{25}Cl_2N_3O_2$

<1736>

<1737> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 하여 제조했다. MS: 506(M+H)⁺.

<1738> 실시예 285

<1739> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-에톡시-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

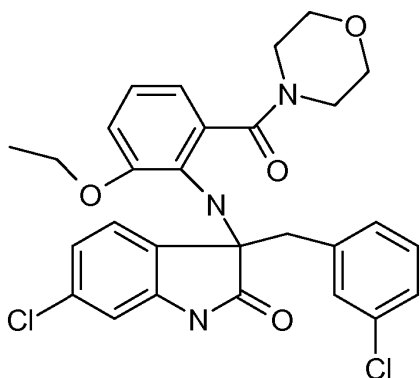


<1740> M. W 581.497 $C_{30}H_{30}Cl_2N_4O_4$

<1741> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 581(M+H)⁺.

<1742> 실시예 286

<1743> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-에톡시-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

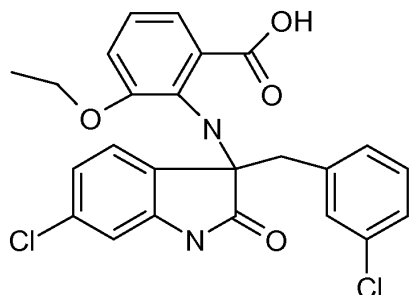


M. W 540.444 $C_{28}H_{27}Cl_2N_3O_4$

<1744> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 540(M+H)⁺.

<1746> 실시예 287

<1747> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산의 제조



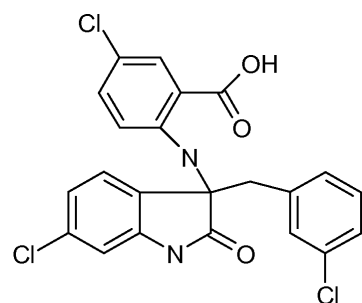
M. W 471.338 $C_{24}H_{20}Cl_2N_2O_4$

<1748>

<1749> 실온에서, 2-아미노-3-에톡시-벤조산 (0.59g, 3.26mmol), 3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (1.21g, 3.26mmol) 및 DIPEA (0.68ml) 를 약 6 ml CH_2Cl_2 중에 혼합했다. 하룻밤 교반 후, 용액을 농축하고 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제하여 400mg 고체의 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산을 수득했다. MS: 471(M+H)⁺.

<1750> 실시예 288

<1751> rac-5-클로로-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산의 제조



M. W 461.731 $C_{22}H_{15}Cl_3N_2O_3$

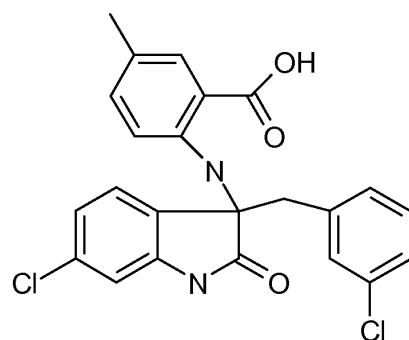
<1752>

<1753> 표제 화합물을 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1754> MS: 461(M+H)⁺.

<1755> 실시예 289

<1756> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-5-메틸-벤조산의 제조



M. W 441.312 $C_{23}H_{18}Cl_2N_2O_3$

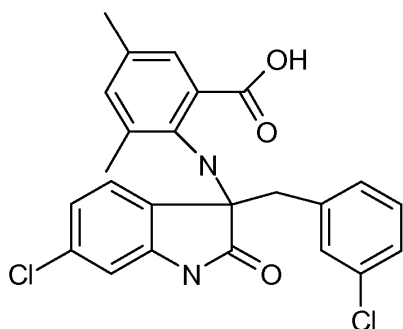
<1757>

<1758> 표제 화합물을 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1759> MS: 441(M+H)⁺.

<1760> 실시예 290

<1761> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3,5-디메틸-벤조산의 제조

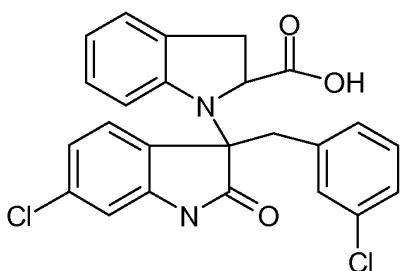


<1762> M. W 455.339 C₂₄H₂₀Cl₂N₂O₃

<1763> 표제 화합물을 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 455(M+H)⁺.

<1764> 실시예 291

<1765> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산의 제조



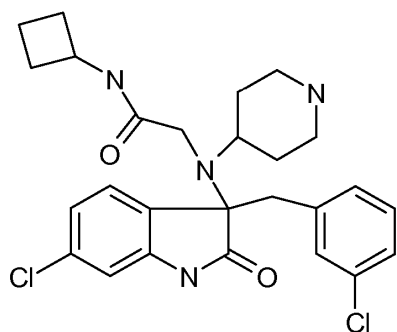
<1766> M. W 453.323 C₂₄H₁₈Cl₂N₂O₃

<1767> 표제 화합물을 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1768> MS: 453(M+H)⁺.

<1769> 실시예 292

<1770> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



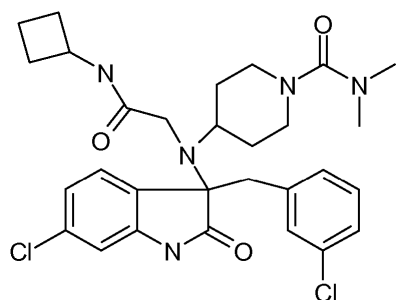
<1771> M. W 501.455 C₂₆H₃₀Cl₂N₄O₂

<1772> 실온에서, 4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (700mg, 1.17mmol) 을 CF₃COOH 및 CH₂Cl₂ 의 혼합 용액 중에서 용해했다. 0.5 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축 및 유기층을 NaOH 수용액으로 세정했다. 유기층을 건조, 농축시켜 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 200mg rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드를 수득했다.

<1773> MS: 501(M+H)⁺.

<1774> 실시예 293

<1775> rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드의 제조



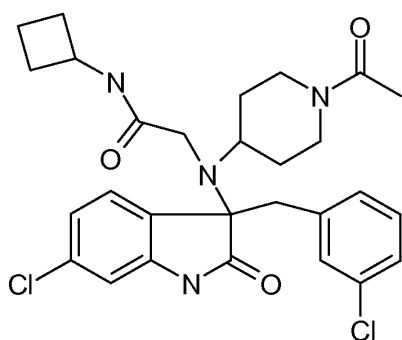
<1776> M. W 572.534 C₂₉H₃₅Cl₂N₅O₃

<1777> 실온에서, rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드 (77mg, 0.154mmol) 및 디메틸카르바미드 클로라이드 (14mg, 0.185mmol) 및 K₂CO₃ 를 약 2ml CH₂Cl₂ 중에서 혼합했다. 약 1 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축하고 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 20mg 고체의 rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드를 수득했다.

<1778> MS: 572(M+H)⁺.

<1779> 실시예 294

<1780> rac-2-{(1-아세틸-피페리딘-4-일)-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



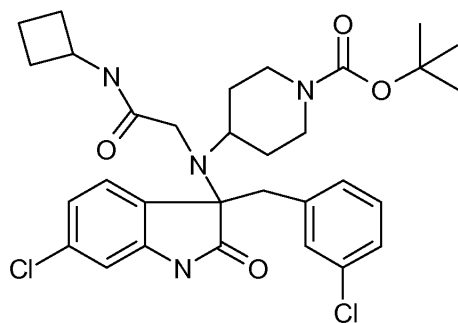
<1781> M. W 543.492 C₂₈H₃₂Cl₂N₄O₃

<1782> 표제 화합물을 rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 543(M+H)⁺.

<1783> 실시예 295

<1784> rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일메틸-아미노}-

피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



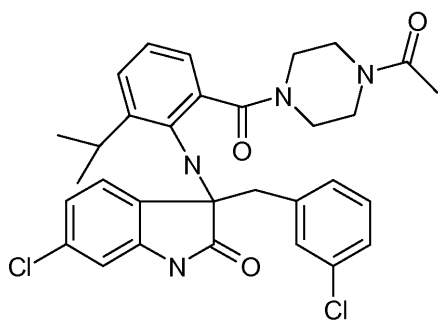
M. W 601.571 $C_{31}H_{38}Cl_2N_4O_4$

표제 화합물을 rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-에톡시-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

MS: 601(M+H)⁺.

실시예 296

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-6-이소프로필-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

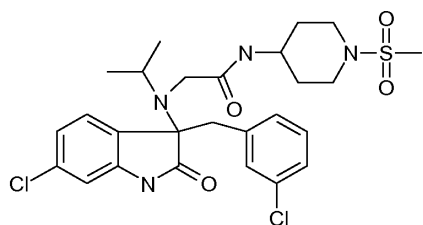


M. W 579.525 $C_{31}H_{32}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 579(M+H)⁺.

실시예 297

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노]-N-(1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드의 제조



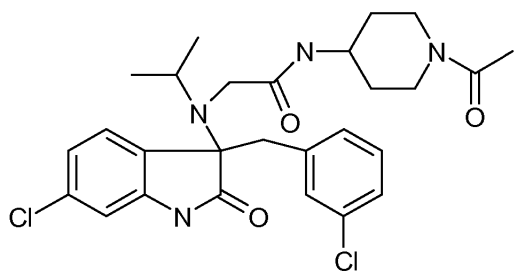
M. W 567.535 $C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_4S$

표제 화합물을 rac-4-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일 메틸-아미노]-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

MS: 567(M+H)⁺.

<1797> 실시예 298

<1798> rac-N-(1-아세틸-피페리딘-4-일)-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트아미드의 제조



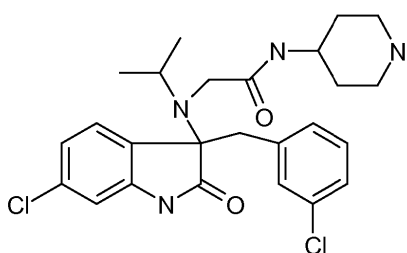
<1799> M. W 531.481 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<1800> 표제 화합물을 rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일 메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1801> MS: 531(M+H)⁺.

<1802> 실시예 299

<1803> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-피페리딘-4-일-아세트아미드의 제조

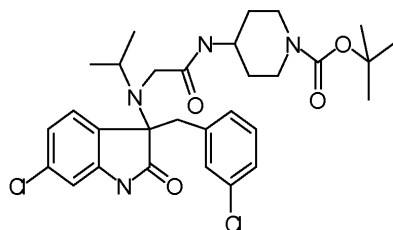


<1804> M. W 489.444 $C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_2$

<1805> 표제 화합물을 rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-4-일-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 489(M+H)⁺.

<1806> 실시예 300

<1807> rac-4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸아미노)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조

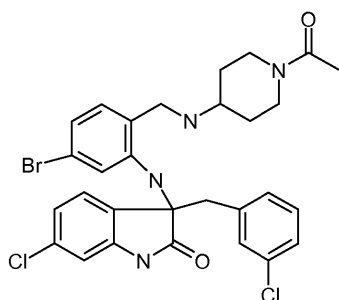


<1808> M. W 589.56 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_4$

<1809> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 589(M+H)⁺.

<1810> 실시예 301

<1811> rac-3-{2-[(1-아세틸-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-5-브로모-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



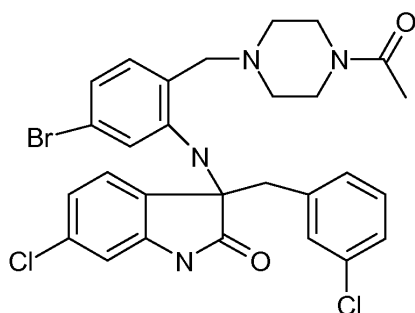
<1812> M. W 616.384 $C_{29}H_{29}BrCl_2N_4O_2$

<1813> 표제 화합물을 rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일 메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1814> MS: 615(M+H)⁺.

<1815> 실시예 302

<1816> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



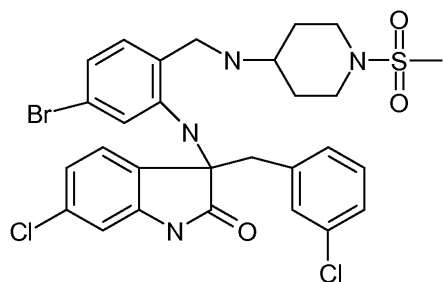
<1817> M. W 602.357 $C_{28}H_{27}BrCl_2N_4O_2$

<1818> 실온에서, 3-(5-브로모-2-히드록시메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (100mg, 0.137mmol) 을 2ml 건조된 CH_2Cl_2 중에서 용해했다. 그 다음, $SOCl_2$ (49mg, 0.333mmol) 를 서서히 첨가했다. 약 30 분 동안 교반한 후, K_2CO_3 (84mg, 0.612mmol) 및 1-피페라진-1-일-에탄논 (32mg, 0.245mmol) 을 첨가했다. 상기 용액을 약 2 시간 교반한 다음, 용액을 농축하고 미정제 생성물을 제조용 HPLC 로 정제해 7mg 백색 고체 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 수득했다.

<1819> MS: 601(M+H)⁺.

<1820> 실시예 303

<1821> rac-3-{5-브로모-2-[(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W 652.438 $C_{28}H_{29}BrCl_2N_4O_3S$

<1822>

<1823>

표제 화합물을 rac-4-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸카르바모일 메틸-아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1824>

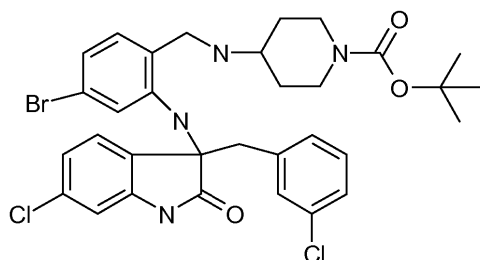
MS: 651(M+H)⁺.

<1825>

실시예 304

<1826>

rac-4-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노}-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W 674.464 $C_{32}H_{35}BrCl_2N_4O_3$

<1827>

<1828>

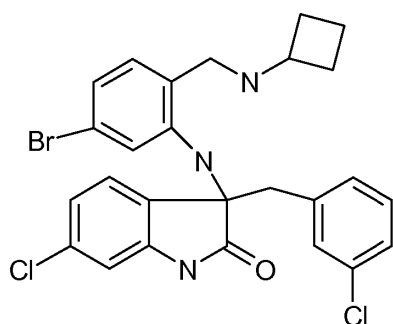
표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일 메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 673(M+H)⁺.

<1829>

실시예 305

<1830>

rac-3-(5-브로모-2-시클로부틸아미노 메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W 545.306 $C_{26}H_{24}BrCl_2N_3O$

<1831>

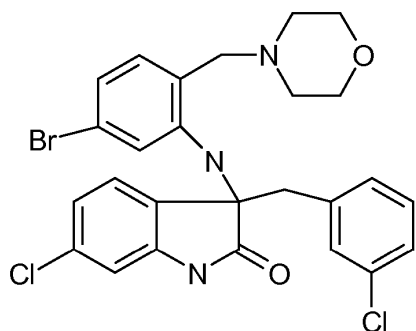
<1832>

표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일 메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 544(M+H)⁺.

<1833>

실시예 306

<1834> rac-3-(5-브로모-2-모르폴린-4-일메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



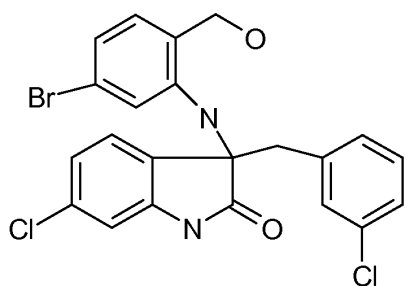
M. W 561.305 $C_{26}H_{24}BrCl_2N_3O_2$

<1835>

<1836> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $560(M+H)^+$.

<1837> 실시예 307

<1838> rac-3-(5-브로모-2-히드록시메틸-페닐아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W 492.198 $C_{22}H_{17}BrCl_2N_2O_2$

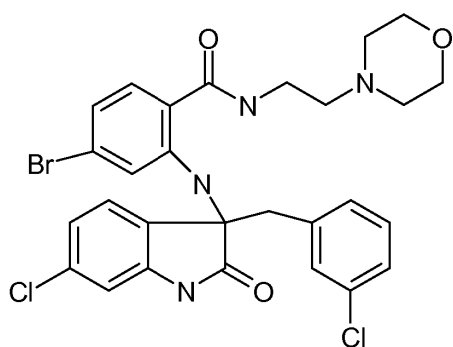
<1839>

<1840> 표제 화합물을 고체 rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세트산 에틸 에스테르에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1841> MS: $491(M+H)^+$.

<1842> 실시예 308

<1843> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-모르폴린-4-일-에틸)-벤즈아미드의 제조



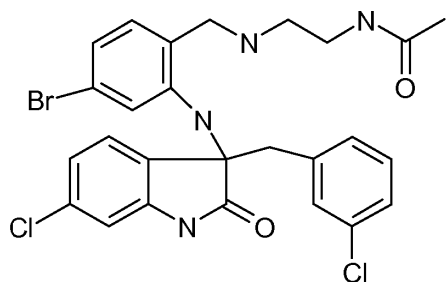
M. W 618.356 $C_{28}H_{27}BrCl_2N_4O_3$

<1844>

<1845> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $617(M+H)^+$.

