



(19) 대한민국특허청(KR)
 (12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2010년07월15일
 (11) 등록번호 10-0970294
 (24) 등록일자 2010년07월07일

(51) Int. Cl.

C07D 403/14 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)
 A61K 31/454 (2006.01) A61K 31/4545 (2006.01)

(21) 출원번호 10-2008-7000421

(22) 출원일자(국제출원일자) 2006년06월08일

심사청구일자 2008년01월07일

(85) 번역문제출일자 2008년01월07일

(65) 공개번호 10-2008-0018250

(43) 공개일자 2008년02월27일

(86) 국제출원번호 PCT/JP2006/311975

(87) 국제공개번호 WO 2006/132436

국제공개일자 2006년12월14일

(30) 우선권주장

60/692,039 2005년06월17일 미국(US)

(뒷면에 계속)

(56) 선행기술조사문헌

WO2004089470 A2*

*는 심사관에 의하여 인용된 문헌

(73) 특허권자

니쁜다바코 산교 가부시키가이샤

일본 도쿄도 미나도쿠 도라노몽 2-2-1

(72) 발명자

야마모토, 히로시

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼초 1
방 1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸
소고 쟁큐쇼 내

오헤, 야스히로

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼초 1
방 1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸
소고 쟁큐쇼 내

(뒷면에 계속)

(74) 대리인

이석재, 장수길

전체 청구항 수 : 총 23 항

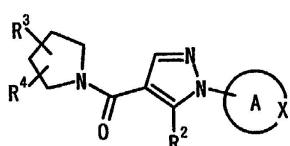
심사관 : 양인수

(54) 복소환 화합물

(57) 요약

본 발명은 하기 화학식 1'로 표시되는 화합물 또는 그의 염 및 해당 화합물 또는 그의 염을 함유하는, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제, 또는 11 β HSD1 저해제를 제공한다.

<화학식 1'>



식 중, 환 A, R², R³, R⁴ 및 X는 명세서 중에서 정의한 바와 같다.

(72) 발명자

고또, 히로유키

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

하라다, 가즈히또

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

야따, 신지

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

니시우, 준

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

가꾸마니, 마코또

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

후지이, 슌스케

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

아사하나, 고파

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

이또, 다카시

일본 5691125 오사까후 다까쓰끼시 무라사끼쵸 1방
1고 니쁜다바코 산교 가부시키가이샤 이야꾸 소고
겐큐쇼 내

(30) 우선권주장

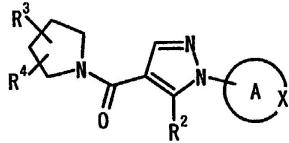
60/772,734	2006년02월13일	미국(US)
JP-P-2005-00168901	2005년06월08일	일본(JP)
JP-P-2006-00027097	2006년02월03일	일본(JP)
JP-P-2006-00138252	2006년05월17일	일본(JP)

특허청구의 범위

청구항 1

하기 화학식 1'로 표시되는 화합물 또는 그의 염.

<화학식 1'>



식 중,

환 A는,

(1) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는

(2) 시클로알킬기이고,

상기 환 A는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기 R¹로 치환될 수도 있고,

상기 치환기 R¹은,

1) 수소 원자,

2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및

e) C₁₋₆알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있고(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C_{1-6} 알콕시기)),

e) C_{1-6} 알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임),

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(g) C_{1-6} 알콕시기, 또는

(h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(i) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기를 형성할 수 있고(해당 양 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기),

d) 카르복실기,

e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

g) 옥소기,

h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

i) C_{1-6} 알콕시기)),

3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
c) C_{1-6} 알콕시기, 및

d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기)임),

4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)),

(c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

5) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환

기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

6) 시클로알킬기,

7) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

8) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

9) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 할로겐 원자,

(c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

(d) $-NR^{38}R^{39}$ (식 중, R^{38} 및 R^{39} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-NR^{40}R^{41}$ (식 중, R^{40} 및 R^{41} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 C_{1-6} 알콕시기이거나, 또는 R^{40} 과 R^{41} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 $-S(=O)_2R^{42}$ (식 중, R^{42} 는 C_{1-6} 알킬기임)이거나, 또는 R^{38} 과 R^{39} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

(e) $-CO-NR^{43}R^{44}$ (식 중, R^{43} 및 R^{44} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{43} 과 R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)

음), 및

(f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기, a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기,

(d) 할로겐 원자,

(e) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기,

(g) 시아노기, 및

(h) C_{1-6} 알콕시기)이고;

$-X-$ 는,

(1) $-N(R^1)$ -(식 중, R^1 은 상기와 같음), 또는

(2) $-C(R^7R^8)$ -(식 중, R^7 및 R^8 은 각각 동일하거나 상이하고,

1) 수소 원자,

2) $-NR^{16}R^{17}$ -(식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-NR^{36}R^{37}$ -(식 중, R^{36} 및 R^{37} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{36} 과 R^{37} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

3) $-CONR^{18}R^{19}$ -(식 중, R^{18} 및 R^{19} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (a) 할로겐 원자, 및 (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는

5) 카르복실기임)이고;

R^2 는,

(1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: 1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (a) 수산기, 및 (b) C_{1-6} 알콕시기), 및 2) C_{1-6} 알콕시기)이고;

R^3 및 R^4 는 각각 동일하거나 상이하고,

(1) 수소 원자,

(2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 $-OCO-C_{1-6}$ 알킬기로 치환됨),

(3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 4)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨:

1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨: (a) 할로겐 원자, 및 (b) 수산기),

2) C_{1-6} 알콕시기(해당 C_{1-6} 알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환됨),

3) 카르복실기, 및

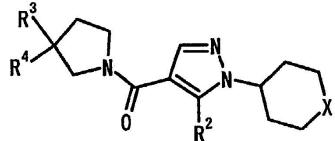
4) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

(4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨: 1) 할로겐 원자, 및 2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이다. (단, R^3 및 R^4 는 동시에 수소 원자가 될 수 없음)

청구항 2

하기 화학식 1로 표시되는 화합물 또는 그의 염.

<화학식 1>



식 중,

$-X-$ 는,

(1) $-N(R^1)-(식 중, R^1은,$

1) 수소 원자,

2) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음):

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

e) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하

기 균으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 균으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있고,

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있고(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C₁₋₆알콕시기)),

e) C₁₋₆알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임),

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C₁₋₆알킬기, b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및 c) 옥소기),

(g) C₁₋₆알콕시기, 또는

(h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(i) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 균으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기),

d) 카르복실기,

e) -CO-C₁₋₆알킬기,

f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²과 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

g) 옥소기,

h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),

3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

c) C_{1-6} 알콕시기, 및

d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기)임),

4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)),

(c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C₁₋₆알킬기, b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C₁₋₆알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

5) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

6) 시클로알킬기,

7) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

8) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

9) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 할로겐 원자,

(c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치

환될 수도 있음: a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(d) -NR^{38,39}R (식 중, R³⁸ 및 R³⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-NR^{40,41}R (식 중, R⁴⁰ 및 R⁴¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 C₁₋₆알콕시기이거나, 또는 R⁴⁰과 R⁴¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 -S(=O)₂-R⁴² (식 중, R⁴²는 C₁₋₆알킬기임)이거나, 또는 R³⁸과 R³⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

(e) -CO-NR^{43,44}R (식 중, R⁴³ 및 R⁴⁴는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴³과 R⁴⁴는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(f) -COO-C₁₋₆알킬기), 또는

11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음):

(a) 카르복실기,

(b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(c) 시클로알킬기,

(d) 할로겐 원자,

(e) -CO-NR^{45,46}R (식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵과 R⁴⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(f) -COO-C₁₋₆알킬기,

(g) 시아노기 및

(h) C₁₋₆알콕시기)임), 또는

(2) -C(R⁷R⁸)-(식 중, R⁷ 및 R⁸은 각각 동일하거나 상이하고,

1) 수소 원자,

2) -NR¹⁶R¹⁷ (식 중, R¹⁶ 및 R¹⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-NR^{36,37}R (식 중, R³⁶ 및 R³⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁶과 R³⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R¹⁶과 R¹⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

3) -CONR^{18,19}R (식 중, R¹⁸ 및 R¹⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (a) 할로겐 원자, 및 (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이거나, 또는 R¹⁸과 R¹⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

- 4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는
 5) 카르복실기임)이고;

R^2 는,

(1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: 1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (a) 수산기, 및 (b) C_{1-6} 알콕시기), 및 2) C_{1-6} 알콕시기)이고;

R^3 및 R^4 는 각각 동일하거나 상이하고,

(1) 수소 원자,

(2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 $-COO-C_{1-6}$ 알킬기로 치환됨),

(3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 4)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨:

1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨: (a) 할로겐 원자, 및 (b) 수산기),

2) C_{1-6} 알콕시기(해당 C_{1-6} 알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환됨),

3) 카르복실기, 및

4) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

(4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환됨: 1) 할로겐 원자, 및 2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이다. (단, R^3 및 R^4 는 동시에 수소 원자가 될 수 없음)

청구항 3

제1항 또는 제2항에 있어서, $-X-$ 가 $-C(R^7R^8)-(식 중, R^7 및 R^8은 제1항과 동일한 의미임)$ 인 화합물 또는 그의 염.

청구항 4

제1항 또는 제2항에 있어서, R^8 이

1) $-NR^{16}R^{17}$ (식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

2) $-CONR^{18}R^{19}$ (식 중, R^{18} 및 R^{19} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

3) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인

화합물 또는 그의 염.

청구항 5

제1항 또는 제2항에 있어서, $-X-$ 가 $-N(R^1)-(식 중, R^1은 제1항과 동일한 의미임)$ 인 화합물 또는 그의 염.