<1846> 실시예 309

<1847> rac-N-(2-(4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤질아미노)-에틸)-아세트아미드의 제조

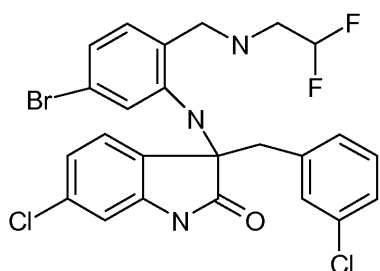


<1848> M. W 576.319 $C_{26}H_{25}BrCl_2N_4O_2$

<1849> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 575(M+H)⁺.

<1850> 실시예 310

<1851> rac-3-{5-브로모-2-[(2,2-디플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



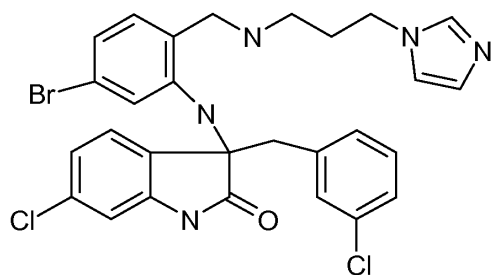
<1852> M. W 555.248 $C_{24}H_{20}BrCl_2F_2N_3O$

<1853> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1854> MS: 554(M+H)⁺.

<1855> 실시예 311

<1856> rac-3-{5-브로모-2-[(3-이미다졸-1-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



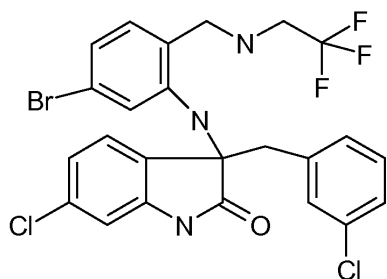
<1857> M. W 599.357 $C_{28}H_{26}BrCl_2N_5O$

<1858> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1859> MS: 598(M+H)⁺.

<1860> 실시예 312

<1861> rac-3-{5-브로모-2-[(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W 573.238 C₂₄H₁₉BrCl₂F₃N₃O

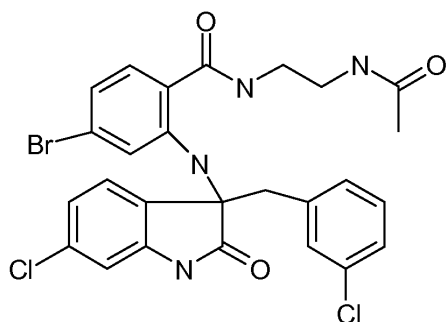
<1862>

<1863> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1864> MS: 572(M+H)⁺.

<1865> 실시예 313

<1866> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드의 제조



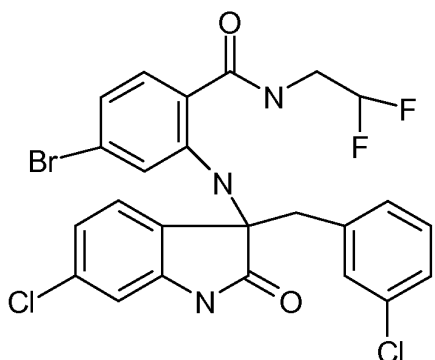
M. W 590.303 C₂₆H₂₃BrCl₂N₄O₃

<1867>

<1868> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 589(M+H)⁺.

<1869> 실시예 314

<1870> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2-디플루오로-에틸)-벤즈아미드의 제조



M. W 569.231 $C_{24}H_{18}BrCl_2F_2N_3O_2$

<1871>

<1872>

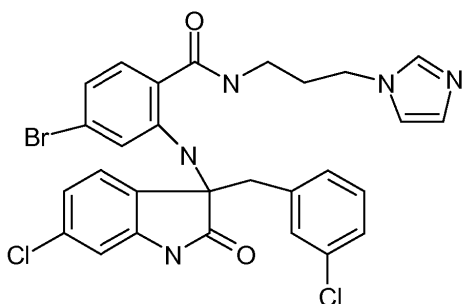
표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 568(M+H)⁺.

<1873>

실시예 315

<1874>

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드의 제조



M. W 613.341 $C_{28}H_{24}BrCl_2N_5O_2$

<1875>

<1876>

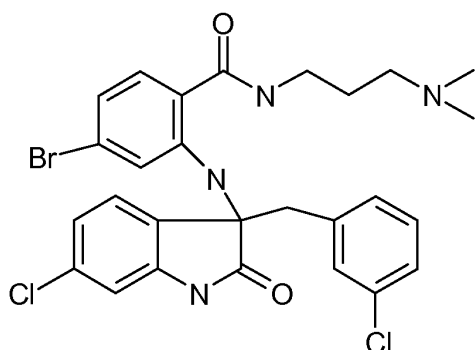
표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 612(M+H)⁺.

<1877>

실시예 316

<1878>

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드의 제조



M. W 590.346 $C_{27}H_{27}BrCl_2N_4O_2$

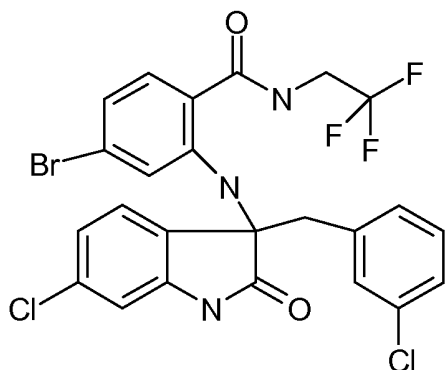
<1879>

<1880>

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 589(M+H)⁺.

<1881> 실시예 317

<1882> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-벤즈아미드의 제조



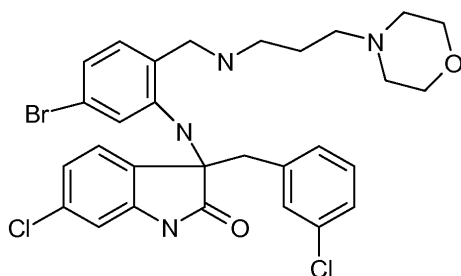
M. W 587.221 $C_{24}H_{17}BrCl_2F_3N_3O_2$

<1883>

<1884> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 586(M+H)⁺.

<1885> 실시예 318

<1886> rac-3-{5-브로모-2-[(3-모르폴린-4-일-프로필아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<1887> M. W 618.4 $C_{29}H_{31}BrCl_2N_4O_2$

<1888> 표제 화합물을 rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-일메틸)-5-브로모-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1889> MS: 617(M+H)⁺.

<1890> 실시예 319

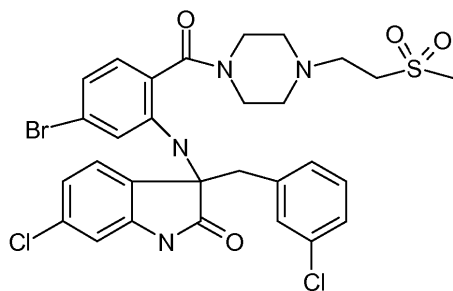
<1891> rac-3-{5-브로모-2-[(2-모르폴린-4-일-에틸아미노)-메틸]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

<1892>

<1893>

<1894>

<1895>

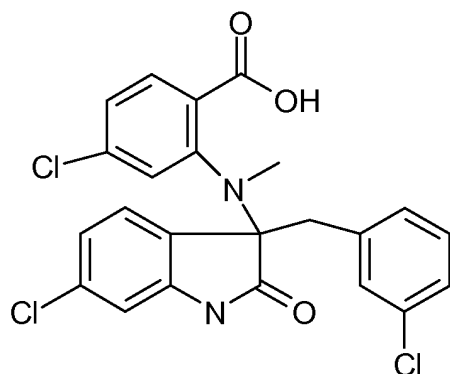


<1896>

<1897>

<1898>

<1899>



<1900>

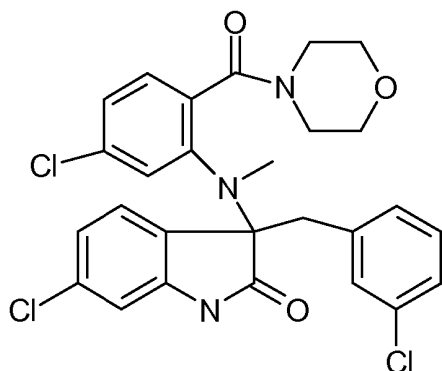
$\langle 1901 \rangle$

노}-벤조산을 수득했다.

<1902> MS: 475(M+H)⁺.

<1903> 실시예 322

<1904> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-([5-클로로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐]-메틸-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

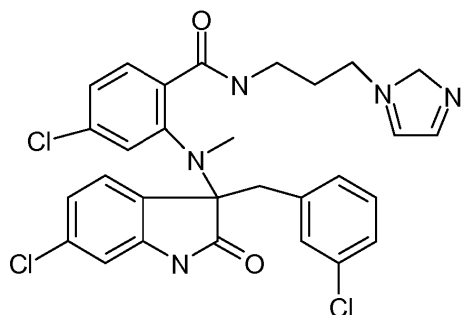


<1905> M. W 544.864 C₂₇H₂₄Cl₃N₃O₃

<1906> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 544(M+H)⁺.

<1907> 실시예 323

<1908> rac-4-클로로-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노)-N-(3-이미다졸-1-일-프로필)-벤즈아미드의 제조

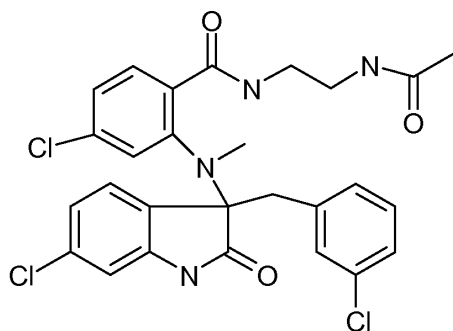


<1909> M. W 582.916 C₂₉H₂₈Cl₃N₅O₂

<1910> 표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 582(M+H)⁺.

<1911> 실시예 324

<1912> rac-N-(2-아세틸아미노-에틸)-4-클로로-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노)-벤즈아미드의 제조

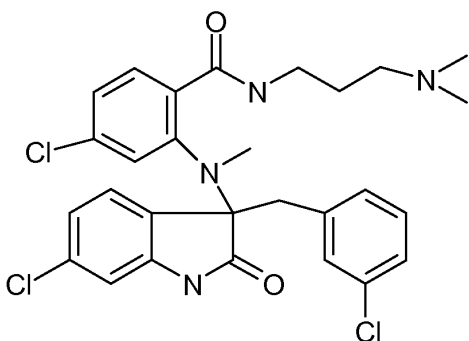


M. W 559.879 $C_{27}H_{25}Cl_3N_4O_3$

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 559(M+H)⁺.

실시예 325

rac-4-클로로-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-메틸-아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드의 제조

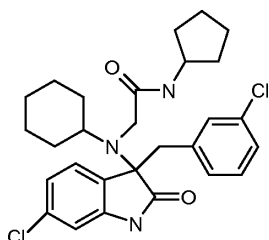


M. W 559.922 $C_{28}H_{29}Cl_3N_4O_2$

표제 화합물을 rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3-클로로-페닐)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 559(M+H)⁺.

실시예 326

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노]-N-시클로헥틸-아세트아미드의 제조

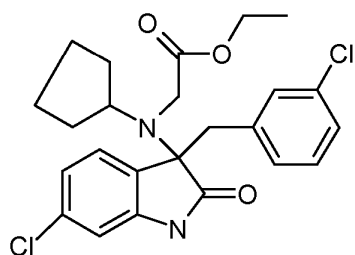


M. W. 514.50 $C_{28}H_{33}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-[[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

실시예 327

<1924> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵탈-아미노}-아세트산 에틸 에스테르의 제조



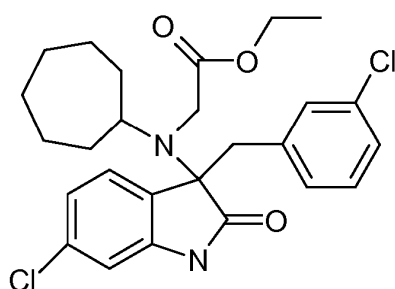
<1925> M. W. 461.39 $C_{24}H_{26}Cl_2N_2O_3$

<1926> 표제 화합물을 rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<1927> MS: 461 (M+H)⁺.

<1928> 실시예 328

<1929> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헵탈-아미노}-아세트산 에틸 에스테르의 제조

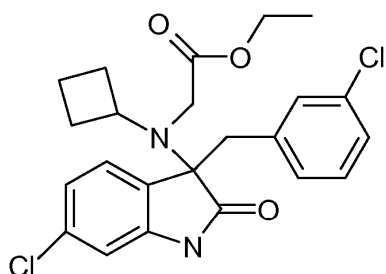


<1930> M. W. 489.45 $C_{26}H_{30}Cl_2N_2O_3$

<1931> 표제 화합물을 rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 489 (M+H)⁺.

<1932> 실시예 329

<1933> rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-아세트산 에틸 에스테르의 제조

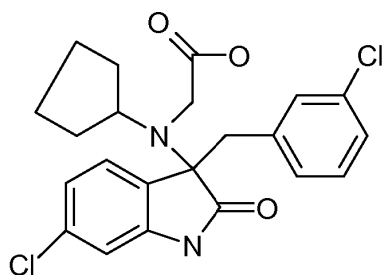


<1934> M. W. 447.37 $C_{23}H_{24}Cl_2N_2O_3$

<1935> 표제 화합물을 rac-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산 에틸 에스테르에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 447 (M+H)⁺.

<1936> 실시예 330

<1937> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노}-아세트산의 제조



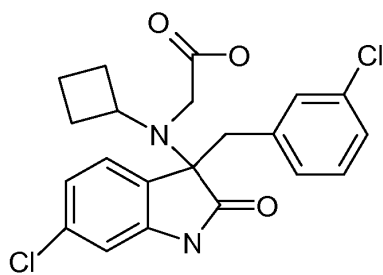
M. W. 433.34 $C_{22}H_{22}Cl_2N_2O_3$

<1938>

<1939> 표제 화합물을 rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 433 (M+H)⁺.

<1940> 실시예 331

<1941> rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-아세트산의 제조



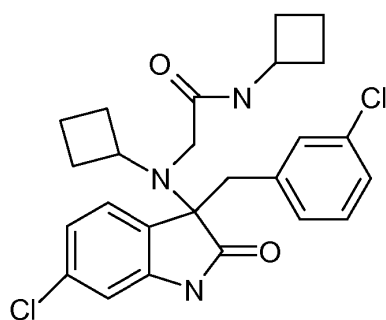
M. W. 461.39 $C_{24}H_{26}Cl_2N_2O_3$

<1942>

<1943> 표제 화합물을 rac-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 461 (M+H)⁺.

<1944> 실시예 332

<1945> rac-2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 472.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_2$

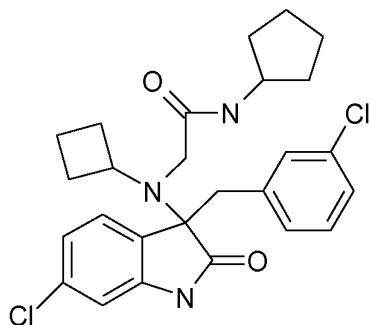
<1946>

<1947> 표제 화합물을 rac-3-{{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 472 (M+H)⁺.

<1948> 실시예 333

<1949> rac-2-{{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-N-시클로펜틸-아

세트아미드의 제조



M. W. 486.45 $C_{26}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<1950>

<1951>

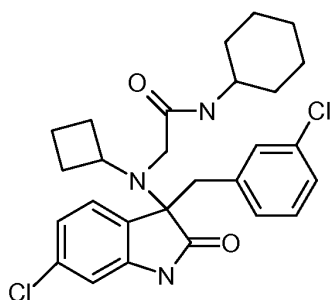
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 486 (M+H)⁺.

<1952>

실시예 334

<1953>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조



M. W. 500.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1954>

<1955>

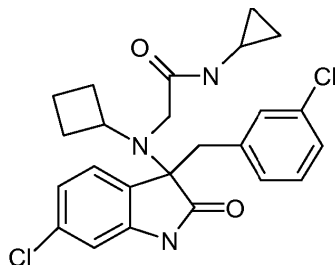
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 500 (M+H)⁺.

<1956>

실시예 335

<1957>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드의 제조



M. W. 458.39 $C_{24}H_{25}Cl_2N_3O_2$

<1958>

<1959>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 458 (M+H)⁺.

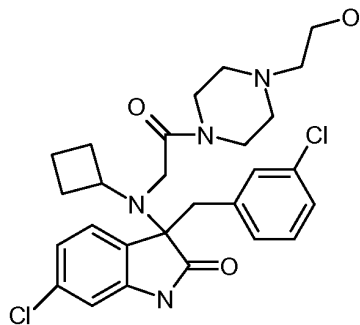
<1960>

실시예 336

<1961>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로부틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)

-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

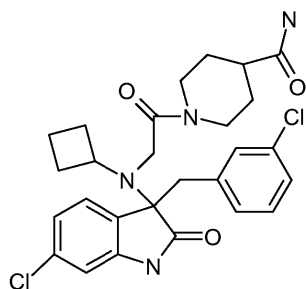


M. W. 531.49 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 531 (M+H)⁺.

실시예 337

rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로부틸-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아마이드의 제조

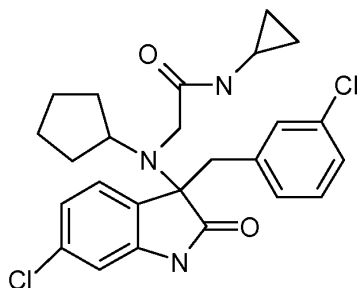


M. W. 529.47 $C_{27}H_{30}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 529 (M+H)⁺.

실시예 338

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드의 제조



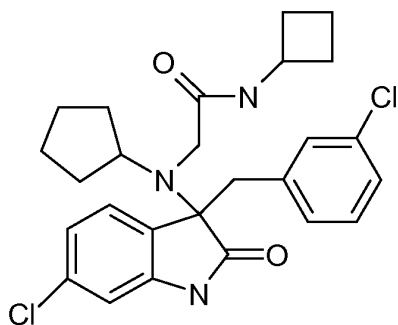
M. W. 472.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 472 (M+H)⁺.