청구항 6

제1항 또는 제2항에 있어서, R¹이

1) 수소 원자,

2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기) 및

e) C₁₋₆알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C₁₋₆알콕시기)),

e) C₁₋₆알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C₁₋₆알킬기, b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및 c) 옥소기), 또는

(g) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(h) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

- a) 할로겐 원자,
- b) 수산기,
- c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),
- d) 카르복실기,
- e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,
- f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 와 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- g) 옥소기,
- h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- i) C_{1-6} 알콕시기)(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없음)),

3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

- a) 수산기,
- b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- c) C_{1-6} 알콕시기, 및
- d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기)임),

4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

- a) 할로겐 원자,
- b) 수산기,
- c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는

(c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

5) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

6) 시클로알킬기,

7) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로

치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

8) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

9) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 할로겐 원자,

(c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(d) -NR³⁸R³⁹(식 중, R³⁸ 및 R³⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-NR⁴⁰R⁴¹(식 중, R⁴⁰ 및 R⁴¹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 C₁₋₆알콕시기이거나, 또는 R⁴⁰과 R⁴¹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 -S(=O)₂-R⁴²(식 중, R⁴²는 C₁₋₆알킬기임)이거나, 또는 R³⁸과 R³⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

(e) -CO-NR⁴³R⁴⁴(식 중, R⁴³ 및 R⁴⁴는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴³과 R⁴⁴는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(f) -COO-C₁₋₆알킬기), 또는

11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

(a) 카르복실기,

(b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(c) 시클로알킬기,

(d) 할로겐 원자,

(e) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵과 R⁴⁶는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(f) -COO-C₁₋₆알킬기,

(g) 시아노기, 및

(h) C_{1-6} 알콕시기)인

화합물 또는 그의 염.

청구항 7

제1항 또는 제2항에 있어서, R^1 이

1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

e) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나,

또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C_{1-6} 알콕시기)),

e) C_{1-6} 알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(g) C₁₋₆알콕시기, 또는

(h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(i) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),

d) 카르복실기,

e) -CO-C₁₋₆알킬기,

f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²과 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

g) 옥소기,

h) -NR²⁴R²⁵(식 중, R²⁴ 및 R²⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁴와 R²⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

i) C₁₋₆알콕시기)(단, R⁵ 및 R⁶은, 하기 군으로부터 선택되는 치환기의 어떠한 조합도 될 수 없음. (i) 수소 원자 및 (ii) 비치환된 C₁₋₆알킬기)),

2) -COOR¹⁰(식 중, R¹⁰은,

(a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) -NR²⁶R²⁷(식 중, R²⁶ 및 R²⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁶과 R²⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

c) C₁₋₆알콕시기, 및

d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C₁₋₆알킬기, b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및 c) 옥소기)임),

3) -COR¹¹(식 중, R¹¹은,

(a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는

(c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

4) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수

도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

5) 시클로알킬기,

6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

(a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(b) 시클로알킬기,

(c) 할로겐 원자,

(d) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵와 R⁴⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(e) -COO-C₁₋₆알킬기,

(f) 시아노기, 및

(g) C₁₋₆알콕시기)

인 화합물 또는 그의 염.

청구항 8

제1항 또는 제2항에 있어서, R¹이

1) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및

e) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C_{1-6} 알콕시기)),

e) C_{1-6} 알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기), 또는

(g) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(h) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),

d) 카르복실기,

e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

g) 옥소기,

h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

i) C_{1-6} 알콕시기)(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없음),

2) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

c) C_{1-6} 알콕시기, 및

d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기)임),

3) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할

로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는

(c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C₁₋₆알킬기, b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C₁₋₆알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

4) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

5) 시클로알킬기,

6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

(a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(b) 시클로알킬기,

(c) 할로겐 원자,

(d) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(e) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기,

(f) 시아노기, 및

(g) C_{1-6} 알콕시기)

인 화합물 또는 그의 염.

청구항 9

제1항 또는 제2항에 있어서, R^2 가 시클로프로필기 또는 1-메틸시클로프로필기인 화합물 또는 그의 염.

청구항 10

삭제

청구항 11

제1항에 있어서, $R^1\circ]$

1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

(a) 수소 원자,

(b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 카르복실기,

d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

e) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),

(d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) 할로겐 원자,

c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할

로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) 옥소기, 및 (iv) C_{1-6} 알콕시기)),

e) C_{1-6} 알콕시기, 및

f) 카르복실기),

(e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는

(f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(9) C_{1-6} 알콕시기, 또는

(h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

이거나, 또는

(i) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기),

d) 카르복실기,

e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

g) 옥소기,

h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나,

또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

i) C_{1-6} 알콕시기)(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없음)),

2) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 수산기,

b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

c) C_{1-6} 알콕시기, 및

d) 아릴기), 또는

(b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기)임),

3) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

(a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

a) 할로겐 원자,

b) 수산기,

c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

e) C_{1-6} 알콕시기,

f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

g) 카르복실기, 및

h) 아릴옥시기),

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음:

a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)),

또는 (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) C_{1-6} 알킬기, b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및 c) 옥소기),

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는

(e) 카르복실기임),

4) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음):

(a) 카르복실기,

(b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

(c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

5) 시클로알킬기,

6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은, C₁₋₆알킬기임),

8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

9) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음):

(a) 카르복실기,

(b) 할로겐 원자,

(c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

(d) -NR³⁸R³⁹(식 중, R³⁸ 및 R³⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-NR⁴⁰R⁴¹(식 중, R⁴⁰ 및 R⁴¹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 C₁₋₆알콕시기이거나, 또는 R⁴⁰과 R⁴¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 -S(=O)₂-R⁴²(식 중, R⁴²는 C₁₋₆알킬기임)이거나, 또는 R³⁸과 R³⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

(e) -CO-NR⁴³R⁴⁴(식 중, R⁴³ 및 R⁴⁴는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴³과

R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

(f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

10) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음:

(a) 카르복실기,

(b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음: a) 할로겐 원자, b) 수산기, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

(c) 시클로알킬기,

(d) 할로겐 원자,

(e) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

(f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기,

(g) 시아노기, 및

(h) C_{1-6} 알콕시기)

인 화합물 또는 그의 염.

청구항 12

제1항에 있어서, 하기로부터 선택되는 화합물 또는 그의 염.

(1) 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,

(2) 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(3)

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,

(4)

1-[1-(1-카르바모일페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(5) 1-{1-[1-(2-카르복시페닐카르바모일)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(6) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시메틸페닐카르바모일)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(7) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로필카르바모일)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(8) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(9) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시-1,1-디메틸에틸카르바모일)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

- (10) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (11) 1-{1-[1-(2-아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (12) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1,1-디옥소티오모르폴린-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (13) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (14) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (15) 1-{1-[1-(아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (16) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (17) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (18) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4,4-디플루오로페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (19) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3-디플루오로페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (20) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (21) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (22) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (23) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-메틸에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (24) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (25) 1-{1-[1-(4-카르복시페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (26) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (27) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시메틸페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (28) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시메틸아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (29) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메틸페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (30) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-이소프로필페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

- (31) 1-{1-[1-(4-아세틸피페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (32) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시페페리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (33) 1-{1-[1-(4-카르바모일피페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (34) 1-{1-[1-(3-카르바모일아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (35) 1-{1-[1-(4-아미노피페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (36) 1-{1-[1-(3-아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (37) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (38) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-디메틸아미노피페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (39) 1-{1-[1-(4-아세틸아미노피페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (40) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (41) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-디메틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (42) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸피페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- (43) 1-{1-[1-(1-아세틸피페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (44) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-옥소피페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (45) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (46) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (47) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (48) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,4,4-테트라플루오로페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (49) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-2-메틸프로필카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (50) 1-(1-{1-[(S)-1-벤질-2-히드록시에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- (51) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-페닐에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(52)

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-3-메틸부틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(53) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(54) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로펜틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(55) 1-[1-(1-벤젠술포닐아미노카르보닐페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(56) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메탄술포닐아미노카르보닐페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(57) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메톡시카르보닐페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(58) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(59) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(60) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(61) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(62) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(63) 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(64) 1-[1-(1-시클로프로판카르보닐페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(65) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(66) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[1-(4-플루오로페닐)시클로프로판카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(67) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

(68) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(69) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(70) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노-2-메틸프로페오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(71) 1-(1-{1-[S)-2-아세틸아미노프로페오닐]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

(72) 1-(1-{1-[S)-2-아세틸아미노-3-메틸부티릴]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-

3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(73) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,3-트리플루오로프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(74) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-5-옥소피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(75) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(76) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시-2,2-디메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(77) 1-{1-[1-(2-아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(78) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(79) 1-{1-[1-(2-아미노-2-메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(80) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시부티릴)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(81) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(82) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-메틸피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(83) 1-{1-[1-(3-아미노프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(84) 1-{1-{1-[(S)-2-아미노-3-메틸부티릴]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(85) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(86) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(87) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-이소부티릴아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(88) 1-{1-[1-(2-시클로프로판카르보닐아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(89) 1-{1-{1-[(S)-1-아세틸피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(90) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메탄솔포닐아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(91) 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

(92) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

(93) 1-{1-[1-(3-카르바모일프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리

플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(94) 1-[1-(1-카르바모일메틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(95) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메틸카르바모일메틸파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(96) 1-{1-[1-(1-카르바모일-1-메틸에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(97) 1-{1-[1-(2-카르바모일에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(98) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필메틸파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(99) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(100) 1-[5-시클로프로필-1-(1-디메틸카르바모일메틸파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(101) 1-[1-(1-카르복시메틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(102) 1-[1-(1-카르복시에틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(103) 1-{1-[1-(1-카르바모일에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(104) 1-{1-[1-(2-카르복시-2-메틸프로필)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(105) 1-{1-[1-(2-카르바모일-2-메틸프로필)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(106) 1-{1-[1-(1-카르바모일시클로프로필메틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(107) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)시클로프로필메틸]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

(108) 1-[5-시클로프로필-1-(1-트리플루오로메탄솔포닐파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(109) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에탄솔포닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(110) 1-{1-[1-(1-시아노이미노에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(111) 1-(1-{1-[시아노이미노(메틸아미노)메틸]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(112) 1-{1-[1-(N-시아노이미드일)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

(113) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)벤조산,

(114) 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)벤

조산,

- (115) 5-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)티아펜-2-카르복실산,
- (116) 2-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산,
- (117) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- (118) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-시클로프로필-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- (119) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-히드록시메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- (120) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-트리플루오로메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- (121) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (122) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (123) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (124) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (125) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (126) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (127) (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염,
- (128) (+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염,
- (129) 1-[5-시클로프로필-1-(1-파라진-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- (130) 1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (131) 1-[5-시클로프로필-1-(trans-4-우레이도시클로헥실)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (132) 1-{5-시클로프로필-1-[trans-4-(1H-테트라졸-5-일)시클로헥실]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- (133) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(4-트리플루오로메틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘,
- (134) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메톡시시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘,
- (135) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-페

닐-3-트리플루오로메틸-피롤리딘,

(136) 3-(2-클로로페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,4-디플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘,

(137) 3-(2-클로로피리딘-3-일)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘,

(138) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-5-(2,2,3,3-테트라메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(139)

1-{5-시클로헥실-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(140) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메톡시페닐)피롤리딘,

(141) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-트리플루오로메틸페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(142) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-카르복시-2-메틸-프로필]메틸카르바모일}피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(143) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-메톡시-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(144) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-5-(1-히드록시메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(145) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(티아졸-2-일카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(146) 1-{1-[1-(이소프로록시카르바모일)피페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(147) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-플루오로벤질카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(148) 1-{1-[1-(2,3-디히드로인돌-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(149) 1-{1-[1-(2,3-디히드로[1,4]옥사진-4-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(150) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,6-디클로로피리딘-3-일카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(151) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(2,3,4,5-테트라하이드로벤조[b]아제핀-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(152) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)벤조산에틸,

(153) 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐-피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(154) 1-{1-[1-(3-카르복시-3-메틸-부티릴)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(155) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페녹시아세틸)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

- (156) 1-{1-[1-(3-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (157) 1-{1-[1-(2-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (158) 1-[5-시클로프로필-1-(1-옥살릴페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (159) 1-{1-[1-(4-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (160) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[2-(4-플루오로페닐)아세틸]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (161) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-트리플루오로메틸벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (162) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-메톡시벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (163) 1-{1-[1-(4-플루오로벤질)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘 염산염,
- (164) 1-[1-(1-벤젠술포닐-페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- (165) 1-{1-[1-(4-카르바모일페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (166) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (167) 1-{1-[1-(5-카르바모일-페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (168) 1-{1-[1-(4-아미노페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (169) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(2-옥소옥사졸리딘-3-일)페닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (170) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(3-메톡시우레이도)페닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (171) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메탄술포닐아미노페닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (172) 1-[1-(1-에톡시카르바모일페페리딘-4-일)-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (173) 1-[1-(5-클로로페리딘-2-일)아제티딘-3-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (174) 1-{1-[1-(5-클로로페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-메톡시메틸-3-페닐페롤리딘,
- (175) 1-{1-[1-(5-시아노페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- (176) 3-(2-아세톡시에틸)-3-(4-플루오로페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘 염산염,
- (177) {(3S*, 4R*)-3-메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보

닐}-4-페닐피롤리딘 염산염,

(178) 6-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)나코틴산메틸,

(179) 2-{1-[5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-피리미딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]피롤리딘-3-일}벤조산메틸,

(180) 3-(2-히드록시메틸페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(피리미딘-2-일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘 염산염,

(181) 1-[5-시클로프로필-1-(1-피리딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-히드록시-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(182) 1-{1-[1-(4-아세틸아미노페닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘,

(183) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)-3-플루오로벤조산나트륨,

(184) 3-(2-시아노페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘,

(185) 3-히드록시메틸-1-{1-[1-(4-메톡시피리미딘-2-일)피페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-페닐피롤리딘 염산염,

(186) 3-(3,5-디플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(피리미딘-2-일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘 염산염,

(187) 1-{1-[1-(3-클로로-피리딘-2-일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)피롤리딘,

(188) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(티아졸-2-일)피롤리딘,

(189) (S)-2-[(trans-4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}-시클로헥산카르보닐)-메틸-아미노]-3-메틸부티르산,

(190) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[trans-4-(2-플루오로페닐카르바모일)시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘, 및

(191) cis-4-{5-(1-메틸시클로프로필)-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}-시클로헥산카르복실산.

청구항 13

제1항, 제2항, 제11항 및 제12항 중 어느 한 항에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하며,

(1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,

(2) 대사 증후군,

(3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건(vascular event),

(4) 과식증,

(5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,

(6) 면역능 저하를 나타내는 질환,

(7) 녹내장, 및

(8) 골다공증으로 구성된 군으로부터 선택되는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태를 치료 또는 예방하기 위한 의약 조성물.

청구항 14

삭제

청구항 15

삭제

청구항 16

삭제

청구항 17

삭제

청구항 18

삭제

청구항 19

삭제

청구항 20

삭제

청구항 21

삭제

청구항 22

삭제

청구항 23

제13항에 기재된 의약 조성물을,

- (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- (2) 대사 증후군,
- (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- (4) 과식증,
- (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- (7) 녹내장, 및
- (8) 골다공증으로 구성된 군으로부터 선택되는 질환의 치료 또는 예방의 용도에 사용할 수 있거나 또는 사용해 야만 한다는 것을 기재한 해당 의약 조성물에 대한 기재물을 포함하는 상업 패키지.

청구항 24

제13항에 있어서,

- (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,

- (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제, 및
- (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 의약 조성물.

청구항 25

삭제

청구항 26

삭제

청구항 27

삭제

청구항 28

- (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제, 및
- (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 제1항, 제2항, 제11항 및 제12항 중 어느 한 항에 기재된 화합물 또는 그의 염을 조합하여 이루어지며,
 - (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,
 - (2) 대사 증후군,
 - (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건(vascular event),
 - (4) 과식증,
 - (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
 - (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
 - (7) 녹내장, 및
- (8) 골다공증으로 구성된 군으로부터 선택되는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태를 치료 또는 예방하기 위한 의약.

청구항 29

삭제

청구항 30

삭제

청구항 31

삭제

청구항 32

삭제

청구항 33

삭제

청구항 34

삭제

청구항 35

삭제

청구항 36

삭제

청구항 37

2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸.

청구항 38

(S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸.

청구항 39

(S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온.

청구항 40

(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘 또는 그의 염.

청구항 41

1-(3,5-비스트리플루오로메틸페닐)-3-((1S,2S)-2-디메틸아미노시클로헥실)-티오우레아의 존재하에, 1-((E)-2-니트로비닐)-2-트리플루오로메틸벤젠과 말론산디메틸을 반응시키는 공정을 포함하는 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸의 제조 방법.

청구항 42

2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸을 환원 및 폐환하는 공정을 포함하는 (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸의 제조 방법.

청구항 43

(S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸을 가수분해 및 탈탄산하는 공정을 포함하는 (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온의 제조 방법.

청구항 44

(S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온을 환원하는 공정과, 산으로 처리하여 염을 형성하는 공정을 포함하는 (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 염의 제조 방법.

명세서**기술분야**

[0001]

본 발명은 복소환 화합물, 보다 상세하게는 HSD1 저해제로서 유용한 복소환 화합물에 관한 것이다.

배경기술

[0002]

쿠싱 증후군에서 전형적으로 관찰되는 바와 같이, 전신의 글루코코르티코이드 작용의 과잉은, 내장 지방의 축적을 비롯하여 체지방 분포의 특징적인 변화, 인슐린 저항성, 당뇨병, 고지혈증, 혈압 상승 등의 대사 이상을 발생시킨다.

[0003]

글루코코르티코이드가 당뇨병에 있어서 중심적인 역할을 담당한다는 것, 예를 들면 당뇨병이 있는 동물로부터

하수체 또는 부신을 제거하면, 당뇨병의 가장 위독한 증상을 완화하여, 혈중의 글루코오스 농도를 저하시킨다는 것이 반세기 이전부터 알려져 있다(Long, C. D. and F. D. W. Leukins(1936), J. Exp. Med. 63: 465-490 및 Houssay, B. A. (1942), Endocrinology, 30: 884-892 참조).

[0004] 글루코코르티코이드가 (1) 지방 세포의 분화 프로그램에 필수적이고, 대표적인 인슐린 길항 호르몬으로서 인슐린에 의한 당지질 대사를 다양한 단계에서 저해한다는 것, (2) 글루코코르티코이드는 레닌 기질, 앤지오텐시노겐의 생산 유도나 앤지오텐신 II 수용체의 발현 증강 등을 통해 혈압을 상승시킨다는 것, (3) 강력한 렙틴 길항 호르몬으로서, 과식, 비만을 발생시킨다는 것 등이 알려져 있다(임상의 vol. 30 no 9, 2004; 1782-1787 참조).

[0005] 또한, 지방 조직에서의 글루코코르티코이드 작용의 이상 활성화가 당뇨병, 고지혈증, 고혈압증, 지방간 등의 대사성 질환이 축적된 대사 증후군의 병태에 관여할 가능성성이 있다는 것이 주목받고 있다 (Moller DE. New drug targets for 2 diabetes and the metabolic syndrome. Nature 2001; 414: 821-7 참조).