실시예 339

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노}-N-시클로부틸-아

세트아미드의 제조



M. W. 486.45 $C_{26}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<1973>

<1974>

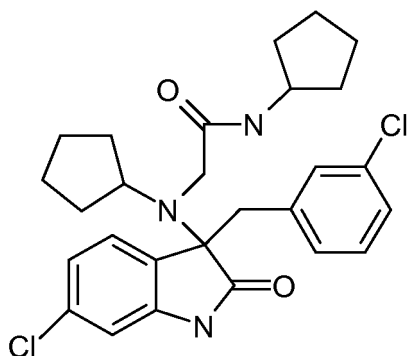
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 486 (M+H)⁺.

<1975>

실시예 340

<1976>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노}-N-시클로펜틸-아세트아미드의 제조



M. W. 500.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1977>

<1978>

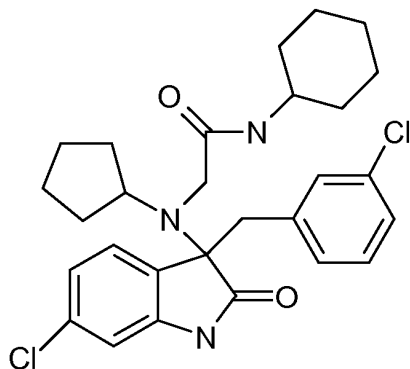
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 500 (M+H)⁺.

<1979>

실시예 341

<1980>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로펜틸-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조



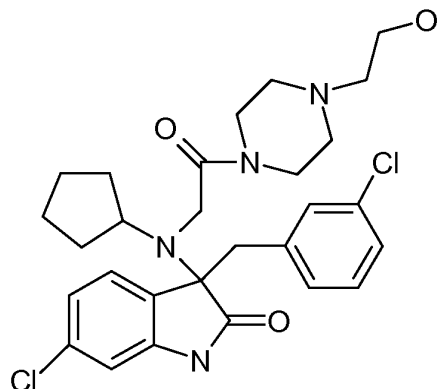
M. W. 500.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1981>

<1982> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 500 (M+H)⁺.

<1983> 실시예 342

<1984> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥틸-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

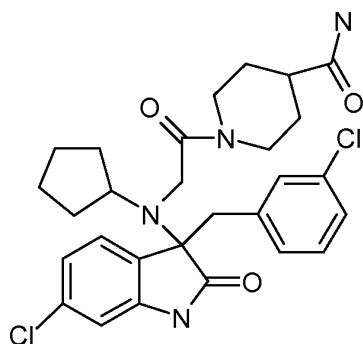


<1985> M. W. 545.51 C₂₈H₃₄Cl₂N₄O₃

<1986> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 545 (M+H)⁺.

<1987> 실시예 343

<1988> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아마이드의 제조

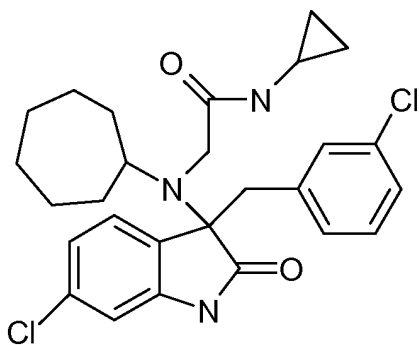


<1989> M. W. 543.50 C₂₈H₃₂Cl₂N₄O₃

<1990> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 543 (M+H)⁺.

<1991> 실시예 344

<1992> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노}-N-시클로프로필-아세트아미드의 제조



M. W. 500.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<1993>

<1994>

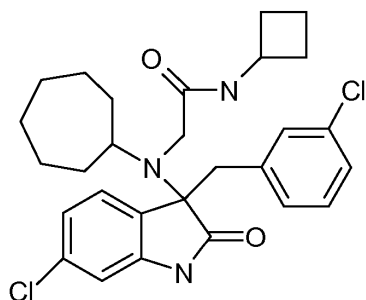
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 500(M+H)⁺.

<1995>

실시예 345

<1996>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 514.50 $C_{28}H_{33}Cl_2N_3O_2$

<1997>

<1998>

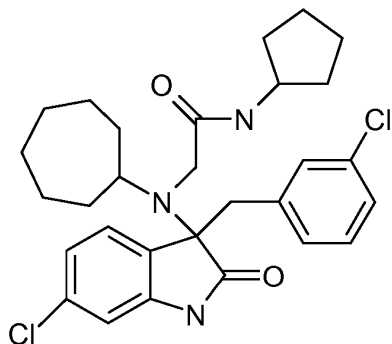
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 절차와 동일한 절차로써 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

<1999>

실시예 346

<2000>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노}-N-시클로펜틸-아세트아미드의 제조



M. W. 528.53 $C_{29}H_{35}Cl_2N_3O_2$

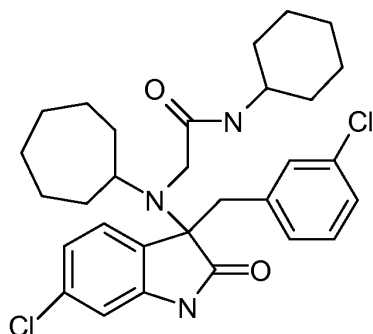
<2001>

<2002>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 528 (M+H)⁺.

<2003> 실시예 347

<2004> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조

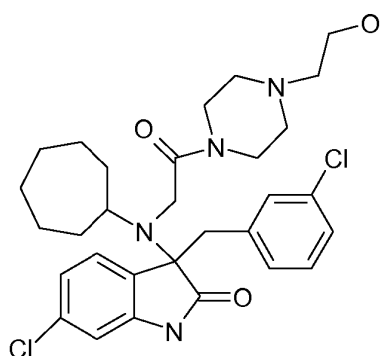


<2005> M. W. 542.55 $C_{30}H_{37}Cl_2N_3O_2$

<2006> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 542 (M+H)⁺.

<2007> 실시예 348

<2008> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(시클로헥실-{2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

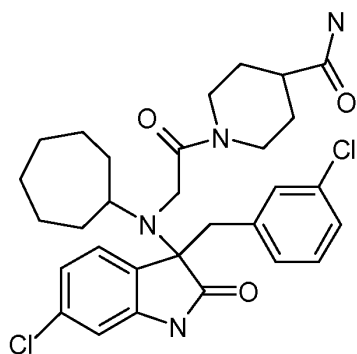


<2009> M. W. 573.57 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

<2010> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 573 (M+H)⁺.

<2011> 실시예 349

<2012> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 아미드의 제조



M. W. 571.55 $C_{30}H_{36}Cl_2N_4O_3$

<2013>

<2014>

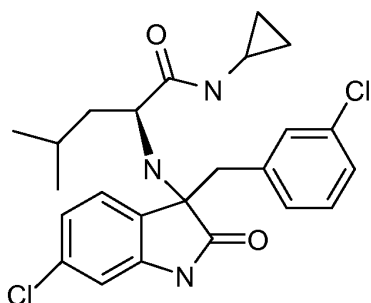
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 571 (M+H)⁺.

<2015>

실시예 350

<2016>

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-2,4-디메틸-펜탄산 시클로프로필아미드의 제조



M. W. 474.43 $C_{25}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<2017>

<2018>

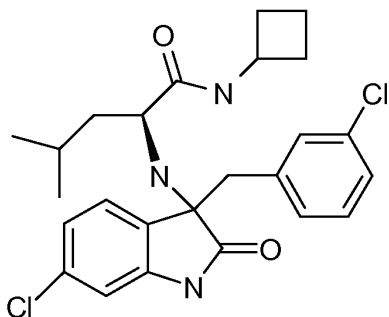
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 474 (M+H)⁺.

<2019>

실시예 351

<2020>

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로부틸아미드의 제조



M. W. 488.46 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<2021>

<2022>

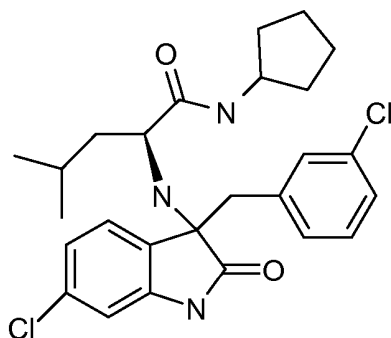
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488 (M+H)⁺.

<2023>

실시예 352

<2024>

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로펜틸아미드의 제조



<2025>

M. W. 502.49 $C_{27}H_{33}Cl_2N_3O_2$

<2026>

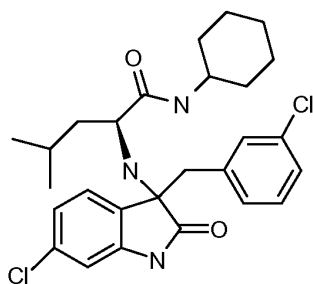
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 502 (M+H)⁺.

<2027>

실시예 353

<2028>

rac-(S)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-메틸-펜탄산 시클로헥실아미드의 제조



<2029>

M. W. 516.52 $C_{28}H_{35}Cl_2N_3O_2$

<2030>

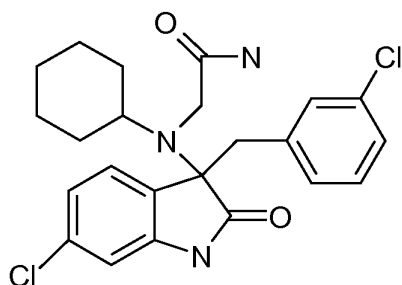
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 516 (M+H)⁺.

<2031>

실시예 354

<2032>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트아미드의 제조



<2033>

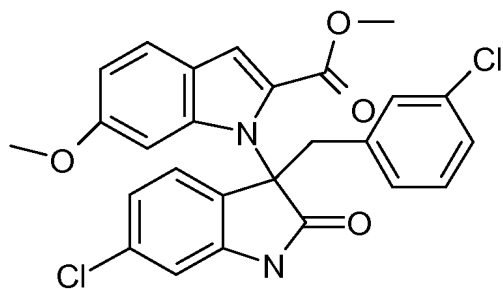
M. W. 446.38 $C_{23}H_{25}Cl_2N_3O_2$

<2034>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 446 (M+H)⁺.

<2035> 실시예 355

<2036> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 메틸 에스테르의 제조



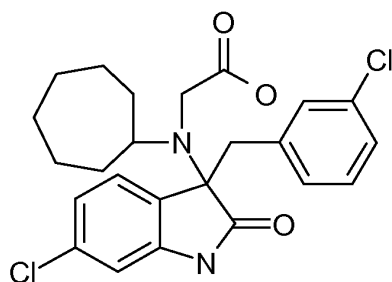
<2037>

<2038> M. W. 495.37 $C_{26}H_{20}Cl_2N_2O_4$

<2039> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 메틸 에스테르 (0.65g, 1.31mmol) 의 10mL 톨루엔 중 용액에, DDQ(0.51g, 2.23mmol) 를 첨가했다. 반응 혼합물을 실온에서 6 시간 교반했다. 그리고, 혼합물을 물 (3 x 10 mL) 로 세정했다. 유기 용액을 Na_2SO_4 로 건조 및 진공 하 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 백색 고체를 수득했다. MS: 495 (M+H)⁺.

<2040> 실시예 356

<2041> rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노)-아세트산의 제조

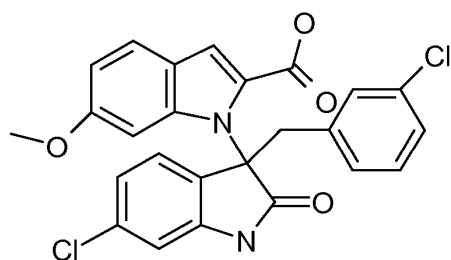


<2042> M. W. 460.13 $C_{24}H_{26}Cl_2N_2O_3$

<2043> 표제 화합물을 rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노)-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 461(M+H)⁺.

<2044> 실시예 357

<2045> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산의 제조



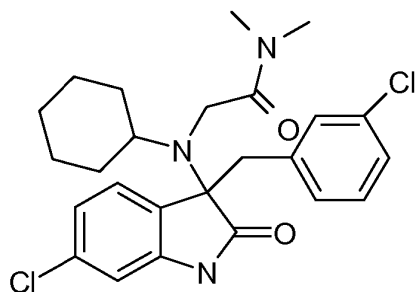
<2046> M. W. 481.34 $C_{25}H_{18}Cl_2N_2O_4$

<2047> 표제 화합물을 rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥틸-아미노)-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 481(M+H)⁺.

트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 481 (M+H)⁺.

<2048> 실시예 358

<2049> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N,N-디메틸-아세트아미드의 제조

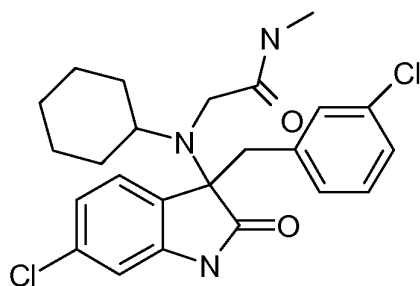


<2050> M. W. 474.43 C₂₅H₂₉Cl₂N₃O₂

<2051> 표제 화합물을 rac-3-([2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 474 (M+H)⁺.

<2052> 실시예 359

<2053> rac-2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-N-메틸-아세트아미드의 제조

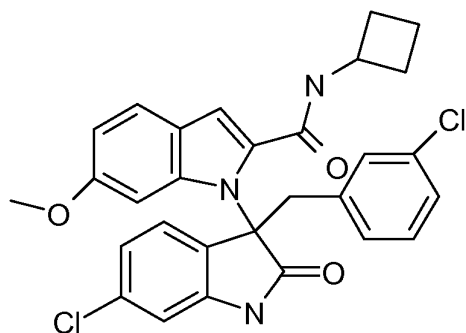


<2054> M. W. 460.41 C₂₄H₂₇Cl₂N₃O₂

<2055> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(4-프로폭시-페닐아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 460 (M+H)⁺.

<2056> 실시예 360

<2057> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로부틸아미드의 제조

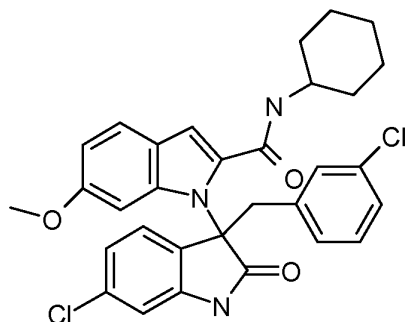


<2058> M. W. 534.45 C₂₉H₂₅Cl₂N₃O₃

<2059> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 534 (M+H)⁺.

<2060> 실시예 361

<2061> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산 시클로헥실아미드의 제조



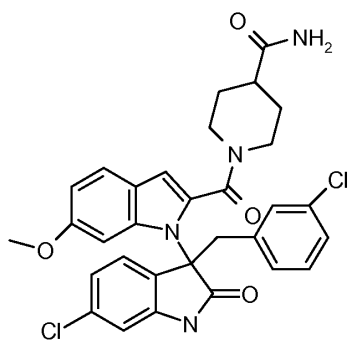
M. W. 562.50 $C_{31}H_{29}Cl_2N_3O_3$

<2062>

<2063> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 562 (M+H)⁺.

<2064> 실시예 362

<2065> rac-1-[6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2',3'-디히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르보닐]-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조



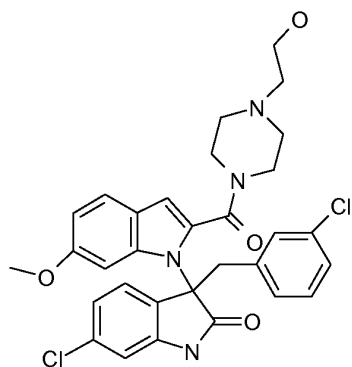
M. W. 591.50 $C_{31}H_{28}Cl_2N_4O_4$

<2066>

<2067> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 591 (M+H)⁺.