[0006] 이들 사실은, 글루코코르티코이드의 효과를 감소시키는 것이 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 또는 이들 대사성 질환이 축적된 대사 증후군, 나아가서는 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중으로 대표되는 치사적 혈관 사건(vascular event)의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0007] 글루코코르티코이드 작용을 발휘하는 활성형 글루코코르티코이드(인간에게 있어서는 코르티솔, 설치류에게 있어서는 코르티코스테론)는, 부신 뿐만 아니라 다양한 조직, 세포 중에서 변환 효소 11β -히드록시스테로이드 데히드로게나제 타입 1(11β HSD1)의 기능에 의해, 불활성인 11-케토 대사물인 코르티손 또는 11-디히드로코르티코스테론로부터 생산된다(Agurwal 외, J. Biol. Chem 264, 18939-46, 1989 참조). 11β HSD1 녹아웃 마우스는 투여된 불활성형 글루코코르티코이드를 활성형으로 변환할 수 없기 때문에, 이 효소가 생체에서의 유일한 활성형 글루코코르티코이드 변환 효소라는 것이 실증되어 있다(Kotelevtsev, Y et al.: Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 94: 14924, 1997 참조). 하수체성 쿠싱병에서 고글루코코르티코이드 혈증을 동반하고 있음에도 불구하고, 우연히도 11β HSD1 활성이 현저히 저하되어 있었기 때문에 일련의 쿠싱 증후가 누락된 증례가 보고되어 있다 (Tomlinson, JW et al.: J. Clin. Endocrinol. Metab., 87: 57, 2002 참조).

[0008] 이를 결과는, 11β HSD1 활성 조절이 글루코코르티코이드 작용의 발현에 중요하다는 것을 나타내고 있다. 즉, 11β HSD1 활성 조절이 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 또는 이들 대사성 질환이 축적된 대사 증후군, 나아가서는 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중으로 대표되는 치사적 혈관 사건의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0009] 지방 조직만으로 비만자와 동등한 수준의 11β HSD1을 과잉 발현하는 트랜스제닉 마우스는 내장 지방형 비만, 인슐린 저항성 당뇨병, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등, 대사 증후군의 주요한 요소를 겸비한다는 것이 명백하다 (Masuzaki, H et al.: Science 2001; 294: 2166-70 및 Masuzaki H et al.: J. Clin. Invest 2003; 112: 83-90 참조). 또한, 간 특이적으로 11β HSD1을 과잉 발현하는 트랜스제닉 마우스는, 내장 지방형 비만의 표현형밖에 나타내지 않지만, 인슐린 저항성 및 고혈압, 지방간 등의 병태를 나타낸다(Janice M. Paterson et al.: PNAS 2004; 101: 7088-7093 참조). 한편, 11β HSD1 녹아웃 마우스는, 스트레스 부하나 고지방식(high fat diet) 부하에 대한 간의 당신생 효소(PEPCK나 G6Pase 등)의 유도가 발생하지 않고, 당뇨병의 발증에 대하여 분명한 저항성을 나타낸다(Kotelevtsev, Y et al.: Proc. Natl. Acad. Sci. USA, 94: 14924, 1997 참조).

[0010] 또한, 11β HSD1 녹아웃 마우스의 간에서는, 지방 이화에 따른 분자군 및 이들 발현을 제어하는 PPAR α 의 발현이 현저히 증가하고 있으며, 혈중 트리글리세리드의 저하, HDL-콜레스테롤의 상승이 관찰되었다. 11β HSD1 녹아웃 마우스에서는, 고지방식 부하에 의해 유도되는 내장 지방 조직의 축적이거나 대사 이상의 발증이 분명히 억제된다고 보고되어 있다(Morton NM et al. J. Biol. Chem. 2001; 44: 41293-301 참조).

[0011] 실제로, 11β HSD1 결핍증에서는 인슐린 감수성이 항진하기 때문에, 이 효소의 효과를 저해하는 것은 인슐린 비의존성 당뇨병이나 비만에서의 치료 또는 예방에 유용하다고 기대되고 있다(Seckl, JR et al. Eur. J. Biochem. 249: 361, 1997 및 Morton NM et al. Diabetes 2004; 53: 931-938 참조).

[0012] 이들 지견은, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것이 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 또는 이들 대사성 질환이 축적된 대사 증후군, 나아가서는 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중으로 대표되는 치사적 혈관 사건의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 뒷받침하고 있다.

[0013] 부신 적출은, 식이 섭취와 시상 하부 신경 패티드 Y 발현의 양자를 증가시키는 절식의 효과를 약하게 한다. 이

것은, 식이 섭취의 촉진에서의 글루코코르티코이드의 역할을 지지하고, 뇌에서의 11β HSD1의 저해는 만복도를 증가시키며, 이 때문에 식이 섭취를 감소시킨다는 것을 시사하고 있다(Woods, S. C. et al.(1998) Science, 280: 1378-1383 참조). 즉, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것이 과식증의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0014] 스트레스 및 글루코코르티코이드는 인지 기능에 영향을 준다(de Quervain, D. J. -F., B. Roozendaal, and J. L. McGaugh(1998), Nature, 394: 787-790 참조). 실제로, 11β HSD1 녹아웃 마우스는, 가령(加齡)에 따른 인지 기능 장애가 현저히 개선되어 있고(Yau J L et al. PNAS 2001; 98: 4716-4721 참조), 최근 11β HSD1의 비특이적인 저해제 카르베녹솔론이 인간 고령자의 인지 기능 저하에 유용하다는 것이 보고되어 있다(Sandeep T C et al. PNAS 2004; 101: 6734-6739 참조). 또한, 11β HSD1은, 뇌에서의 글루코코르티코이드의 작용의 수준을 제어하고, 그에 따라 신경 독성에 기여하고 있다(Rajan, V., C. R. W. Edwards, and J. R. Seckl, J. (1996), Neuroscience, 16: 65-70 및 Seckl, J. R., Front.(2000), Neuroendocrinol. 18: 49-99 참조). 또한, 뇌에서의 글루코코르티코이드의 상기 및 공지된 효과에 기초하여, 뇌에서 11 β HSD1을 저해하면, 불안의 감소를 초래한다(Tronche, F. et al.(1999), Nature Genetics, 23: 99-103 참조). 따라서, 이들을 생각하면, 인간 뇌에서의 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것은, 코르티손의 코르티솔로의 재활성화를 방지하여, 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증 등의 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애 등의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0015] 글루코코르티코이드가 면역계를 억제한다는 것은 이미 알려진 사실이다. 따라서, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것은, 면역 부전 등의 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0016] 최근의 데이터는, 글루코코르티코이드 표적 수용체 및 11β HSD1 효소의 수준이 녹내장으로의 감수성을 결정하고 있다는 것을 시사하고 있다(Stokes, J. et al.(2000), Invest. Ophthalmol. 41: 1629-1638 참조). 따라서, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것은, 녹내장의 치료약 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0017] 글루코코르티코이드는, 골격의 발육 및 기능에서 필수적인 역할을 갖고 있지만, 과잉이 되면 유해하다. 글루코코르티코이드 유발 골 손실은, 적어도 부분적으로는 골아 세포 증식 및 콜라겐 합성의 억제를 포함하는 골 형성의 저해를 거쳐서 유발된다(Kim, C. H., S. L. Cheng, and G. S. Kim(1999), J. Endocrinol. 162: 371-379 참조). 골소절 형성에 대한 음성 효과는, 비특이적 11β HSD1 저해제 카르베녹솔론에 의해 차단할 수 있고, 이것은 글루코코르티코이드 효과에서의 11β HSD1의 중요한 역할을 시사하고 있다(Bellows, C. G., A. Ciaccia, and J. N. M. Heersche, (1998), Bone, 23: 119-125 참조). 따라서, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 것은, 골다공증의 치료 또는 예방에 유익하다는 것을 시사하고 있다.

[0018] 이에 따라, 11β HSD1의 효과를 감소시키는 활성을 갖는 물질은, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태, 예를 들면

[0019] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,

[0020] (2) 대사 증후군,

[0021] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중으로 대표되는 치사적 혈관 사건,

[0022] (4) 과식증,

[0023] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증 등의 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,

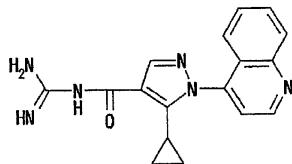
[0024] (6) 면역 부전 등의 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,

[0025] (7) 녹내장,

[0026] (8) 골다공증

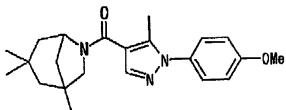
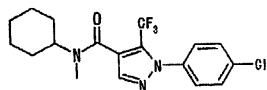
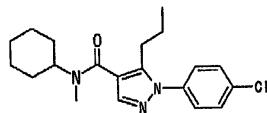
[0027] 등의 치료약 또는 예방약으로서 유용하다고 할 수 있다.

[0028] 복소환 화합물로서, 예를 들면 이하와 같은 것이 알려져 있다. 예를 들면, WO99/43663호 공보에는, 하기 복소환 화합물이 NHE1 저해 작용을 나타내는 화합물로서 개시되어 있다.



[0029]

[0030] 이어서, 이미 알려진 11β HSD1 저해제로서, 예를 들면 이하와 같은 것이 알려져 있다. WO2004/089470호 공보에는, 11β HSD1에 대하여 저해 작용을 나타내는 화합물로서, 하기 화합물이 개시되어 있다.