<2068> 실시예 363

<2069> rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-2-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-6-메톡시-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

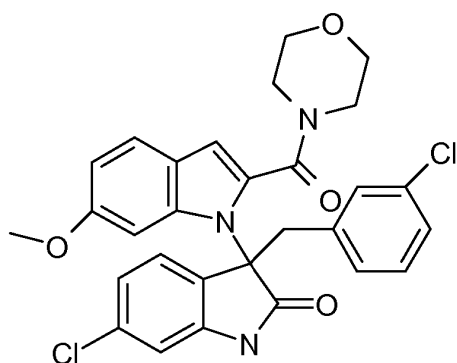


M. W. 593.52 $C_{31}H_{30}Cl_2N_4O_4$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 593 (M+H)⁺.

실시예 364

rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2-(모르폴린-4-카르보닐)-1',3'-디히드로-[1,3']바이인돌릴-2'-온의 제조

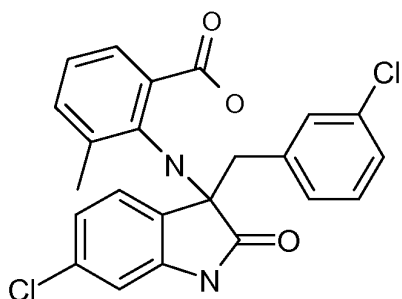


M. W. 550.45 $C_{29}H_{25}Cl_2N_3O_4$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 550 (M+H)⁺.

실시예 365

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-3-메틸-벤조산의 제조

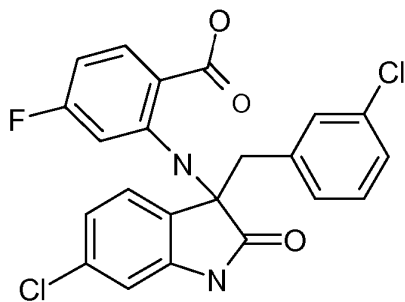


M. W. 441.32 $C_{23}H_{18}Cl_2N_2O_3$

표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 441 (M+H)⁺.

<2080> 실시예 366

<2081> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-플루오로-벤조산의 제조



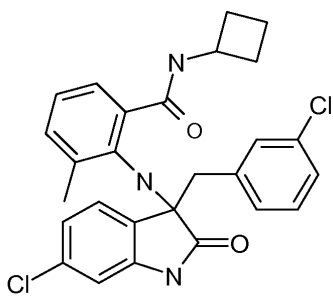
M. W. 445.28 $C_{22}H_{15}Cl_2N_2O_3$

<2082>

<2083> 표제 화합물을 rac-3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산에 대한 질차와 동일한 질차로 제조했다. MS: 445 (M+H)⁺.

<2084> 실시예 367

<2085> rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-3-메틸-벤즈아미드의 제조



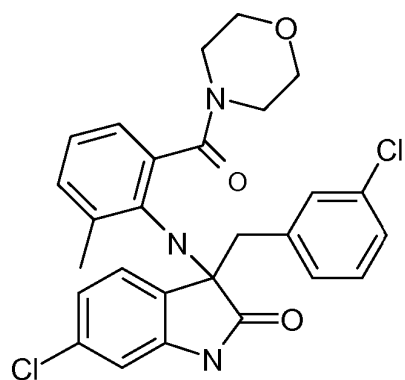
M. W. 494.43 $C_{27}H_{25}Cl_2N_3O_2$

<2086>

<2087> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 질차와 동일한 질차로 제조했다. MS: 494 (M+H)⁺.

<2088> 실시예 368

<2089> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[2-메틸-6-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 510.42 $C_{27}H_{25}Cl_2N_3O_3$

<2090>

<2091> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

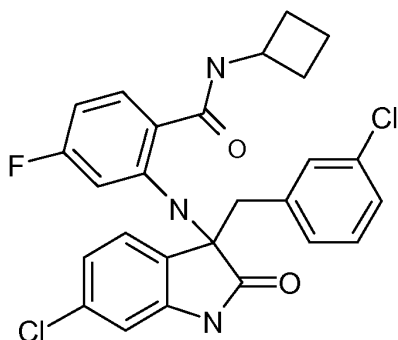
질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 510 (M+H)⁺.

<2092>

실시예 369

<2093>

rac-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-시클로부틸-4-플루오로-벤즈아미드의 제조



<2094>

M. W. 498.39

C₂₆H₂₂Cl₂FN₃O₂

<2095>

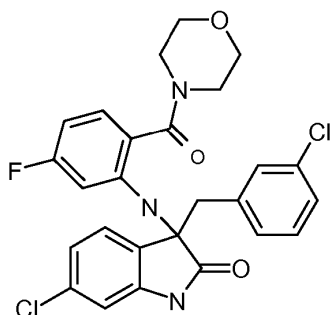
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 498(M+H)⁺.

<2096>

실시예 370

<2097>

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-플루오로-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<2098>

M. W. 514.39

C₂₆H₂₂Cl₂FN₃O₂

<2099>

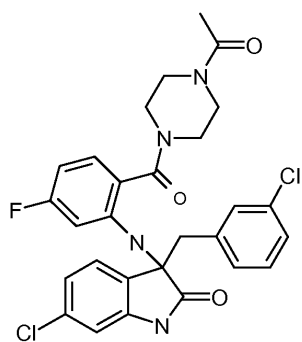
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

<2100>

실시예 371

<2101>

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-플루오로-페닐아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 555.44

$C_{28}H_{25}Cl_2FN_4O_3$

<2102>

<2103>

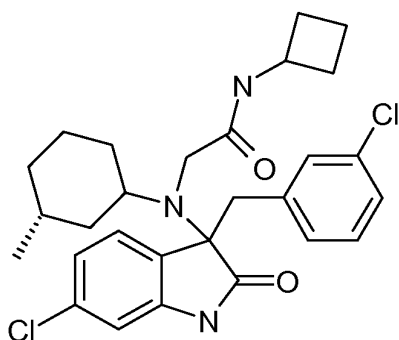
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 555 (M+H)⁺.

<2104>

실시예 372

<2105>

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 514.50

$C_{28}H_{33}Cl_2N_3O_2$

<2106>

<2107>

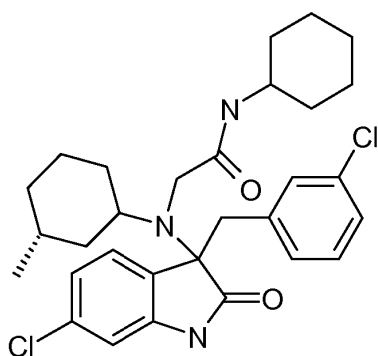
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

<2108>

실시예 373

<2109>

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조



M. W. 542.55

$C_{30}H_{37}Cl_2N_3O_2$

<2110>

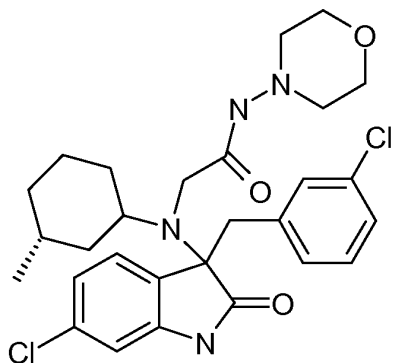
<2111>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 542 (M+H)⁺.

<2112> 실시예 374

<2113> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-모르폴린-4-일-아세트아미드의 제조

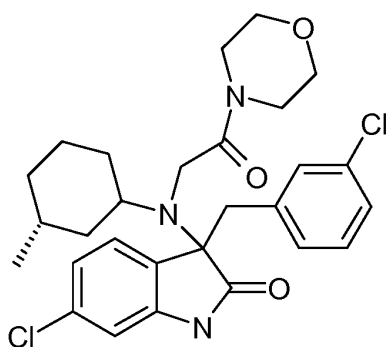


<2114> M. W. 545.51 C₂₈H₃₄Cl₂N₂O₃

<2115> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 545 (M+H)⁺.

<2116> 실시예 375

<2117> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(R)-3-메틸-시클로헥실)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

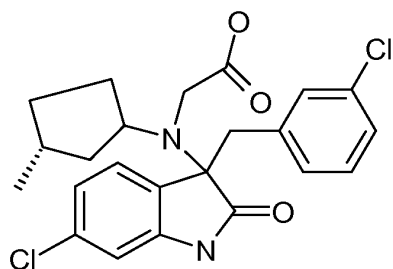


<2118> M. W. 530.50 C₂₈H₃₃Cl₂N₃O₃

<2119> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 530 (M+H)⁺.

<2120> 실시예 376

<2121> rac-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로헥실)-아미노]-아세트산의 제조

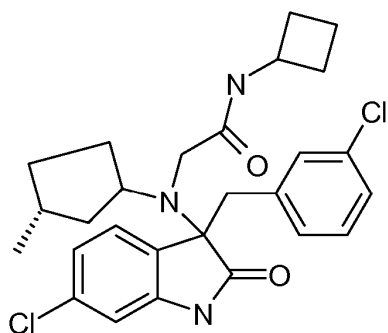


M. W. 447.37 $C_{23}H_{24}Cl_2N_2O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노}-아세트산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 447 (M+H)⁺.

실시예 377

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

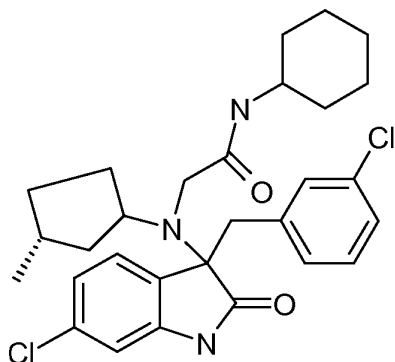


M. W. 500.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 500 (M+H)⁺.

실시예 378

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-시클로헥실-아세트아미드의 제조

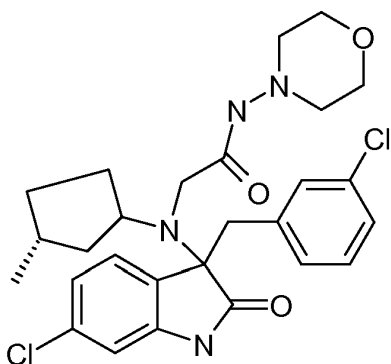


M. W. 528.53 $C_{29}H_{35}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 528 (M+H)⁺.

실시예 379

<2133> rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-((R)-3-메틸-시클로펜틸)-아미노]-N-모르폴린-4-일-아세트아미드의 제조

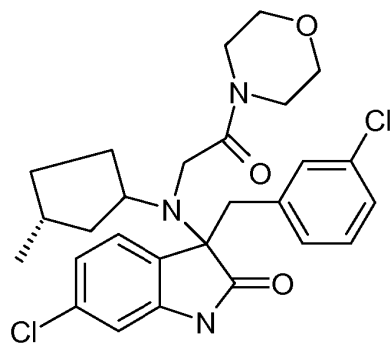


<2134> M. W. 531.49 $C_{27}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<2135> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 531 (M+H)⁺.

<2136> 실시예 380

<2137> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[[((R)-3-메틸-시클로펜틸)-(2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

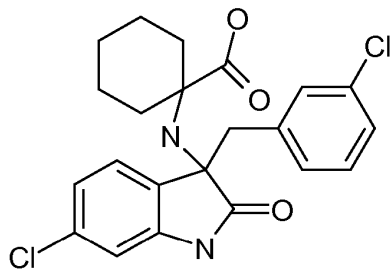


<2138> M. W. 516.47 $C_{27}H_{31}Cl_2N_3O_3$

<2139> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 516(M+H)⁺.

<2140> 실시예 381

<2141> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산의 제조



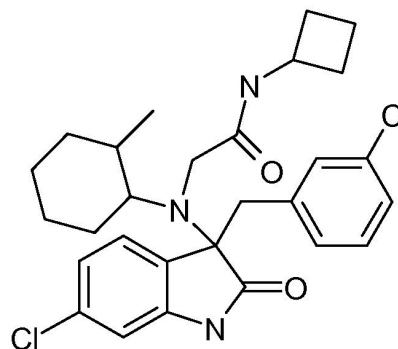
<2142> M. W. 433.34 $C_{22}H_{22}Cl_2N_2O_3$

<2143> 표제 화합물을 rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-피페리딘-3-카르복실산에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<2144> MS: 433 (M+H)⁺.

<2145> 실시예 382

<2146> rac2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2-메틸-시클로헥실)-아미노]-N-시클



M. W. 514.50

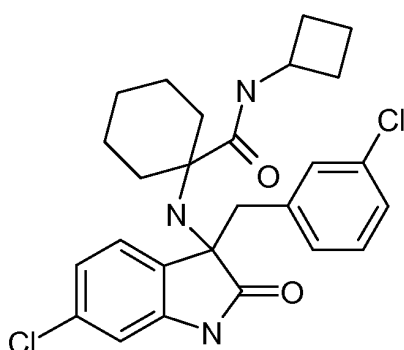
C₂₈H₃₃Cl₂N₃O₂

로부틸-아세트아미드의 제조

<2147> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 514 (M+H)⁺.

<2148> 실시예 383

<2149> rac-1-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-시클로헥산카르복실산 시클로부틸아미드의 제조



M. W. 486.45

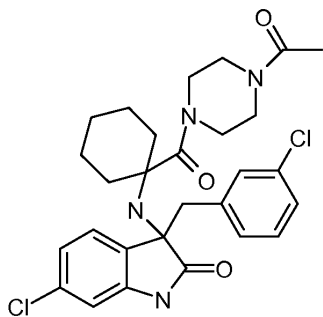
C₂₆H₂₉Cl₂N₃O₂

<2150>

<2151> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 486 (M+H)⁺.

<2152> 실시예 384

<2153> rac3-[1-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-시클로헥실아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 543.50 $C_{28}H_{32}Cl_2N_4O_3$

<2154>

<2155>

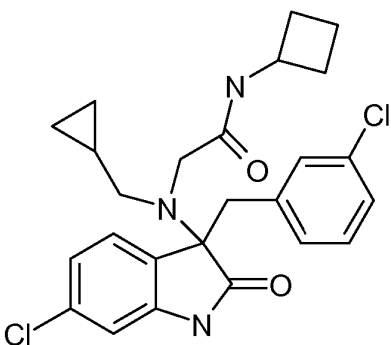
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 543 (M+H)⁺.

<2156>

실시예 385

<2157>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로프로필메틸-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 472.42 $C_{25}H_{27}Cl_2N_3O_2$

<2158>

<2159>

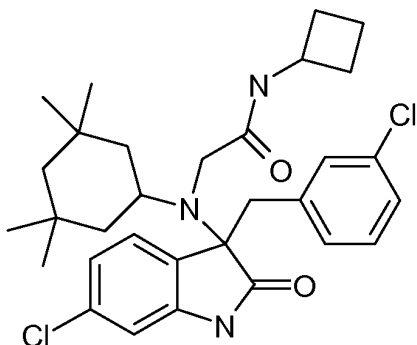
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 472 (M+H)⁺.

<2160>

실시예 386

<2161>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(3,3,5,5-테트라메틸-시클로헥실)-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 556.58 $C_{31}H_{39}Cl_2N_3O_2$

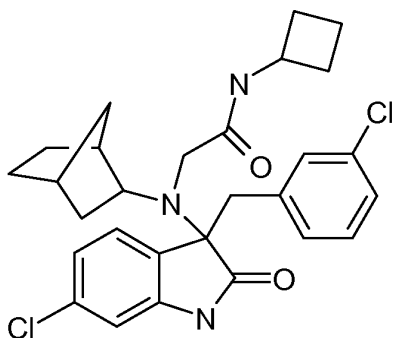
<2162>

<2163>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 556 (M+H)⁺.

<2164> 실시예 387

<2165> rac-2-[(R)-바이시클로[2.2.1]헵트-2-일-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

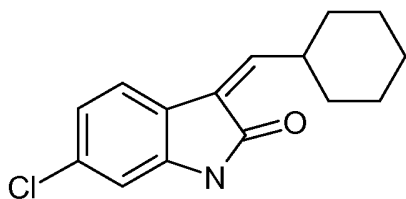


<2166> M. W. 512.48 $C_{28}H_{31}Cl_2N_3O_2$

<2167> 표제 화합물을 rac-3-[[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 512 (M+H)⁺.

<2168> 실시예 388a

<2169> 중간체 E/Z-6-클로로-3-시클로헥실메틸렌-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

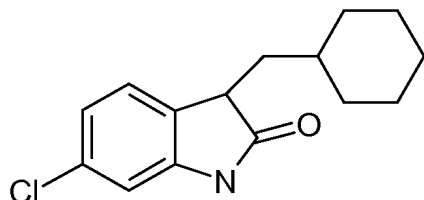


<2170> M. W. 261.75 $C_{15}H_{16}ClNO$

<2171> 표제 화합물을 E/Z-6-클로로-3-(3-클로로-벤질리덴)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 262(M+H)⁺.

<2172> 실시예 388b

<2173> 중간체 rac-6-클로로-3-시클로헥실메틸렌-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

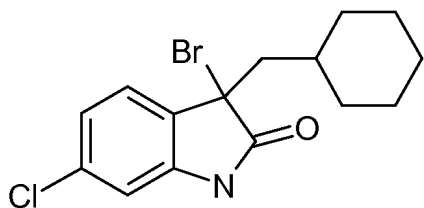


<2174> M. W. 263.77 $C_{15}H_{18}ClNO$

<2175> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 264(M+H)⁺.

<2176> 실시예 388c

<2177> 중간체 rac-3-브로모-6-클로로-3-시클로헥실메틸렌-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 342.67 C₁₅H₁₇BrClNO

<2178>

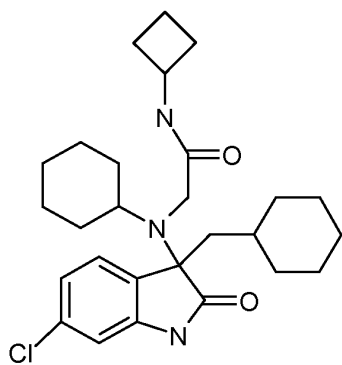
<2179> 표제 화합물을 rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 342(M+H)⁺.