[0031]

발명의 상세한 설명

[0032] 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 등의 예방제 또는 치료제 등으로서 유용하며, 약효, 작용 시간, 특이성, 저독성, 경구 흡수성, 체내 동태 등에서, 의약품으로서의 보다 우수한 성질을 갖는 화합물의 개발이 강하게 요망되고 있다.

[0033]

[0033] 본 발명의 목적은, 상기 화합물을 포함하는 공지 화합물과는 화학 구조가 상이한 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 등의 예방제 또는 치료제 등으로서 유용한 HSD1 저해 작용 등을 나타내는 화합물 및 용도를 제공하는 것이다.

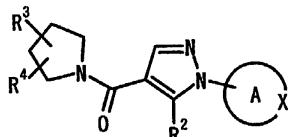
[0034]

[0034] 본 발명자들은, 하기에 나타내는 복소환 화합물이 우수한 HSD1 저해 작용을 갖고, 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 등의 예방제 또는 치료제 등으로서 유용하다는 것을 최초로 발견하였다. 이 지견에 기초하여 본 발명자들은 예의 연구를 거듭한 결과, 본 발명을 완성하기에 이르렀다. 즉, 본 발명은, 보다 상세하게는 하기와 같다.

[0035]

[1] 하기 화학식 1'로 표시되는 화합물 또는 그의 염.

화학식 1'



[0036]

[0037] [식 중,

[0038] 환 A는,

[0039] (1) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는

[0040] (2) 시클로알킬기이고,

[0041] 상기 환 A는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기 R¹로 치환될 수도 있음.

- [0042] 상기 치환기 R¹은,
- [0043] 1) 수소 원자,
- [0044] 2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,
- [0045] (a) 수소 원자,
- [0046] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0047] a) 수산기,
- [0048] b) 할로겐 원자,
- [0049] c) 카르복실기,
- [0050] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및
- [0051] e) C₁₋₆알콕시기),
- [0052] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),
- [0053] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0054] a) 수산기,
- [0055] b) 할로겐 원자,
- [0056] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0057] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0058] (i) 할로겐 원자,
- [0059] (ii) 수산기,
- [0060] (iii) 옥소기, 및
- [0061] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [0062] e) C₁₋₆알콕시기, 및
- [0063] f) 카르복실기),
- [0064] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임),
- [0065] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나

상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0066] a) C₁₋₆알킬기,

[0067] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[0068] c) 옥소기),

[0069] (g) C₁₋₆알콕시기, 또는

[0070] (h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

[0071] 이거나, 또는

[0072] (i) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0073] a) 할로겐 원자,

[0074] b) 수산기,

[0075] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기),

[0076] d) 카르복실기,

[0077] e) -CO-C₁₋₆알킬기,

[0078] f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²와 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0079] g) 옥소기,

[0080] h) -NR²⁴R²⁵(식 중, R²⁴ 및 R²⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁴와 R²⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0081] i) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음),

[0082] 3) -COOR¹⁰(식 중, R¹⁰은,

[0083] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0084] a) 수산기,

[0085] b) -NR²⁶R²⁷(식 중, R²⁶ 및 R²⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁶과 R²⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0086] c) C₁₋₆알콕시기, 및

[0087] d) 아릴기), 또는

[0088] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0089] a) C₁₋₆알킬기,

- [0090] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0091] c) 옥소기)임),
- [0092] 4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,
- [0093] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0094] a) 할로겐 원자,
- [0095] b) 수산기,
- [0096] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0097] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0098] e) C_{1-6} 알콕시기,
- [0099] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0100] g) 카르복실기, 및
- [0101] h) 아릴옥시기),
- [0102] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0103] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [0104] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)),
- [0105] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0106] a) C_{1-6} 알킬기,
- [0107] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0108] c) 옥소기),
- [0109] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는
- [0110] (e) 카르복실기임),
- [0111] 5) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0112] (a) 카르복실기,

[0113] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[0114] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0115] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0116] 6) 시클로알킬기,

[0117] 7) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0118] 8) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

[0119] 9) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0120] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0121] (a) 카르복실기,

[0122] (b) 할로겐 원자,

[0123] (c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

[0124] (d) $-NR^{38}R^{39}$ (식 중, R^{38} 및 R^{39} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-NR^{40}R^{41}$ (식 중, R^{40} 및 R^{41} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 C_{1-6} 알콕시기이거나, 또는 R^{40} 과 R^{41} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 $-S(=O)_2R^{42}$ (식 중, R^{42} 는 C_{1-6} 알킬기임)이거나, 또는 R^{38} 과 R^{39} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

[0125] (e) $-CO-NR^{43}R^{44}$ (식 중, R^{43} 및 R^{44} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{43} 과 R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

- [0126] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는
- [0127] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0128] (a) 카르복실기,
- [0129] (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기, a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0130] a) 할로겐 원자,
- [0131] b) 수산기, 및
- [0132] c) C_{1-6} 알콕시기),
- [0133] (c) 시클로알킬기,
- [0134] (d) 할로겐 원자,
- [0135] (e) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0136] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기],
- [0137] (g) 시아노기, 및
- [0138] (h) C_{1-6} 알콕시기)이고;
- [0139] $-X-$ 는,
- [0140] (1) $-N(R^1)$ -(식 중, R^1 은 상기와 같음), 또는
- [0141] (2) $-C(R^7R^8)$ -(식 중, R^7 및 R^8 은 각각 동일하거나 상이하고,
- [0142] 1) 수소 원자,
- [0143] 2) $-NR^{16}R^{17}$ (식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-NR^{36}R^{37}$ (식 중, R^{36} 및 R^{37} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{36} 과 R^{37} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0144] 3) $-CONR^{18}R^{19}$ (식 중, R^{18} 및 R^{19} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, 및 (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0145] 4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는
- [0146] 5) 카르복실기임)이고;
- [0147] R^2 는,
- [0148] (1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는

1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 수산기, 및 (b) C₁₋₆알콕시기), 및 2) C₁₋₆알콕시기)이고;

[0149] R³ 및 R⁴는 각각 동일하거나 상이하고,

[0150] (1) 수소 원자,

[0151] (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 2) 수산기, 3) C₁₋₆알콕시기, 및 4) -OCO-C₁₋₆알킬기),

[0152] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 6)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0153] 1) 할로겐 원자,

[0154] 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, (b) 수산기, 및 (c) C₁₋₆알콕시기),

[0155] 3) C₁₋₆알콕시기(해당 C₁₋₆알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음),

[0156] 4) 카르복실기,

[0157] 5) -COO-C₁₋₆알킬기, 및

[0158] 6) 시아노기),

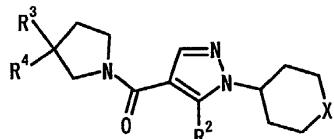
[0159] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 및 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0160] (5) 수산기, 또는

[0161] (6) C₁₋₆알콕시기임]

[0162] [2] 하기 화학식 1로 표시되는 화합물 또는 그의 염.

화학식 1



[0163]

[0164] [식 중,

[0165] -X-는,

[0166] (1) -N(R¹)-(식 중, R¹은,

[0167] 1) 수소 원자,

[0168] 2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[0169] (a) 수소 원자,

[0170] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0171] a) 수산기,

[0172] b) 할로겐 원자,

- [0173] c) 카르복실기,
- [0174] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및
- [0175] e) C₁₋₆알콕시기),
- [0176] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),
- [0177] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있고,
- [0178] a) 수산기,
- [0179] b) 할로겐 원자,
- [0180] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0181] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0182] (i) 할로겐 원자,
- [0183] (ii) 수산기,
- [0184] (iii) 옥소기, 및
- [0185] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [0186] e) C₁₋₆알콕시기, 및
- [0187] f) 카르복실기),
- [0188] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임),
- [0189] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0190] a) C₁₋₆알킬기,
- [0191] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0192] c) 옥소기),
- [0193] (g) C₁₋₆알콕시기, 또는
- [0194] (h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)
- [0195] 이거나, 또는

- [0196] (i) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0197] a) 할로겐 원자,
- [0198] b) 수산기,
- [0199] c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기),
- [0200] d) 카르복실기,
- [0201] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,
- [0202] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 와 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0203] g) 옥소기,
- [0204] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [0205] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [0206] 3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,
- [0207] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0208] a) 수산기,
- [0209] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0210] c) C_{1-6} 알콕시기, 및
- [0211] d) 아릴기), 또는
- [0212] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0213] a) C_{1-6} 알킬기,
- [0214] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0215] c) 옥소기)임),
- [0216] 4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,
- [0217] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0218] a) 할로겐 원자,
- [0219] b) 수산기,

- [0220] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0221] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0222] e) C_{1-6} 알콕시기,
- [0223] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0224] g) 카르복실기, 및
- [0225] h) 아릴옥시기),
- [0226] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0227] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [0228] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)),
- [0229] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0230] a) C_{1-6} 알킬기,
- [0231] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0232] c) 옥소기),
- [0233] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는
- [0234] (e) 카르복실기임),
- [0235] 5) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).
- [0236] (a) 카르복실기,
- [0237] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),
- [0238] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와

R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0239] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0240] 6) 시클로알킬기,

[0241] 7) $-S(=O)_2-R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0242] 8) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

[0243] 9) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0244] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0245] (a) 카르복실기,

[0246] (b) 할로겐 원자,

[0247] (c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

[0248] (d) $-NR^{38}R^{39}$ (식 중, R^{38} 및 R^{39} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-NR^{40}R^{41}$ (식 중, R^{40} 및 R^{41} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 C_{1-6} 알콕시기이거나, 또는 R^{40} 과 R^{41} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 $-S(=O)_2-R^{42}$ (식 중, R^{42} 는 C_{1-6} 알킬기임)이거나, 또는 R^{38} 과 R^{39} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