<2180>

실시예 388d

<2181>

rac-2-[(6-클로로-3-시클로헥실메틸-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일)-시클로헥실-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



M. W. 472.08 C₂₇H₃₈Cl₂N₃O₂

<2182>

<2183> 시클로헥실아민 (61 μL, 0.80mmol) 및 DIPEA (300 μL, 1.59mmol) 의 디클로로메탄 (2mL) 중 용액에, 0℃ 에서 2-브로모-N-시클로부틸-아세트아미드 (156mg, 0.80mmol) 를 서서히 첨가했다. 첨가 후, 혼합물을 실온에서 4 시간 교반했다. 그 다음, rac-3-브로모-6-클로로-3-시클로헥실메틸렌-1,3-디히드로-인돌-2-온을 반응 혼합물에 첨가했다. 반응 혼합물을 2 시간 동안 실온에서 교반했다.

<2184>

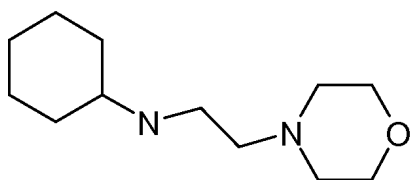
그리고, 혼합물을 물 (3 x 5 mL) 로 세정했다. 유기 용액을 Na₂SO₄ 로 건조 및 진공 하 농축했다. 잔류물을 크로마토그래피로 정제해 백색 고체를 수득했다. MS: 472(M+H)⁺.

<2185>

실시예 389a

<2186>

중간체 시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아민의 제조



M.W. 212.34 C₁₂H₂₄N₂O

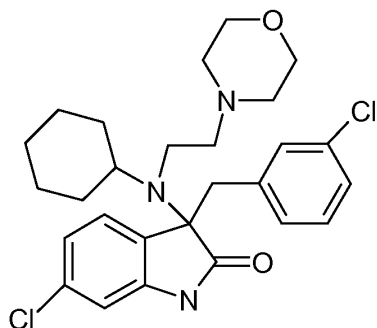
<2187>

<2188> 시클로헥사논 (2.00g, 20.4mmol) 및 2-모르폴린-4-일-에틸아민 (2.98mL, 20.4mmol) 을 10 mL 메탄올 중에 용해했다. 용액을 실온에서 1 시간 교반했다. NaBH₃CN (1.62g, 24.4mmol) 를 용액에 서서히 분할해서 첨가했다. 첨가 후, 혼합물을 실온에서 4 시간 교반한 다음 감압하에서 농축했다. 잔류물에, 50 mL 물을 첨

가하고, 혼합물을 희석 수 KOH 로 pH = 10 으로 조절하고 에틸 아세테이트로 추출했다. 유기 용액을 Na₂SO₄ 로 건조 및 진공 하 농축해 오일을 수득했다. MS: 213(M+H)⁺.

<2189> 실시예 389b

<2190> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



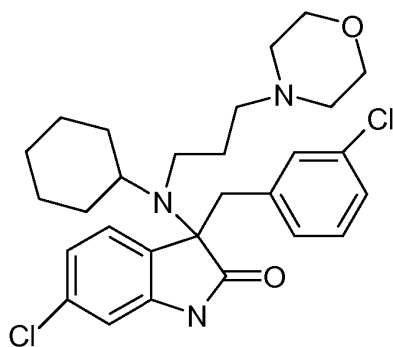
M. W. 502.49 C₂₇H₃₃Cl₂N₃O₂

<2191>

<2192> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-1H-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 502(M+H)⁺.

<2193> 실시예 390

<2194> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



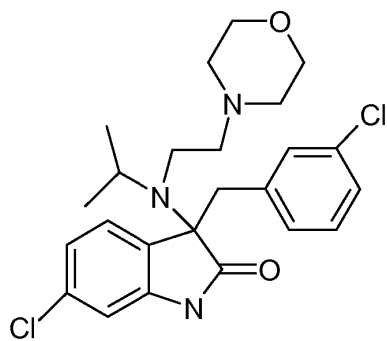
M. W. 516.52 C₂₈H₃₅Cl₂N₃O₂

<2195>

<2196> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 516 (M+H)⁺.

<2197> 실시예 391

<2198> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

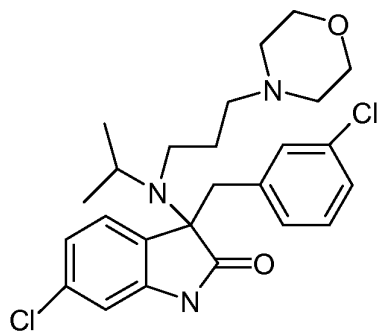


M. W. 462.42 $C_{24}H_{29}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 462 (M+H)⁺.

실시예 392

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(3-모르폴린-4-일-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

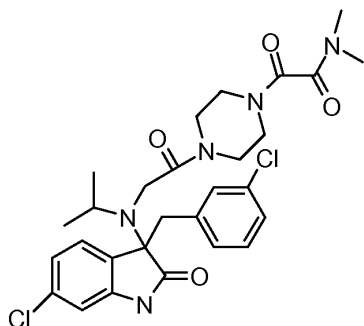


M. W. 476.45 $C_{25}H_{31}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-모르폴린-4-일-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 476 (M+H)⁺.

실시예 393

rac-2-[4-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페라진-1-일]-N,N-디메틸-2-옥소-아세트아미드의 제조

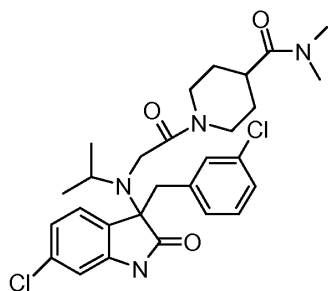


M. W. 574.51 $C_{28}H_{33}Cl_2N_5O_4$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 574(M+H)⁺.

실시예 394

<2209> rac-1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-카복실산 디메틸아미드의 제조

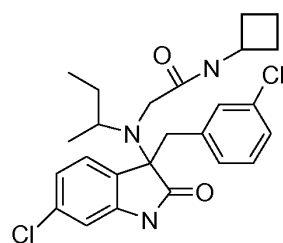


<2210> M. W. 545.51 $C_{28}H_{34}Cl_2N_4O_3$

<2211> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 545 (M+H)⁺.

<2212> 실시예 395

<2213> rac-2-{sec-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

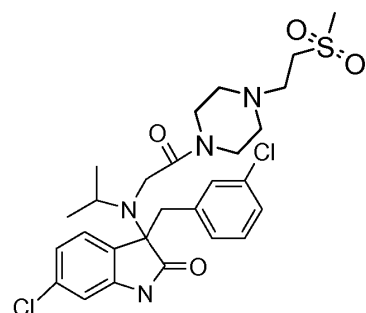


<2214> M. W. 474.43 $C_{25}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<2215> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 474 (M+H)⁺.

<2216> 실시예 396

<2217> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-(이소프로필-{2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



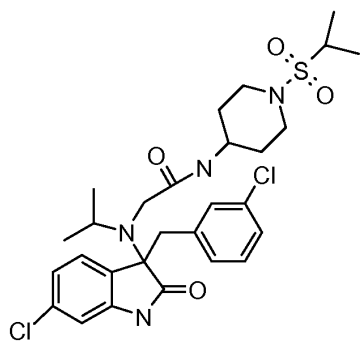
<2218> M. W. 581.57 $C_{27}H_{34}Cl_2N_4O_4S$

<2219> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 581 (M+H)⁺.

<2220> 실시예 397

<2221> rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-[1-(프로판-

2-술포닐)-피페리딘-4-일]-아세트아미드의 제조



M. W. 595.59

$C_{28}H_{36}Cl_2N_4OS$

<2222>

<2223>

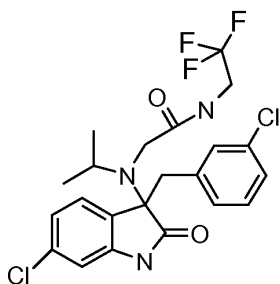
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 595(M+H)⁺.

<2224>

실시예 398

<2225>

rac-2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-N-(2,2,2-트리플루오로-에틸)-아세트아미드의 제조



M. W. 488.34

$C_{22}H_{22}Cl_2F_3N_3O_2$

<2226>

<2227>

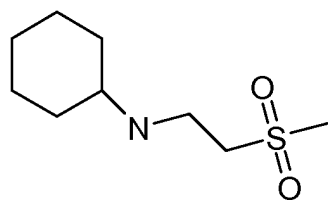
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488 (M+H)⁺.

<2228>

실시예 399a

<2229>

중간체 시클로헥실-(2-메탄술포닐-에틸) 아민의 제조



<2230>

<2231>

M. W. 205.32

$C_9H_{19}NO_2S$

<2232>

메틸 비닐 술포 (5.7mL, 64.8mmol) 을 시클로헥실아민 (6.2mL, 54mmol) 의 50mL DCM 중 용액에 첨가했다. 반응 혼합물을 실온에서 4 시간 교반하고 진공 하 농축한 다음 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해 오일을 수득했다.

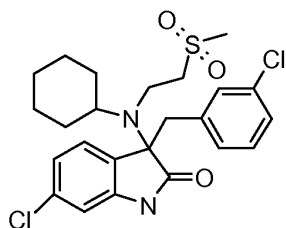
<2233>

MS: 206 (M+H)⁺.

<2234>

실시예 399b

<2235> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-메탄술폰닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 495.47 $C_{24}H_{28}Cl_2N_2O_3S$

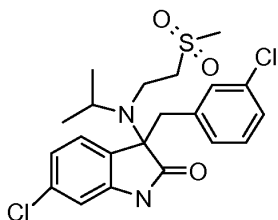
<2236>

<2237> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로- 벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-1H-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 495(M+H)⁺.

<2238>

실시예 400

<2239> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[이소프로필-(2-메탄술폰닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 455.41 $C_{21}H_{24}Cl_2N_2O_3S$

<2240>

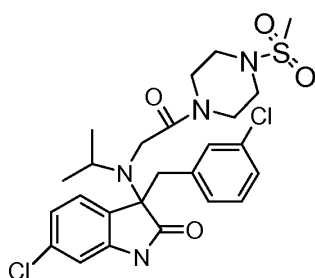
<2241> 표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[시클로헥실-(2-메탄술폰닐-에틸)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다.

<2242> MS: 455 (M+H)⁺.

<2243>

실시예 401

<2244> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{이소프로필-[2-(4-메탄술폰닐-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 553.51 $C_{25}H_{30}Cl_2N_4O_4S$

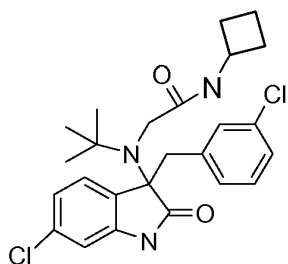
<2245>

<2246> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 553 (M+H)⁺.

<2247>

실시예 402

<2248> rac-2-{tert-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조

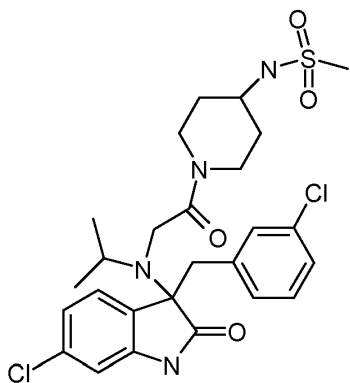


M. W. 474.43 $C_{25}H_{29}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 474 (M+H)⁺.

실시예 403

rac-N-[1-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-아세틸)-피페리딘-4-일]-메탄술폰아미드의 제조

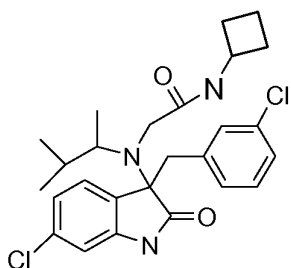


M. W. 567.54 $C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_4S$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 567 (M+H)⁺.

실시예 404

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



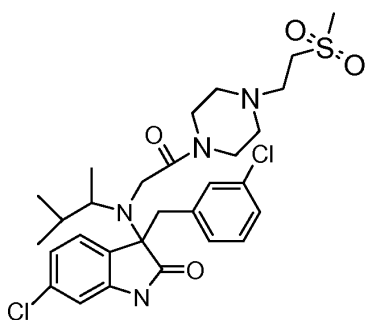
M. W. 488.46 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488 (M+H)⁺.

실시예 405

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((1,2-디메틸-프로필)-(2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-

에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

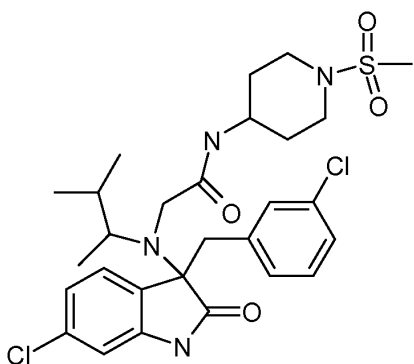


M. W. 609.62 $C_{29}H_{38}Cl_2N_4O_4S$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 609(M+H)⁺.

실시예 406

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-N-(1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일)-아세트아미드의 제조

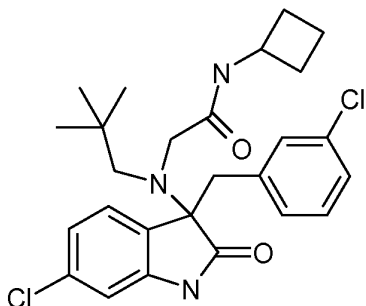


M. W. 595.59 $C_{28}H_{36}Cl_2N_4O_4S$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 595 (M+H)⁺.

실시예 407

rac-2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-N-시클로부틸-아세트아미드의 제조



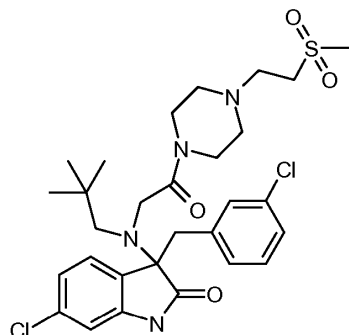
M. W. 488.46 $C_{26}H_{31}Cl_2N_3O_2$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 488 (M+H)⁺.

<2271> 실시예 408

<2272> rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2,2-디메틸-프로필)-(2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸)-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

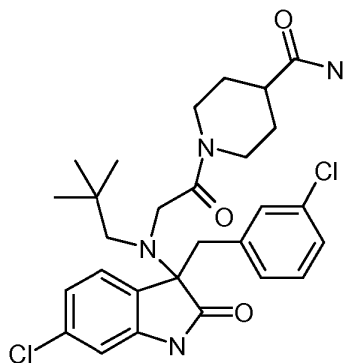


<2273> M. W. 609.62 C₂₉H₃₈Cl₂N₄O₄S

<2274> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 609 (M+H)⁺.

<2275> 실시예 409

<2276> rac-1-{2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조

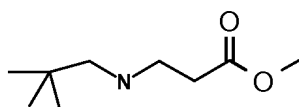


<2277> M. W. 545.51 C₂₈H₃₄Cl₂N₄O₃

<2278> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 545 (M+H)⁺.

<2279> 실시예 410a

<2280> 3-(2,2-디메틸-프로필아미노)-프로피온산 메틸 에스테르의 제조

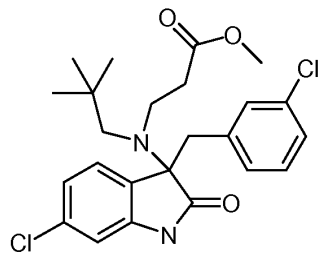


<2281>

<2282> 1.5g 2,2-디메틸-프로피온알데히드, 2.18g 3-아미노-프로피온산 메틸 에스테르 및 50ml MeOH 의 혼합물을 실온에서 30 분 동안 교반했다. 1.5g NaCNBH₃ 를 소량 분획으로 첨가했다. 혼합물을 추가 3 시간 동안 교반했다. 용매를 진공하에서 제거했다. 50mL 물을 잔류물에 첨가하고 혼합물을 1N NaOH 로써 pH 10 으로 염기성화시켰다. 용액을 EtOAc (30mL x 3) 로 추출했다. 유기상을 20mL 물로 세정, Na₂SO₄ 로 건조했다. 용매를 제거해 0.66g 표적 분자를 투명한 오일로서 수득했다.

<2283> 실시예 410b

<2284> rac-3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로피온산 메틸 에스테르의 제조



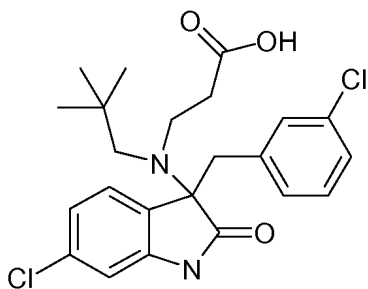
<2285> M. W. 463.4



<2286> 표제 화합물을 rac-(2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-카르복산 tert-부틸 에스테르에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 463 (M+H)⁺.

<2287> 실시예 411

<2288> rac-3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로피온산의 제조



M. W. 449.38

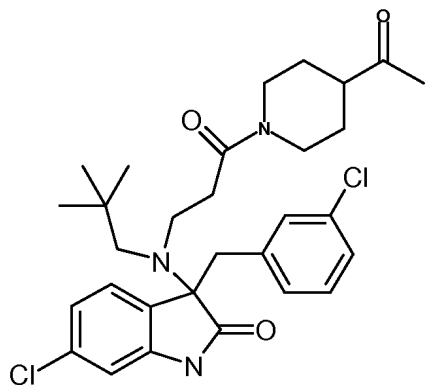


<2289>

<2290> 720 mg
rac-3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로피온산 메틸 에스테르의 10mL MeOH 중 혼합물에, 10mL 1N NaOH 를 첨가했다. 혼합물을 90℃ 에서 3 시간 가 열했다. MeOH 대부분을 진공하에서 제거했다. 20mL 물을 잔류물에 첨가했다. 2N HCl 로써 pH 3 으 로 산성화했다. 침전물을 여과로 수집하고 물로 세정해 680mg 표적 분자를 얻은 황색 고체로서 수득했다. MS: 449 (M+H)⁺.

<2291> 실시예 412

<2292> rac-1-{3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로피오닐}-피페리딘-4-카르복실산 아마이드의 제조

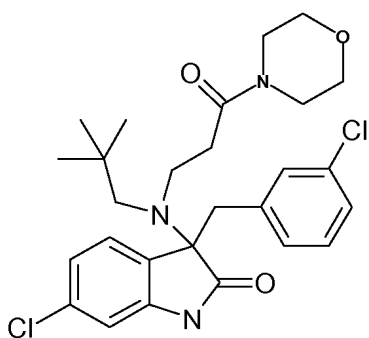


M. W. 559.53 $C_{30}H_{37}Cl_2N_3O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 동일한 절차로 제조했다. MS: 559 (M+H)⁺.

실시예 413

rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[(2,2-디메틸-프로필)-(3-모르폴린-4-일-3-옥소-프로필)-아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

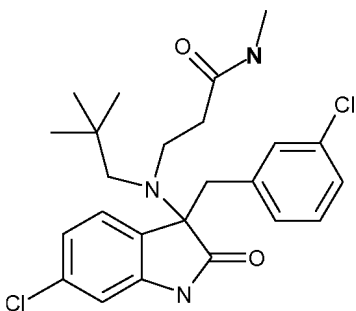


M. W. 518.48 $C_{27}H_{33}Cl_2N_3O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 518 (M+H)⁺.

실시예 413

rac-3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-N-메틸-프로피온아미드의 제조



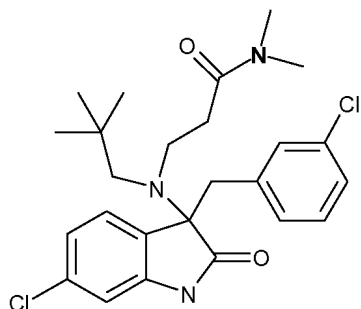
M. W. 462.41 $C_{24}H_{29}Cl_2N_3O_3$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 462 (M+H)⁺.

<2303> 실시예 414

<2304> rac-3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-N,N-디메틸-프로피온아미드의 제조

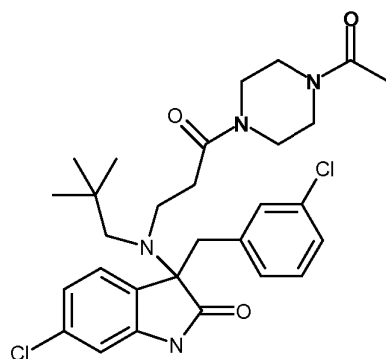


<2305> M. W. 476.44 C₂₅H₃₁Cl₂N₃O₃

<2306> 표제 화합물을 rac-3-{{2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸}-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 476 (M+H)⁺.

<2307> 실시예 415

<2308> rac-3-[[3-(4-아세틸-피페라진-1-일)-3-옥소-프로필]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

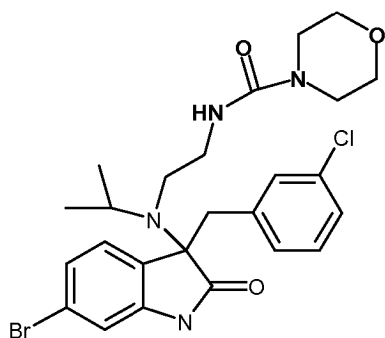


<2309> M. W. 559.53 C₂₉H₃₆Cl₂N₄O₃

<2310> 표제 화합물을 rac-3-{{2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸}-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: 559 (M+H)⁺.

<2311> 실시예 416

<2312> rac-모르폴린-4-카복실산 (2-{{6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일}-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드의 제조



M. W. 549.89 $C_{25}H_{30}BrClN_4O_3$

<2313>

<2314>

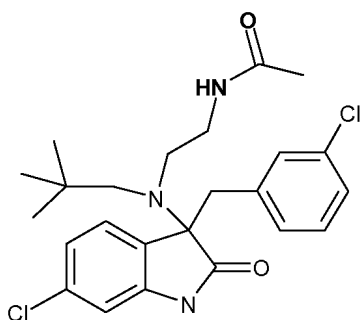
표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드에 대한 절차와 유사한 절차로 제조했다. MS: 549 (M+H)⁺.

<2315>

실시예 417

<2316>

rac-N-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아세트아미드의 제조



M. W. 462.42 $C_{24}H_{29}Cl_2N_3O_2$

<2317>

<2318>

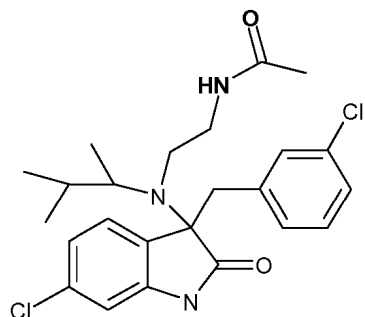
표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: 462 (M+H)⁺.

<2319>

실시예 418

<2320>

rac-N-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아세트아미드의 제조



M. W. 462.42 $C_{24}H_{29}Cl_2N_3O_2$

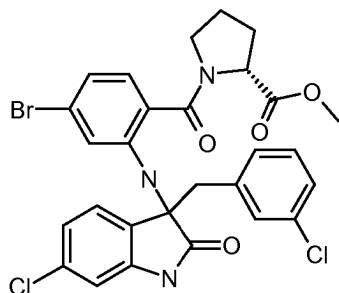
<2321>

<2322>

표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: 462 (M+H)⁺.

<2323> 실시예 419

<2324> (R)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산 메틸 에스테르의 제조

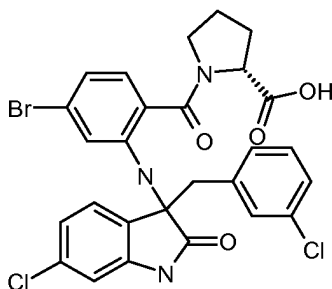


<2325> M.W. 617.33 C₂₈H₂₄BrCl₂N₃O₄

<2326> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 616.

<2327> 실시예 420

<2328> (R)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산의 제조

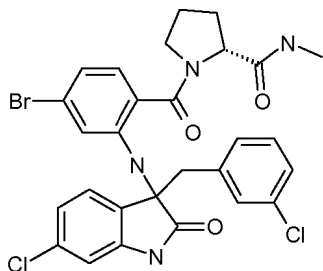


<2329> M.W. 603.30 C₂₇H₂₂BrCl₂N₃O₄

<2330> 표제 화합물을 rac-6'-클로로-3'-(3-클로로-벤질)-6-메톡시-2'-옥소-2,3,2',3'-테트라히드로-1'H-[1,3']바이인돌릴-2-카르복실산과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M-H]⁻ = 600.

<2331> 실시예 421

<2332> (R)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산 메틸아미드의 제조

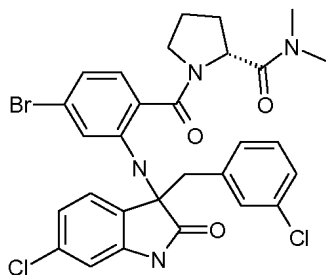


<2333> M.W. 616.35 C₂₈H₂₅BrCl₂N₄O₃

<2334> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 615.

<2335> 실시예 422

<2336> (R)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산 디메틸아미드의 제조



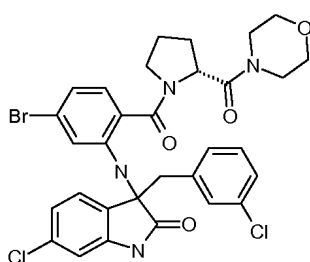
M.W. 630.37 $C_{29}H_{27}BrCl_2N_4O_3$

<2337>

<2338> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 629$.

<2339> 실시예 423

<2340> 3-{5-브로모-2-[(R)-2-(모르폴린-4-카르보닐)-피롤리딘-1-카르보닐]-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



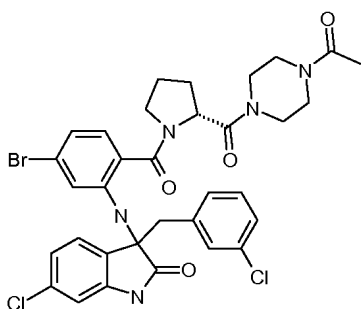
M.W. 672.41 $C_{31}H_{29}BrCl_2N_4O_4$

<2341>

<2342> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 671$.

<2343> 실시예 424

<2344> 3-{2-[(R)-2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-피롤리딘-1-카르보닐]-5-브로모-페닐아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



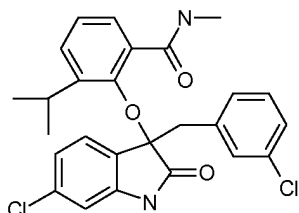
M.W. 713.46 $C_{33}H_{32}BrCl_2N_5O_4$

<2345>

<2346> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 712$.

<2347> 실시예 425

<2348> 2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-3-이소프로필-N-메틸-벤즈아미드의 제조



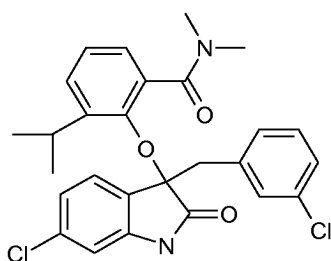
M.W. 483.40 $C_{26}H_{24}Cl_2N_2O_3$

<2349>

<2350> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 483$.

<2351> 실시예 426

<2352> 2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-3-이소프로필-N,N-디메틸-벤즈아미드의 제조



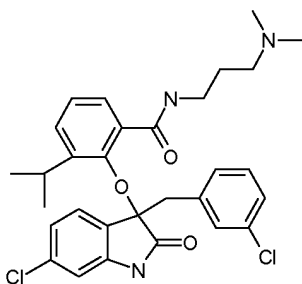
M.W. 497.43 $C_{27}H_{26}Cl_2N_2O_3$

<2353>

<2354> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 497$.

<2355> 실시예 427

<2356> 2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일옥시]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-3-이소프로필-벤즈아미드의 제조



<2357>

M.W. 554.52 $C_{30}H_{33}Cl_2N_3O_3$

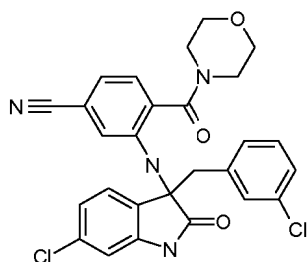
<2358>

<2359> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-

일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 554$.

<2360> 실시예 428

<2361> 3-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-(모르폴린-4-카르보닐)-벤조니트릴의 제조



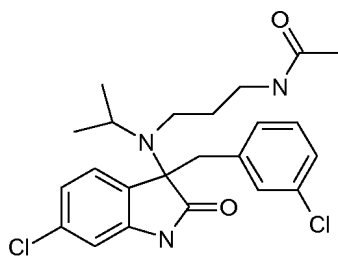
M.W. 521.41 $C_{27}H_{22}Cl_2N_4O_3$

<2362>

<2363> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 521$.

<2364> 실시예 429

<2365> N-(3-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-프로필)-아세트아미드의 제조



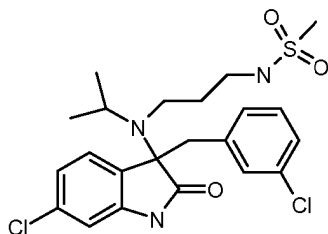
M.W. 448.40 $C_{23}H_{27}Cl_2N_3O_2$

<2366>

<2367> 표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아세트아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 448$.

<2368> 실시예 430

<2369> N-(3-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-프로필)-메탄술폰아미드의 제조



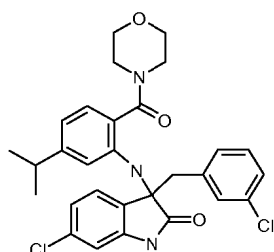
M.W. 484.45 $C_{22}H_{27}Cl_2N_3O_3S$

<2370>

<2371> 표제 화합물을 rac-N-(2-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-메탄술폰아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 484$.

<2372> 실시예 431

<2373> 6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-[5-이소프로필-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M.W. 538.48 $C_{29}H_{29}Cl_2N_3O_3$

<2374>

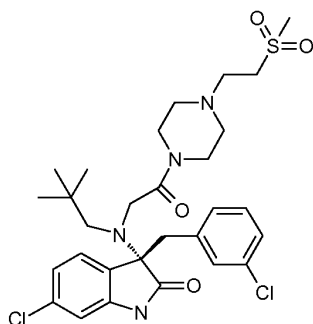
<2375> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 538$.

<2376>

실시예 432

<2377>

(R)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2,2-디메틸-프로필)-{2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M.W. 609.62 $C_{29}H_{38}Cl_2N_4O_4S$

<2378>

<2379>

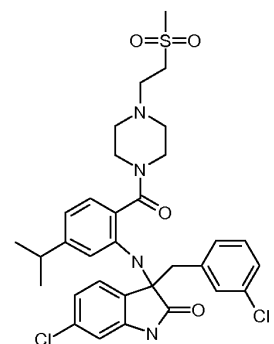
표제 화합물을 키랄 제조용 HPLC 로 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-((2,2-디메틸-프로필)-{2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-일]-2-옥소-에틸}-아미노)-1,3-디히드로-인돌-2-온으로부터 분리했다. MS: $[M+H]^+ = 609$.

<2380>

실시예 433

<2381>

6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-{5-이소프로필-2-[4-(2-메탄술폰닐-에틸)-피페라진-1-카르보닐]-페닐아미노}-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M.W. 643.64 $C_{32}H_{36}Cl_2N_4O_4S$

<2382>

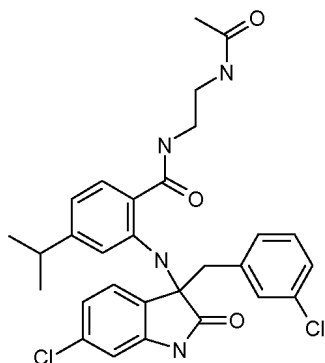
<2383>

표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-

일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 643$.

<2384> 실시예 434

<2385> N-(2-아세틸아미노-에틸)-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-4-이소프로필-벤즈아미드의 제조



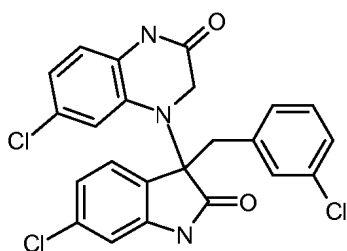
M.W. 553.49 $C_{29}H_{30}Cl_2N_4O_3$

<2386>

<2387> 표제 화합물을 rac-시클로부탄카르복실산 (2-{[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노)-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 553$.

<2388> 실시예 435

<2389> 6-클로로-4-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-3,4-디히드로-1H-퀴녹살린-2-온의 제조



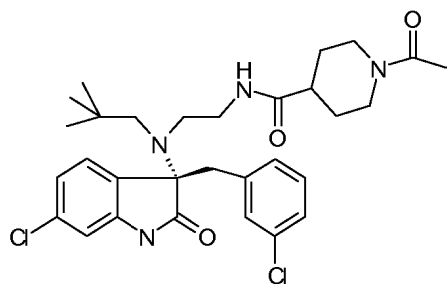
M.W. 472.76 $C_{23}H_{16}Cl_3N_3O_2$

<2390>

<2391> rac-3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (200 mg, 0.55 mmol) (상기 실시예 1c), 6-클로로-3,4-디히드로-1H-퀴녹살린-2-온 (100mg, 0.55mmol) 및 K_2CO_3 (150 mg, 1.09 mmol) 의 아세트니트릴 (3mL) 중 혼합물을 실온에서 2 시간 교반했다. 혼합물을 진공 하 농축하고, 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해 110mg 6-클로로-4-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-3,4-디히드로-1H-퀴녹살린-2-온을 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 472$.

<2392> 실시예 436

<2393> 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]- (2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸)-아미드의 제조



M. W 573.561 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

<2394>

<2395>

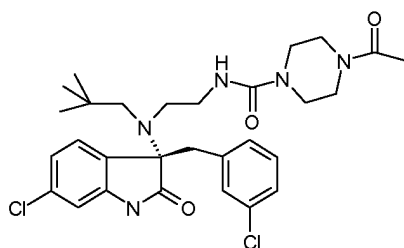
3-[(2-아미노-에틸)-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (120mg, 0.286mmol), 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 (59mg, 0.344mmol), EDC.HCl (66mg, 0.344mmol), HOBt (46mg, 0.344mmol) 및 DIPEA (111mg, 0.860mmol) 의 디클로로-메탄 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 미정제물을 이어서 제조용 HPLC 로 정제해 54 mg rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 백색 고체로서 수득했다. 그다음에, 18 mg rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 키랄 제조용 HPLC 로 분리해, 7mg 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 573$.