[0249] (e) $-CO-NR^{43}R^{44}$ (식 중, R^{43} 및 R^{44} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{43} 과 R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0250] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

[0251] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0252] (a) 카르복실기,

[0253] (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0254] a) 할로겐 원자,

- [0255] b) 수산기 및
- [0256] c) C_{1-6} 알콕시기),
- [0257] (c) 시클로알킬기,
- [0258] (d) 할로겐 원자,
- [0259] (e) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0260] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기],
- [0261] (g) 시아노기 및
- [0262] (h) C_{1-6} 알콕시기)임), 또는
- [0263] (2) $-C(R^7R^8)-($ 식 중, R^7 및 R^8 은 각각 동일하거나 상이하고,
- [0264] 1) 수소 원자,
- [0265] 2) $-NR^{16}R^{17}$ (식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-NR^{36}R^{37}$ (식 중, R^{36} 및 R^{37} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{36} 과 R^{37} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0266] 3) $-CONR^{18}R^{19}$ (식 중, R^{18} 및 R^{19} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, 및 (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0267] 4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는
- [0268] 5) 카르복실기임)이고;
- [0269] R^2 는,
- [0270] (1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 수산기, 및 (b) C_{1-6} 알콕시기), 및 2) C_{1-6} 알콕시기)이고;
- [0271] R^3 및 R^4 는 각각 동일하거나 상이하고,
- [0272] (1) 수소 원자,
- [0273] (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 2) 수산기, 3) C_{1-6} 알콕시기, 및 4) $-OCO-C_{1-6}$ 알킬기),
- [0274] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 6)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0275] 1) 할로겐 원자,
- [0276] 2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환

될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, (b) 수산기, 및 (c) C₁₋₆알콕시기),

[0277] 3) C₁₋₆알콕시기(해당 C₁₋₆알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음),

[0278] 4) 카르복실기,

[0279] 5) -COO-C₁₋₆알킬기, 및

[0280] 6) 시아노기),

[0281] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 및 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0282] (5) 수산기, 또는

[0283] (6) C₁₋₆알콕시기임]

[0284] [3] 상기 [1] 또는 [2]에 있어서, -X-가 -C(R⁷R⁸)-(식 중, R⁷ 및 R⁸은 상기 [1]과 동일한 의미임)인 화합물 또는 그의 염.

[0285] [4] 상기 [1] 내지 [3] 중 어느 하나에 있어서, R⁸이

[0286] 1) -NR¹⁶R¹⁷(식 중, R¹⁶ 및 R¹⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁶과 R¹⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0287] 2) -CONR¹⁸R¹⁹(식 중, R¹⁸ 및 R¹⁹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁸과 R¹⁹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[0288] 3) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인

[0289] 화합물 또는 그의 염.

[0290] [5] 상기 [1] 또는 [2]에 있어서, -X-가 -N(R¹)-(식 중, R¹은 상기 [1]과 동일한 의미임)인 화합물 또는 그의 염.

[0291] [6] 상기 [1], [2] 및 [5] 중 어느 하나에 있어서, R¹이

[0292] 1) 수소 원자,

[0293] 2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[0294] (a) 수소 원자,

[0295] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음).

[0296] a) 수산기,

[0297] b) 할로겐 원자,

[0298] c) 카르복실기,

[0299] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기) 및

[0300] e) C₁₋₆알콕시기),

[0301] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하

기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

[0302] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0303] a) 수산기,

[0304] b) 할로겐 원자,

[0305] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0306] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0307] (i) 할로겐 원자,

[0308] (ii) 수산기,

[0309] (iii) 옥소기, 및

[0310] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음),

[0311] e) C₁₋₆알콕시기, 및

[0312] f) 카르복실기),

[0313] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

[0314] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0315] a) C₁₋₆알킬기,

[0316] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[0317] c) 옥소기), 또는

[0318] (g) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

[0319] 이거나, 또는

[0320] (h) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0321] a) 할로겐 원자,

[0322] b) 수산기,

[0323] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),

- [0324] d) 카르복실기,
- [0325] e) $-CO-C_{1-6}H_5$,
- [0326] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 $C_{1-6}H_5$ 이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0327] g) 옥소기,
- [0328] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, $C_{1-6}H_5$, 또는 $-CO-C_{1-6}H_5$ 이거나, 또는 R^{24} 과 R^{25} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [0329] i) $C_{1-6}H_5$ 을 형성할 수 있음(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없음),
- [0330] 3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,
- [0331] (a) $C_{1-6}H_5$ 이거나, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0332] a) 수산기,
- [0333] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 $C_{1-6}H_5$ 이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0334] c) $C_{1-6}H_5$, 및
- [0335] d) 아릴기), 또는
- [0336] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0337] a) $C_{1-6}H_5$,
- [0338] b) $-CO-C_{1-6}H_5$, 및
- [0339] c) 옥소기)임),
- [0340] 4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,
- [0341] (a) $C_{1-6}H_5$ 이거나, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0342] a) 할로겐 원자,
- [0343] b) 수산기,
- [0344] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, $C_{1-6}H_5$, $-CO-C_{1-6}H_5$, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}H_5$ 이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0345] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 $C_{1-6}H_5$ 이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0346] e) $C_{1-6}H_5$,
- [0347] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수

도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C₁₋₆알콕시기, 및 (iv) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0348] g) 카르복실기, 및

[0349] h) 아릴옥시기),

[0350] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0351] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

[0352] b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는

[0353] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0354] a) C₁₋₆알킬기,

[0355] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[0356] c) 옥소기),

[0357] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C₁₋₆알콕시기), 또는

[0358] (e) 카르복실기임),

[0359] 5) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0360] (a) 카르복실기,

[0361] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)), 및

[0362] (c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0363] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

[0364] 6) 시클로알킬기,

[0365] 7) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상

의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0366] 8) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

[0367] 9) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0368] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0369] (a) 카르복실기,

[0370] (b) 할로겐 원자,

[0371] (c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C₁₋₆알콕시기),

[0372] (d) -NR³⁸R³⁹(식 중, R³⁸ 및 R³⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-NR⁴⁰R⁴¹(식 중, R⁴⁰ 및 R⁴¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 C₁₋₆알콕시기이거나, 또는 R⁴⁰과 R⁴¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 -S(=O)₂-R⁴²(식 중, R⁴²는 C₁₋₆알킬기임)이거나, 또는 R³⁸과 R³⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

[0373] (e) -CO-NR⁴³R⁴⁴(식 중, R⁴³ 및 R⁴⁴는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴³과 R⁴⁴는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0374] (f) -COO-C₁₋₆알킬기), 또는

[0375] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0376] (a) 카르복실기,

[0377] (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0378] a) 할로겐 원자,

[0379] b) 수산기, 및

[0380] c) C₁₋₆알콕시기),

[0381] (c) 시클로알킬기,

[0382] (d) 할로겐 원자,

[0383] (e) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵과 R⁴⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

- [0384] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기),
- [0385] (g) 시아노기), 및
- [0386] (h) C_{1-6} 알콕시기)인
- [0387] 화합물 또는 그의 염.
- [0388] [7] 상기 [1], [2] 및 [5] 중 어느 하나에 있어서, R^1 이
- [0389] 1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,
- [0390] (a) 수소 원자,
- [0391] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0392] a) 수산기,
- [0393] b) 할로겐 원자,
- [0394] c) 카르복실기,
- [0395] d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및
- [0396] e) C_{1-6} 알콕시기),
- [0397] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),
- [0398] (d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0399] a) 수산기,
- [0400] b) 할로겐 원자,
- [0401] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0402] d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0403] (i) 할로겐 원자,
- [0404] (ii) 수산기,
- [0405] (iii) 옥소기), 및
- [0406] (iv) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [0407] e) C_{1-6} 알콕시기, 및
- [0408] f) 카르복실기),

- [0409] (e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는
- [0410] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0411] a) C_{1-6} 알킬기,
- [0412] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0413] c) 옥소기),
- [0414] (g) C_{1-6} 알콕시기, 또는
- [0415] (h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)
- [0416] 이거나, 또는
- [0417] (i) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0418] a) 할로겐 원자,
- [0419] b) 수산기,
- [0420] c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),
- [0421] d) 카르복실기,
- [0422] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,
- [0423] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0424] g) 옥소기,
- [0425] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [0426] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R^5 및 R^6 은, 하기 군으로부터 선택되는 치환기의 어떠한 조합도 될 수 없음. (i) 수소 원자 및 (ii) 비치환된 C_{1-6} 알킬기)),
- [0427] 2) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,
- [0428] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0429] a) 수산기,
- [0430] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

- [0431] c) C₁₋₆알콕시기, 및
- [0432] d) 아릴기), 또는
- [0433] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0434] a) C₁₋₆알킬기,
- [0435] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0436] c) 옥소기)임),
- [0437] 3) -COR¹¹(식 중, R¹¹은,
- [0438] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0439] a) 할로겐 원자,
- [0440] b) 수산기,
- [0441] c) -NR²⁸R²⁹(식 중, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-시클로알킬기, 또는 -S(=O)₂-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁸과 R²⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0442] d) -CO-NR³⁰R³¹(식 중, R³⁰ 및 R³¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁰과 R³¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0443] e) C₁₋₆알콕시기,
- [0444] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C₁₋₆알콕시기, 및 (iv) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0445] g) 카르복실기, 및
- [0446] h) 아릴옥시기),
- [0447] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0448] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [0449] b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는
- [0450] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0451] a) C₁₋₆알킬기,
- [0452] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0453] c) 옥소기),
- [0454] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로

치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C₁₋₆알콕시기), 또는

[0455] (e) 카르복실기임),

[0456] 4) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0457] (a) 카르복실기,

[0458] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[0459] (c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0460] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0461] 5) 시클로알킬기,

[0462] 6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0463] 7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

[0464] 8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[0465] 9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기는, 하기 (a) 내지 (g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0466] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0467] a) 할로겐 원자,

[0468] b) 수산기, 및

[0469] c) C₁₋₆알콕시기),

[0470] (b) 시클로알킬기,

[0471] (c) 할로겐 원자,

[0472] (d) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵와

R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0473] (e) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기),

[0474] (f) 시아노기, 및

[0475] (g) C_{1-6} 알콕시기)

[0476] 인 화합물 또는 그의 염.