<2396>

실시예 437

<2397>

4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조



M. W 574.549 $C_{29}H_{37}Cl_2N_5O_3$

<2398>

<2399>

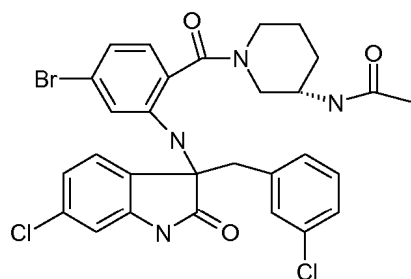
3-[(2-아미노-에틸)-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (75mg, 0.179mmol), 4-아세틸-피페라진-1-카르보닐 클로라이드(41mg, 0.215mmol) 및 K_2CO_3 (37mg, 0.268mmol) 의 디클로로-메탄 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 2 시간 교반했다. 그 다음 용액을 농축하고 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 42 mg rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 황색 고체로서 수득했다. 그 다음, 15mg rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 키랄 컬럼으로 분리해 4mg 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 수득했다. $[M+H]^+ = 574$.

<2400>

실시예 438

<2401>

N-((S)-1-(4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일)-피페리딘-3-일)-아세트아미드의 제조



M. W 630.367 $C_{29}H_{27}BrCl_2N_4O_3$

<2402>

<2403>

4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산 (150mg, 0.298mmol), (S)-N-피페리딘-3-일-아세트아미드 (63mg, 0.446mmol), EDC.HCl (85mg, 0.446mmol), HOBt (60mg, 0.446mmol) 및 DIPEA (154mg, 1.190mmol) 의 디클로로-메탄 (2 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 그 다음에, 미정제물을 제조용 HPLC 로 정제해 33 mg N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아세트아미드를 황색 고체로서 수득했다.

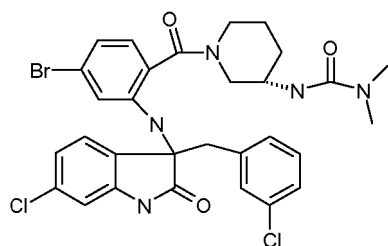
MS: $[M+H]^+ = 629$.

<2404>

실시예 439

<2405>

3-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-1,1-디메틸-우레아의 제조



M. W 659.409 $C_{30}H_{30}BrCl_2N_5O_3$

<2406>

<2407>

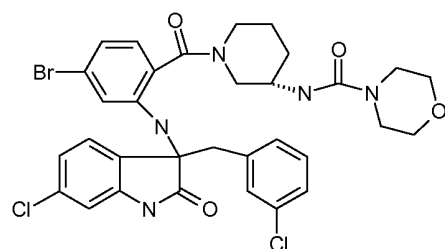
표제 화합물을 N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 658$.

<2408>

실시예 440

<2409>

모르폴린-4-카르복실산 ((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아미드의 제조



M. W 701.446 $C_{32}H_{32}BrCl_2N_5O_4$

<2410>

<2411>

표제 화합물을 N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 700$.

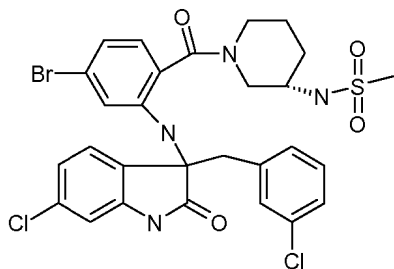
<2412>

실시예 441

<2413>

N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페

리딘-3-일)-메탄술폰아미드의 제조

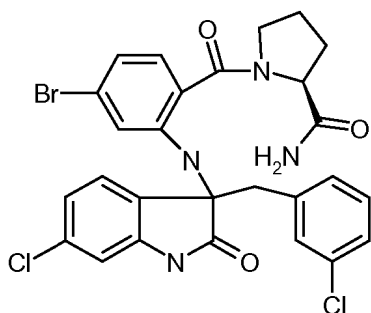


M. W 666.421 $C_{28}H_{27}BrCl_2N_4O_4S$

표제 화합물을 N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 665$.

실시예 442

(S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산 아미드의 제조

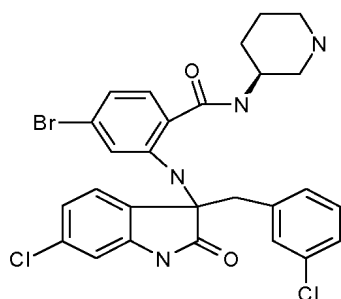


M. W 602.314 $C_{27}H_{23}BrCl_2N_4O_3$

표제 화합물을 N-((S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피페리딘-3-일)-아세트아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 601$.

실시예 443

4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(S)-피페리딘-3-일-벤즈아미드의 제조



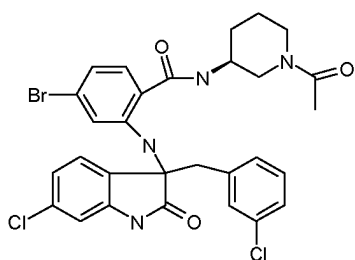
M. W 588.331 $C_{27}H_{25}BrCl_2N_4O_2$

4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조산 (1.5g, 0.003mol), (S)-3-아미노-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르 (0.72g, 0.0036mol), EDC.HCl (0.68g, 0.0036mol), HOBt (0.49g, 0.0036mol) 및 DIPEA (1.15g, 0.0089mol) 의 DMF (20 mL) 중 혼합물을 실온에서 하룻밤 교반했다. 그 다음 혼합물을 물에 붓고 혼합 용액을 여과시켜 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 1.2g 황색 고체의 3-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히

드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노)-(S)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 수득했다. 그 다음, 100mg 3-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노)-(S)-피페리딘-1-카르복실산 tert-부틸 에스테르를 CF₃COOH 및 CH₂Cl₂ 의 혼합 용액 중에서 용해했다. 0.5 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축하고 유기층을 NaOH 수용액으로 세정했다. 유기층을 건조, 농축해 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 제조용 HPLC 로 정제해 31mg 4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(S)-피페리딘-3-일-벤즈아미드를 수득했다. MS: 587(M+H)⁺.

<2425> 실시예 444

<2426> N-((S)-1-아세틸-피페리딘-3-일)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드의 제조

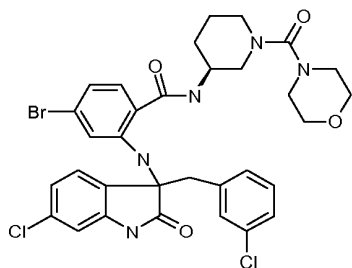


M. W 630.367 C₂₉H₂₇BrCl₂N₄O₃

<2427>
<2428> 브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(S)-피페리딘-3-일-벤즈아미드 (150mg, 0.214mmol), 아세트산 무수물 (22mg, 0.214mmol) 및 DIPEA(111mg, 0.859mmol) 를 2ml CH₃CN 중 에서 용해했다. 2 시간 동안 실온에서 교반한 후, 용액을 농축하고 미정제 생성물을 제조용 HPLC 로 정제해 32mg N-((S)-1-아세틸-피페리딘-3-일)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드를 백색 고체로서 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 629.

<2429> 실시예 445

<2430> 4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-[(S)-1-(모르폴린-4-카르보닐)-피페리딘-3-일]-벤즈아미드의 제조

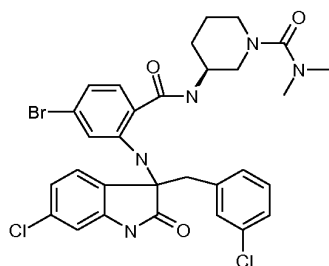


M. W 701.446 C₃₂H₃₂BrCl₂N₅O₄

<2431>
<2432> 표제 화합물을 N-((S)-1-아세틸-피페리딘-3-일)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 700.

<2433> 실시예 446

<2434> (S)-3-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-피페리딘-1-카르복실산 디메틸아미드의 제조

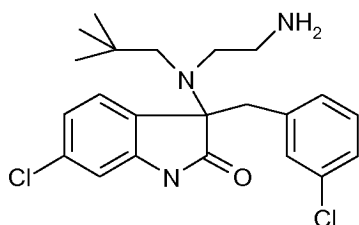


M. W 659.409 $C_{30}H_{30}BrCl_2N_5O_3$

표제 화합물을 N-((S)-1-아세틸-피페리딘-3-일)-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤즈아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 658$.

실시예 447

rac-3-[(2-아미노-에틸)-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

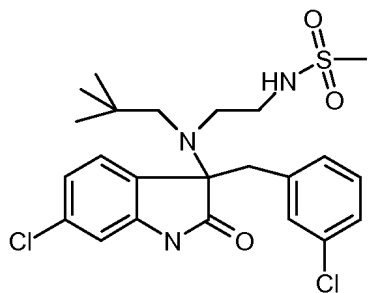


M. W 420.381 $C_{22}H_{27}Cl_2N_3O$

(2-아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(1.2g, 7.5mmol) 및 2,2-디메틸-프로피온알데히드 (0.65g, 7.5mmol) 를 20ml 메탄올 중에 용해했다. 혼합물을 1 시간 동안 실온에서 교반한 후, $NaBH_3CN$ (0.6g, 9mmol) 를 첨가했다. 이어서, 혼합물을 하룻밤 교반하고 감압하에서 농축했다. 잔류물에, 20ml 의 물을 첨가하고, 혼합물을 희석 수성 NaOH 를 이용해 pH = 10 으로 조절하고 EtOAc 로 추출했다. 조합된 유기층을 건조 및 농축시켜 1.3g 오일을 수득했다. 이러한 오일, 3-브로모-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (2.1g, 5.65mmol) 및 K_2CO_3 (0.94g, 6.78mmol) 을 10ml DMF 중에 용해했다. 약 3 시간 동안 교반한 후, 혼합물을 물에 붓고 혼합 용액을 여과시켜 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 1.8g {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-카르바산 tert-부틸 에스테르를 황색 고체로서 수득했다. 그 다음 상기 1.8g 황색 고체를 CF_3COOH 및 CH_2Cl_2 의 혼합 용액 중에서 용해했다. 1 시간 동안 교반한 후, 용액을 농축하고 유기층을 NaOH 수용액으로 세정했다. 유기층을 건조, 농축해 미정제 생성물을 수득했다. 미정제 생성물을 크로마토그래피로 정제해 566mg rac-3-[(2-아미노-에틸)-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온을 황색 고체로서 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 420$.

실시예 448

rac-N-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-메탄술폰아미드의 제조

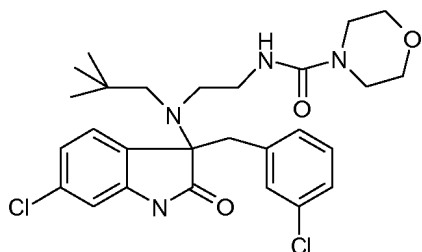


M. W 498.472 $C_{23}H_{29}Cl_2N_3O_3S$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+$ = 498.

실시예 449

rac-모르폴린-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

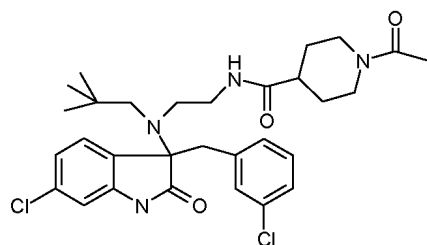


M. W 533.497 $C_{27}H_{34}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+$ = 533.

실시예 450

rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조



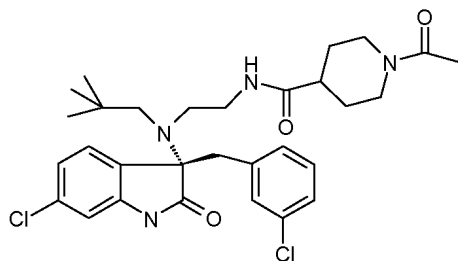
M. W 573.561 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+$ = 573.

실시예 451

1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[(R)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조



M. W 573.561 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

<2456>

<2457>

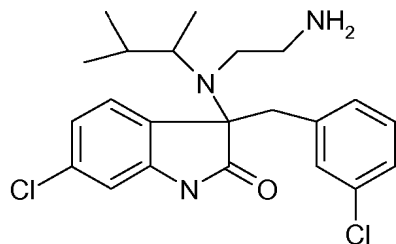
18mg rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 키랄 컬럼으로 분리하여 7mg 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드를 수득했다. MS: $[M+H]^+ = 573$.

<2458>

실시예 452

<2459>

3-[(2-아미노-에틸)-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W 420.381 $C_{22}H_{27}Cl_2N_3O$

<2460>

<2461>

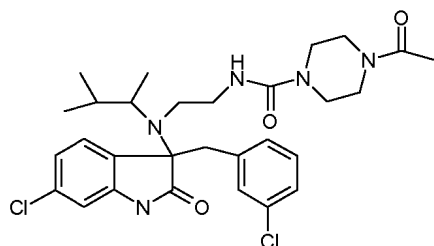
표제 화합물을 rac-3-[(2-아미노-에틸)-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 420$.

<2462>

실시예 453

<2463>

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조



M. W 574.549 $C_{29}H_{37}Cl_2N_5O_3$

<2464>

<2465>

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 574$.

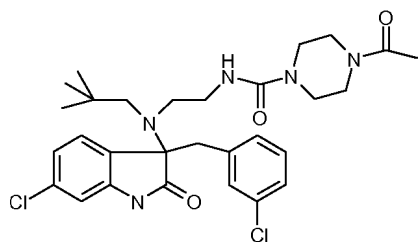
<2466>

실시예 454

<2467>

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

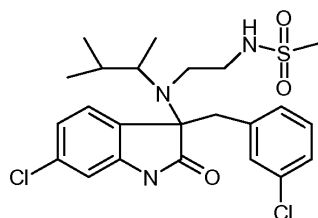


M. W 574.549 C₂₉H₃₇Cl₂N₅O₃

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드에 대한 절차와 동일한 절차로 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 574.

실시예 455

rac-N-{2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-메탄술폰아미드의 제조

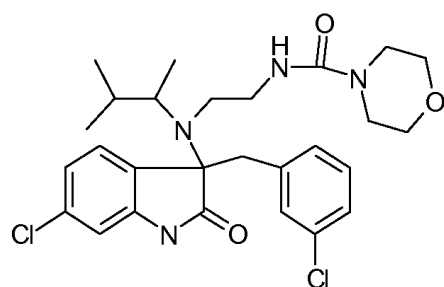


M. W 498.472 C₂₃H₂₉Cl₂N₃O₃S

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 498.

실시예 456

rac-모르폴린-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

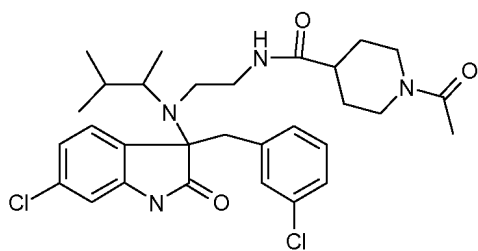


M. W 533.497 C₂₇H₃₄Cl₂N₄O₃

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 533.

실시예 457

rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(1,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드의 제조

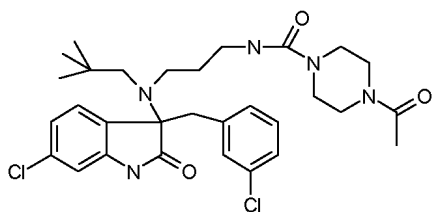


M. W 573.561 $C_{30}H_{38}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸]-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 573$.

실시예 458

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {3-[[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로필}-아미드의 제조

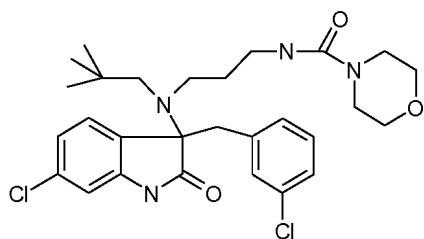


M. W 588.576 $C_{30}H_{39}Cl_2N_5O_3$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸]-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 588$.

실시예 459

rac-모르폴린-4-카르복실산 {3-[[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로필}-아미드의 제조

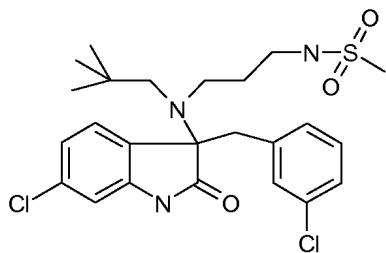


M. W 547.523 $C_{28}H_{36}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[[(S)-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸]-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 547$.

실시예 460

rac-N-{3-[[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로필}-메탄술폰아미드의 제조

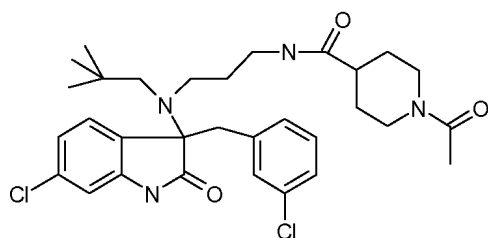


M. W 512.499 $C_{24}H_{31}Cl_2N_3O_3S$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[*(S)*-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 512$.

실시예 461

rac-1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {3-[[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-프로필}-아미드의 제조

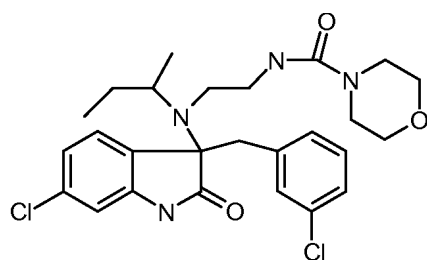


M. W 587.588 $C_{31}H_{40}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 1-아세틸-피페리딘-4-카르복실산 {2-[[*(S)*-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 587$.

실시예 462

rac-모르폴린-4-카르복실산 (2-{*sec*-부틸-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-에틸)-아미드의 제조

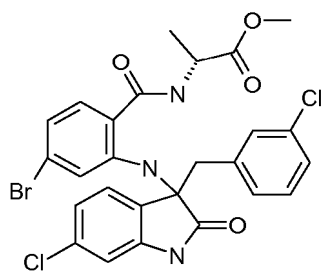


M. W 519.47 $C_{26}H_{32}Cl_2N_4O_3$

표제 화합물을 4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 {2-[[*(S)*-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-(2,2-디메틸-프로필)-아미노]-에틸}-아미드와 동일한 절차로 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 519$.

실시예 463

rac-(R)-2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-프로피온산 메틸 에스테르의 제조



M. W. 591.29 $C_{26}H_{22}Cl_2BrN_3O_4$

<2504>

<2505>

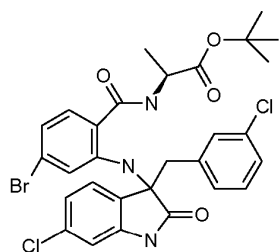
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 590$.

<2506>

실시예 464

<2507>

rac-(S)-2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-프로피온산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W. 633.37 $C_{29}H_{28}BrCl_2N_3O_4$

<2508>

<2509>

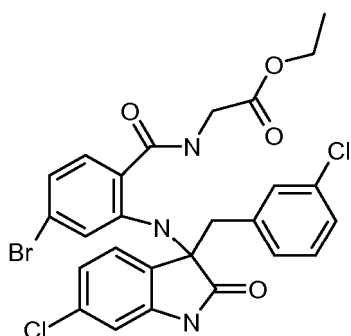
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 632$.

<2510>

실시예 465a

<2511>

rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-아세트산 에틸 에스테르의 제조



M. W. 591.29 $C_{26}H_{22}BrCl_2N_3O_4$

<2512>

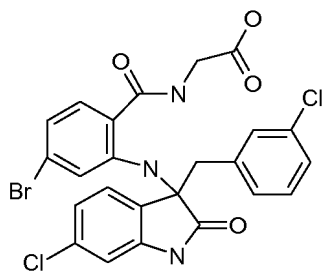
<2513>

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 590$.

<2514>

실시예 465b

<2515> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-아세트산의 제조



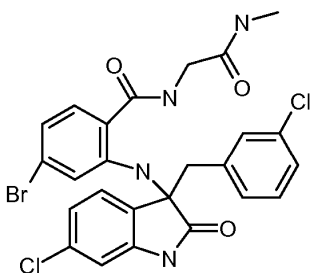
M. W. 563.24 $C_{24}H_{18}BrCl_2N_3O_4$

<2516>

<2517> 표제 화합물을 rac-([6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-시클로헥실-아미노)-아세트산과 동일한 절차에 따라 제조했다. MS: 562 (M+H)⁺.

<2518> 실시예 465c

<2519> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-메틸카르바모일메틸-벤즈아미드의 제조



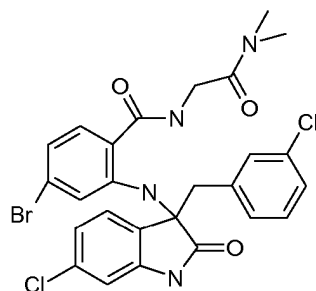
M. W. 576.28 $C_{25}H_{21}BrCl_2N_4O_3$

<2520>

<2521> 표제 화합물을 rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-메틸카르바모일메틸-벤즈아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 575.

<2522> 실시예 466

<2523> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-디메틸카르바모일메틸-벤즈아미드의 제조



M. W. 590.31 $C_{26}H_{23}BrCl_2N_4O_3$

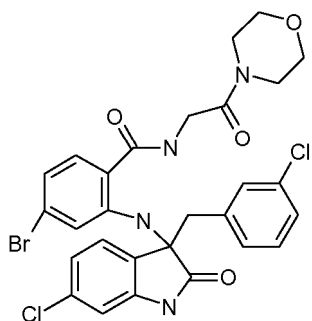
<2524>

<2525> 표제 화합물을 rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-메틸카르바모일메틸-벤즈아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 589.

<2526> 실시예 467

<2527> rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(2-모르폴린-4-일-

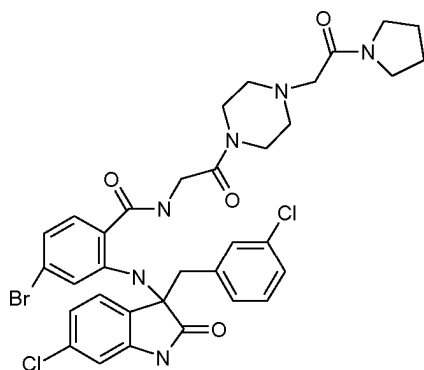
2-옥소-에틸)-벤즈아미드의 제조

M. W. 632.35 C₂₈H₂₅BrCl₂N₄O₄

표제 화합물을 rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-메틸 카르바모일메틸-벤즈아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 631$.

실시예 468

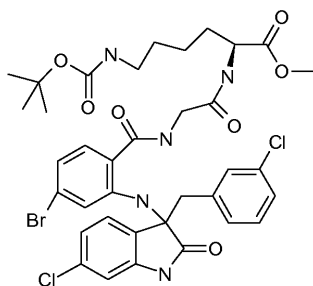
rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-{2-옥소-2-[4-(2-옥소-2-피롤리딘-1-일-에틸)-피페라진-1-일]-에틸}-벤즈아미드의 제조

M. W. 742.51 C₃₄H₃₅BrCl₂N₆O₄

표제 화합물을 rac-4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-메틸 카르바모일메틸-벤즈아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 741$.

실시예 469a

rac-(S)-6-아미노-2-(2-{4-프로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-아세틸아미노)-6-tert-부톡시카르보닐아미노-헥산산 메틸 에스테르의 제조

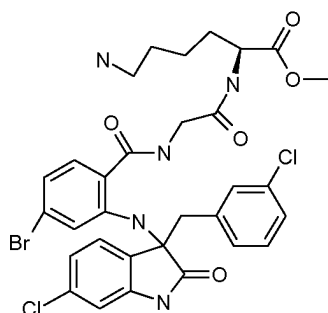
M. W. 805.56 $\text{C}_{36}\text{H}_{40}\text{BrCl}_2\text{N}_5\text{O}_7$

표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-이세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤

질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 질차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 804$

<2538> 실시예 469b

<2539> rac-(S)-6-아미노-2-(2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-아세틸아미노)-헥산산 메틸 에스테르의 제조

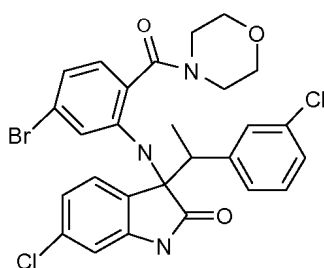


<2540> M. W. 705.44 $C_{31}H_{32}BrCl_2N_5O_5$

<2541> 5mL 의 TFA 중 rac-(S)-6-아미노-2-(2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일아미노}-아세틸아미노)-6-tert-부톡시카르보닐아미노-헥산산 메틸 에스테르 (200mg, 0.25mmol) 를 실온에서 0.5 시간 동안 교반하고, 진공 하 농축했다. 잔류물을 10mL 의 DCM 로써 첨가한 다음 20mL 의 물로 행구었다. 유기층을 Na_2SO_4 로 건조, 및 진공하 농축시킨 다음 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해 146 mg 백색 고체를 수득했다. MS: 704 $(M+H)^+$.

<2542> 실시예 470

<2543> rac-3-[5-브로모-2-(모르폴린-4-카르보닐)-페닐아미노]-6-클로로-3-[1-(3-클로로-페닐)-에틸]-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

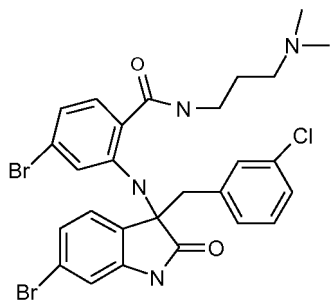


<2544> M. W. 589.32 $C_{27}H_{24}BrCl_2N_3O_3$

<2545> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 질차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 588$.

<2546> 실시예 471

<2547> rac-4-브로모-2-[6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드의 제조



M. W. 634.80 $C_{27}H_{27}Br_2ClN_4O_2$

<2548>

<2549>

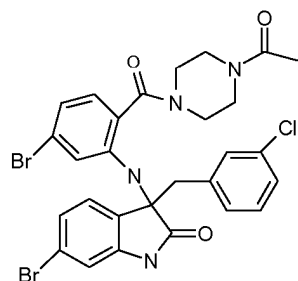
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 633$.

<2550>

실시예 472

<2551>

rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-브로모-페닐아미노]-6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



M. W. 660.80 $C_{28}H_{25}Br_2ClN_4O_3$

<2552>

<2553>

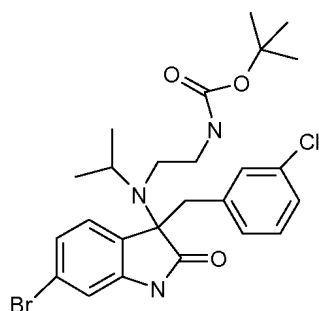
표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 659$.

<2554>

실시예 473a

<2555>

rac-(2-{[6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르의 제조



M. W. 536.90 $C_{25}H_{31}BrClN_3O_3$

<2556>

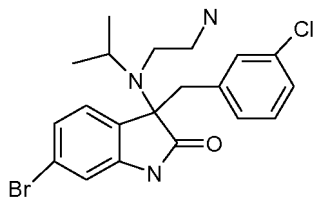
<2557>

표제 화합물을 rac-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-3-시클로헥실아미노-1,3-디히드로-1H-인돌-2-온과 동일한 절차에 따라 제조했다. MS: $535(M+H)^+$.

<2558>

실시예 473b

<2559> rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조



<2560>

M. W. 436.78 $C_{20}H_{23}BrClN_3O$

<2561>

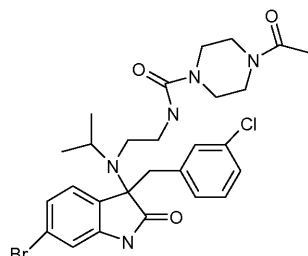
<2562> 표제 화합물을 rac-(S)-6-아미노-2-(2-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-아미노}-벤조일아미노)-아세틸아미노)-헥산산 메틸 에스테르와 동일한 절차로 제조했다. MS: 436(M+H)⁺.

<2563>

실시예 473c

<2564>

rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 (2-{[6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드의 제조



<2565>

M. W. 590.95 $C_{27}H_{33}BrClN_5O_3$

<2566>

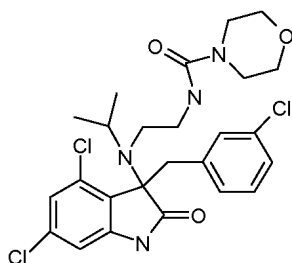
rac-3-[(2-아미노-에틸)-이소프로필-아미노]-6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온 (270mg, 0.48mmol) 및 DIPEA (167μL, 0.96mmol) 의 5mL 의 DCM 중 용액에, 실온에서 4-아세틸-피페라진-1-카르보닐 클로라이드(137mg, 0.72mmol) 를 첨가하고, 동일한 온도에서 하룻밤 교반했다. 반응 혼합물을 20mL 물로 행구었다. 유기층을 Na₂SO₄ 로 건조, 및 진공하 농축한 다음 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제해 180 mg 백색 고체를 수득했다. MS: [M+H]⁺ = 590.

<2567>

실시예 474

<2568>

rac-모르폴린-4-카르복실산 (2-{[4,6-디클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드의 제조



<2569>

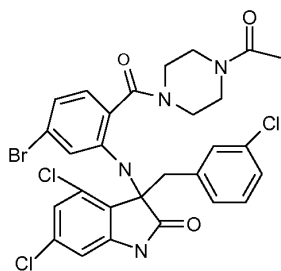
M. W. 539.89 $C_{25}H_{29}Cl_3N_4O_3$

<2570>

표제 화합물을 rac-4-아세틸-피페라진-1-카르복실산 (2-{[6-브로모-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-이소프로필-아미노}-에틸)-아미드와 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: [M+H]⁺ = 539.

<2571> 실시예 475

<2572> rac-3-[2-(4-아세틸-피페라진-1-카르보닐)-5-브로모-페닐아미노]-4,6-디클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온의 제조

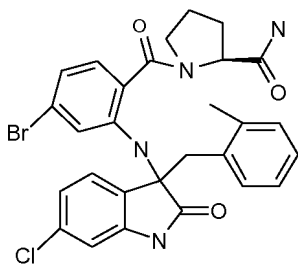


<2573> M. W. 650.79 $C_{28}H_{24}BrCl_3N_4O_3$

<2574> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 649$.

<2575> 실시예 476

<2576> rac-(S)-1-{4-브로모-2-[6-클로로-3-(2-메틸-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-벤조일}-피롤리딘-2-카르복실산 아미드의 제조

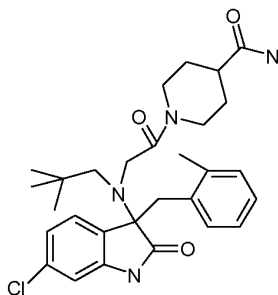


<2577> M. W. 581.90 $C_{28}H_{26}BrClN_4O_3$

<2578> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 581$.

<2579> 실시예 477

<2580> rac-1-{2-[6-클로로-3-(2-메틸-벤질)-2-옥소-2,3-디히드로-1H-인돌-3-일]-2,2-디메틸-프로필}-아미노}-아세틸}-피페리딘-4-카르복실산 아미드의 제조

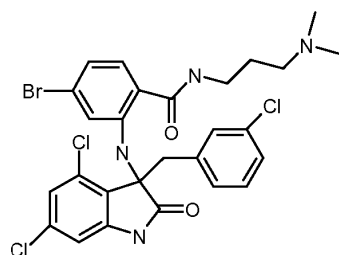


<2581> M. W. 525.10 $C_{29}H_{37}ClN_4O_3$

<2582> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 525$.

<2583> 실시예 478

<2584> rac-4-브로모-2-[4,6-디클로로-3-(3-클로로-벤질)-2-옥소-2,3 디히드로-1H-인돌-3-일아미노]-N-(3-디메틸아미노-프로필)-벤즈아미드의 제조



<2585> M. W. 624.80 $C_{27}H_{26}BrCl_3N_4O_2$

<2586> 표제 화합물을 rac-3-{[2-(4-아세틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-시클로헥실-아미노}-6-클로로-3-(3-클로로-벤질)-1,3-디히드로-인돌-2-온과 유사한 절차에 따라 제조했다. MS: $[M+H]^+ = 623$.

<2587> 실시예 479

<2588> 인 비트로 (In vitro) 어세이

<2589> 세포-기반 어세이에서, p53 및 MDM2 단백질 사이의 상호 작용을 억제하는 화합물의 능력을 측정하였다. 상 기 p53 및 MDM2 단백질 사이의 상호 작용을 억제하는 화합물의 능력을 HTRF (균일시간분해형광법; homogeneous time-resolved fluorescence) 어세이로 측정하였으며, 여기서 제조한 GST-태깅된 MDM2 는, p53 의 MDM2-상호작용 부위와 유사한 펩타이드에 부착된다 (Lane 등). GST-MDM2 단백질과 p53-펩타이드 (이의 N-말단에 비오틴화됨) 의 결합은, 유로퓸 (Eu)-표지된 항-GST 항체 및 스트렙타비딘-컨쥬게이션된 알로피코시아닌 (APC) 사이의 FRET (형광공명에너지전달; fluorescence resonance energy transfer) 로 기록된다.

<2590> 시험은 흑색의 평평한 바닥 384-웰 플레이트 (Costar) 에서, 90 nM 비오틴레이트 펩타이드, 160 ng/ml GST-MDM2, 20 nM 스트렙타비딘-APC (PerkinElmerWallac), 2 nM Eu-표지된 항-GST-항체 (PerkinElmerWallac), 0.2% 소혈청 알부민 (bovine serum albumin; BSA), 1 mM 디티오프로판 (DTT) 및 20 mM 트리스-보레이트 염수 (TBS) 를 하기와 같이 함유해 총부피를 40 μ L 로 하여 수행한다: 각 웰에 반응 완충액 중 GST-MDM2 10 μ L (640 ng/ml 작업 용액) 을 첨가함. 각 웰에 희석된 화합물 10 μ L (반응 완충액 중 1:5 로 희석) 을 첨가, 진탕시켜 혼합함. 각 웰에 반응 완충액 중 비오틴화 p53 펩타이드 20 μ L (180 nM 작업 용액) 를 첨가 및 진탕기에서 혼합함. 37°C 에서 1 시간 동안 인큐베이션 함. 0.2% BSA 와의 TBS 완충액 중 20 μ L 스트렙타비딘-APC 및 Eu-항-GST 항체 혼합물 (6 nM Eu-항-GST 및 60 nM 스트렙타비딘-APC 작업 용액) 을 첨가하고, 실온에서 30 분 동안 진탕시키고, TRF-가능 플레이트 판독기로 665 및 615 nm 에서 판독한다 (Victor 5, Perkin ElmerWallac). 만약 명시되지 않는다면 시약은 Sigma Chemical Co. 에서 구매한 것이다.

<2591> 실시예 IC₅₀ (nM, 0.02% BSA)

<2592> 6 1.1693

<2593> 11 3.7299

<2594> 19 2.561

<2595> 49 2.539

<2596> 62 3.6761