[0477] [8] 상기 [1], [2] 및 [5] 중 어느 하나에 있어서, R^1 이

[0478] 1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

[0479] (a) 수소 원자,

[0480] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0481] a) 수산기,

[0482] b) 할로겐 원자,

[0483] c) 카르복실기,

[0484] d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

[0485] e) C_{1-6} 알콕시기),

[0486] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),

[0487] (d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0488] a) 수산기,

[0489] b) 할로겐 원자,

[0490] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0491] d) $-NR^{20}R^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[0492] (i) 할로겐 원자,

[0493] (ii) 수산기,

[0494] (iii) 옥소기, 및

[0495] (iv) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),

[0496] e) C₁₋₆알콕시기, 및

[0497] f) 카르복실기),

[0498] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

[0499] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0500] a) C₁₋₆알킬기,

[0501] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[0502] c) 옥소기), 또는

[0503] (g) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

[0504] 이거나, 또는

[0505] (h) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0506] a) 할로겐 원자,

[0507] b) 수산기,

[0508] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),

[0509] d) 카르복실기,

[0510] e) -CO-C₁₋₆알킬기,

[0511] f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²와 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0512] g) 옥소기,

[0513] h) -NR²⁴R²⁵(식 중, R²⁴ 및 R²⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁴와 R²⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0514] i) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R⁵ 및 R⁶은 동시에 수소 원자가 될 수 없음),

[0515] 2) -COOR¹⁰(식 중, R¹⁰은,

[0516] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0517] a) 수산기,

[0518] b) -NR²⁶R²⁷(식 중, R²⁶ 및 R²⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁶과 R²⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

- [0519] c) C₁₋₆알콕시기, 및
- [0520] d) 아릴기), 또는
- [0521] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0522] a) C₁₋₆알킬기,
- [0523] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0524] c) 옥소기)임),
- [0525] 3) -COR¹¹(식 중, R¹¹은,
- [0526] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0527] a) 할로겐 원자,
- [0528] b) 수산기,
- [0529] c) -NR²⁸R²⁹(식 중, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-시클로알킬기, 또는 -S(=O)₂-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁸과 R²⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0530] d) -CO-NR³⁰R³¹(식 중, R³⁰ 및 R³¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁰과 R³¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0531] e) C₁₋₆알콕시기,
- [0532] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C₁₋₆알콕시기, 및 (iv) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0533] g) 카르복실기, 및
- [0534] h) 아릴옥시기),
- [0535] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0536] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [0537] b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는
- [0538] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0539] a) C₁₋₆알킬기,
- [0540] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0541] c) 옥소기),
- [0542] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로

치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C₁₋₆알콕시기), 또는

[0543] (e) 카르복실기임),

[0544] 4) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0545] (a) 카르복실기,

[0546] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[0547] (c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0548] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0549] 5) 시클로알킬기,

[0550] 6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0551] 7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

[0552] 8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[0553] 9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기는, 하기 (a) 내지 (g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0554] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0555] a) 할로겐 원자,

[0556] b) 수산기, 및

[0557] c) C₁₋₆알콕시기),

[0558] (b) 시클로알킬기,

[0559] (c) 할로겐 원자,

[0560] (d) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵와

R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0561] (e) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기,

[0562] (f) 시아노기, 및

[0563] (g) C_{1-6} 알콕시기)

[0564] 인 화합물 또는 그의 염.

[0565] [9] 상기 [1] 내지 [8] 중 어느 하나에 있어서, R^2 가 시클로프로필기 또는 1-메틸시클로프로필기인 화합물 또는 그의 염.

[0566] [10] 상기 [1] 내지 [9] 중 어느 하나에 있어서, R^3 및 R^4 가 각각 동일하거나 상이하고,

[0567] (1) 수소 원자,

[0568] (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음. 1) 할로겐 원자, 및 2) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기),

[0569] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 5)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0570] 1) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음. (a) 할로겐 원자, 및 (b) 수산기),

[0571] 2) C_{1-6} 알콕시기(해당 C_{1-6} 알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음),

[0572] 3) 카르복실기,

[0573] 4) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[0574] 5) 시아노기), 또는

[0575] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음. 1) 할로겐 원자, 및 2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0576] (단, R^3 및 R^4 는 동시에 수소 원자가 될 수 없음)

[0577] 인 화합물 또는 그의 염.

[0578] [11] 상기 [1]에 있어서, R^1 이

[0579] 1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

[0580] (a) 수소 원자,

[0581] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0582] a) 수산기,

[0583] b) 할로겐 원자,

[0584] c) 카르복실기,

[0585] d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

[0586] e) C₁₋₆알콕시기),

[0587] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

[0588] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0589] a) 수산기,

[0590] b) 할로겐 원자,

[0591] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[0592] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0593] (i) 할로겐 원자,

[0594] (ii) 수산기,

[0595] (iii) 옥소기, 및

[0596] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음),

[0597] e) C₁₋₆알콕시기, 및

[0598] f) 카르복실기),

[0599] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

[0600] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0601] a) C₁₋₆알킬기,

[0602] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[0603] c) 옥소기),

[0604] (g) C₁₋₆알콕시기, 또는

[0605] (h) 단환으로 이루어진 질소 함유 불포화 복소환기(해당 복소환기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)

[0606] 이거나, 또는

[0607] (i) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0608] a) 할로겐 원자,

- [0609] b) 수산기,
- [0610] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기),
- [0611] d) 카르복실기,
- [0612] e) -CO-C₁₋₆알킬기,
- [0613] f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²와 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0614] g) 옥소기,
- [0615] h) -NR²⁴R²⁵(식 중, R²⁴ 및 R²⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁴와 R²⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [0616] i) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R⁵ 및 R⁶은 동시에 수소 원자가 될 수 없음)),
- [0617] 2) -COOR¹⁰(식 중, R¹⁰은,
- [0618] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0619] a) 수산기,
- [0620] b) -NR²⁶R²⁷(식 중, R²⁶ 및 R²⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁶과 R²⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0621] c) C₁₋₆알콕시기, 및
- [0622] d) 아릴기), 또는
- [0623] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0624] a) C₁₋₆알킬기,
- [0625] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [0626] c) 옥소기)임),
- [0627] 3) -COR¹¹(식 중, R¹¹은,
- [0628] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0629] a) 할로겐 원자,
- [0630] b) 수산기,
- [0631] c) -NR²⁸R²⁹(식 중, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-시클로알킬기, 또는 -S(=O)₂-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁸과 R²⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

- [0632] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [0633] e) C_{1-6} 알콕시기,
- [0634] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C_{1-6} 알콕시기, 및 (iv) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [0635] g) 카르복실기, 및
- [0636] h) 아릴옥시기),
- [0637] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0638] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [0639] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는
- [0640] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [0641] a) C_{1-6} 알킬기,
- [0642] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [0643] c) 옥소기),
- [0644] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) C_{1-6} 알콕시기), 또는
- [0645] (e) 카르복실기임),
- [0646] 4) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [0647] (a) 카르복실기,
- [0648] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),
- [0649] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [0650] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원

자로 치환될 수도 있음))),

[0651] 5) 시클로알킬기,

[0652] 6) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임),

[0653] 7) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은, C_{1-6} 알킬기임),

[0654] 8) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0655] 9) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0656] (a) 카르복실기,

[0657] (b) 할로겐 원자,

[0658] (c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

[0659] (d) $-NR^{38}R^{39}$ (식 중, R^{38} 및 R^{39} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-NR^{40}R^{41}$ (식 중, R^{40} 및 R^{41} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 C_{1-6} 알콕시기이거나, 또는 R^{40} 과 R^{41} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 $-S(=O)_2R^{42}$ (식 중, R^{42} 는 C_{1-6} 알킬기임)이거나, 또는 R^{38} 과 R^{39} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

[0660] (e) $-CO-NR^{43}R^{44}$ (식 중, R^{43} 및 R^{44} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{43} 과 R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[0661] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

[0662] 10) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (h)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[0663] (a) 카르복실기,

[0664] (b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0665] a) 할로겐 원자,

[0666] b) 수산기, 및

[0667] c) C_{1-6} 알콕시기),

[0668] (c) 시클로알킬기,

[0669] (d) 할로겐 원자,

[0670] (e) $-CO-NR^{45}R^{46}$ (식 중, R^{45} 및 R^{46} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{45} 와 R^{46} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[0671] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기,

[0672] (g) 시아노기, 및

[0673] (h) C_{1-6} 알콕시기)

[0674] 인 화합물 또는 그의 염.

[0675] [12] 상기 [1]에 있어서, 이하로부터 선택되는 화합물 또는 그의 염.

[0676] (1) 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-3-(피리딘-3-일)파롤리딘,

[0677] (2) 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0678] (3)

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(피리딘-3-일)파롤리딘,

[0679] (4)

1-[1-(1-카르바모일피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0680] (5) 1-{1-[1-(2-카르복시페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0681] (6) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시메틸페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0682] (7) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로필카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0683] (8) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0684] (9) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시-1,1-디메틸에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0685] (10) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0686] (11) 1-{1-[1-(2-아미노에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0687] (12) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1,1-디옥소티오모르폴린-4-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0688] (13) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0689] (14) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0690] (15) 1-{1-[1-(아제티딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

- [0691] (16) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0692] (17) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [0693] (18) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4,4-디플루오로페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0694] (19) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3-디플루오로페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0695] (20) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0696] (21) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0697] (22) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0698] (23) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-메틸에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0699] (24) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0700] (25) 1-{1-[1-(4-카르복시페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0701] (26) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0702] (27) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시메틸페롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0703] (28) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시메틸아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0704] (29) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메틸페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [0705] (30) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-이소프로필페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [0706] (31) 1-{1-[1-(4-아세틸페라진-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0707] (32) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시페페리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0708] (33) 1-{1-[1-(4-카르바모일페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0709] (34) 1-{1-[1-(3-카르바모일아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [0710] (35) 1-{1-[1-(4-아미노페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [0711] (36) 1-{1-[1-(3-아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

- [0712] (37) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(파페리딘-4-일-카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [0713] (38) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-디메틸아미노파페리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [0714] (39) 1-{1-[1-(4-아세틸아미노파페리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0715] (40) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0716] (41) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-디메틸아미노파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [0717] (42) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸파페리딘-4-일-카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [0718] (43) 1-{1-[1-(1-아세틸파페리딘-4-일-카르바모일)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0719] (44) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-옥소파페리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0720] (45) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노아제티딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0721] (46) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0722] (47) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0723] (48) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,4,4-테트라플루오로파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0724] (49) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-2-메틸프로필카르바모일]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0725] (50) 1-{1-{1-[(S)-1-벤질-2-히드록시에틸카르바모일]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0726] (51) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-페닐에틸카르바모일]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0727] (52) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-3-메틸부틸카르바모일]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0728] (53) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0729] (54) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로펜틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0730] (55) 1-[1-(1-벤젠술포닐아미노카르보닐파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0731] (56) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메탄술포닐아미노카르보닐파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [0732] (57) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메톡시카르보닐파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메

틸페닐)]페롤리딘,

[0733] (58) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0734] (59) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0735] (60) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0736] (61) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0737] (62) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0738] (63) 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0739] (64) 1-[1-(1-시클로프로판카르보닐페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0740] (65) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시아세틸)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0741] (66) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-(4-플루오로페닐)시클로프로판카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0742] (67) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0743] (68) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0744] (69) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0745] (70) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노-2-메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0746] (71) 1-(1-{1-(S)-2-아세틸아미노프로파오닐}페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0747] (72) 1-(1-{1-(S)-2-아세틸아미노-3-메틸부티릴}페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0748] (73) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,3-트리플루오로프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0749] (74) 1-(5-시클로프로필-1-{1-(S)-5-옥소페롤리딘-2-카르보닐}페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0750] (75) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0751] (76) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시-2,2-디메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

[0752] (77) 1-{1-[1-(2-아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,

[0753] (78) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-

[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0754] (79) 1-{1-[1-(2-아미노-2-메틸프로파이닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0755] (80) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시부티릴)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0756] (81) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0757] (82) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-메틸피롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0758] (83) 1-{1-[1-(3-아미노프로파이닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0759] (84) 1-{1-{1-[(S)-2-아미노-3-메틸부티릴]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0760] (85) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0761] (86) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0762] (87) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-이소부티릴아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0763] (88) 1-{1-[1-(2-시클로프로판카르보닐아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0764] (89) 1-{1-{1-[(S)-1-아세틸페롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0765] (90) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메탄솔포닐아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0766] (91) 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0767] (92) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0768] (93) 1-{1-[1-(3-카르바모일프로파이닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[0769] (94) 1-[1-(1-카르바모일메틸페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0770] (95) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메틸카르바모일메틸페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0771] (96) 1-{1-[1-(1-카르바모일-1-메틸에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0772] (97) 1-{1-[1-(2-카르바모일에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0773] (98) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필메틸페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[0774] (99) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸

페닐)]파롤리딘 염산염,

[0775] (100) 1-[5-시클로프로필-1-(1-디메틸카르바모일메틸파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0776] (101) 1-[1-(1-카르복시메틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0777] (102) 1-[1-(1-카르복시에틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0778] (103) 1-{1-[1-(1-카르바모일에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0779] (104) 1-{1-[1-(2-카르복시-2-메틸프로필)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0780] (105) 1-{1-[1-(2-카르바모일-2-메틸프로필)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0781] (106) 1-{1-[1-(1-카르바모일시클로프로필메틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0782] (107) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)시클로프로필메틸]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0783] (108) 1-[5-시클로프로필-1-(1-트리플루오로메탄술포닐파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0784] (109) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에탄술포닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0785] (110) 1-{1-[1-(1-시아노이미노에틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0786] (111) 1-{1-{1-[시아노이미노(메틸아미노)메틸]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0787] (112) 1-{1-[1-(N-시아노카르바미드일)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0788] (113) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)벤조산,

[0789] (114) 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)벤조산,

[0790] (115) 5-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)티아펜-2-카르복실산,

[0791] (116) 2-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산,

[0792] (117) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0793] (118) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-시클로프로필-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0794] (119) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-히드록시메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0795] (120) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-트리플루오로메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카

르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0796] (121) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘,

[0797] (122) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0798] (123) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0799] (124) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0800] (125) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0801] (126) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0802] (127) (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염,

[0803] (128) (+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염,

[0804] (129) 1-[5-시클로프로필-1-(1-파라진-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

[0805] (130) 1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0806] (131) 1-[5-시클로프로필-1-(trans-4-우레이도시클로헥실)-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0807] (132) 1-{5-시클로프로필-1-[trans-4-(1H-테트라졸-5-일)시클로헥실]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,

[0808] (133) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(4-트리플루오로메틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘,

[0809] (134) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메톡시시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘,

[0810] (135) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-페닐-3-트리플루오로메틸-파롤리딘,

[0811] (136) 3-(2-클로로페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,4-디플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘,

[0812] (137) 3-(2-클로로파리딘-3-일)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘,

[0813] (138) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(2,2,3,3-테트라메틸시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘,

[0814] (139)
1-{5-시클로헥실-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘,

[0815] (140) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메톡시페닐)파롤리딘,

- [0816] (141) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-트리플루오로메틸페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0817] (142) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-카르복시-2-메틸-프로필]메틸카르바모일}페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0818] (143) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-메톡시-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0819] (144) 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-5-(1-히드록시메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0820] (145) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(티아졸-2-일카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0821] (146) 1-{1-[1-(이소프로폭시카르바모일)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0822] (147) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-플루오로벤질카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0823] (148) 1-{1-[1-(2,3-디히드로인돌-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0824] (149) 1-{1-[1-(2,3-디히드로[1,4]옥사진-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0825] (150) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,6-디클로로페리딘-3-일카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0826] (151) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(2,3,4,5-테트라히드로벤조[b]아제핀-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0827] (152) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)벤조산에틸,
- [0828] (153) 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐-페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0829] (154) 1-{1-[1-(3-카르복시)-3-메틸-부티릴)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0830] (155) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페녹시아세틸)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0831] (156) 1-{1-[1-(3-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0832] (157) 1-{1-[1-(2-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0833] (158) 1-[5-시클로프로필-1-(1-옥살릴페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0834] (159) 1-{1-[1-(4-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0835] (160) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[2-(4-플루오로페닐)아세틸]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0836] (161) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-트리플루오로메틸벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,

- [0837] (162) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-메톡시벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0838] (163) 1-{1-[1-(4-플루오로벤질)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘 염산염,
- [0839] (164) 1-[1-(1-벤젠술포닐-페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0840] (165) 1-{1-[1-(4-카르바모일페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0841] (166) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0842] (167) 1-{1-[1-(5-카르바모일-페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0843] (168) 1-{1-[1-(4-아미노페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0844] (169) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(2-옥소옥사졸리딘-3-일)페닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0845] (170) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(3-메톡시우레이도)페닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0846] (171) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메탄술포닐아미노페닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0847] (172) 1-[1-(1-에톡시카르바모일페페리딘-4-일)-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0848] (173) 1-[1-(5-클로로페리딘-2-일)아제티딘-3-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0849] (174) 1-{1-[1-(5-클로로페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-메톡시메틸-3-페닐페롤리딘,
- [0850] (175) 1-{1-[1-(5-시아노페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0851] (176) 3-(2-아세톡시에틸)-3-(4-플루오로페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘 염산염,
- [0852] (177) {(3S*, 4R*)-3-메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-4-페닐페롤리딘 염산염,
- [0853] (178) 6-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)니코틴산메틸,
- [0854] (179) 2-{1-[5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-페리미딘-2-일-페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]페롤리딘-3-일}벤조산메틸,
- [0855] (180) 3-(2-히드록시메틸페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘 염산염,
- [0856] (181) 1-[5-시클로프로필-1-(1-페리딘-2-일-페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-히드록시-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [0857] (182) 1-{1-[1-(4-아세틸아미노페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,
- [0858] (183) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)-

3-플루오로벤조산나트륨,

[0859] (184) 3-(2-시아노페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘,

[0860] (185) 3-히드록시메틸-1-{1-[1-(4-메톡시페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-페닐페롤리딘 염산염,

[0861] (186) 3-(3,5-디플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-{페리미딘-2-일}페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘 염산염,

[0862] (187) 1-{1-[1-(3-클로로-페리딘-2-일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,

[0863] (188) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(티아졸-2-일)페롤리딘,

[0864] (189) (S)-2-[*(trans*-4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)-페롤리딘-1-카르보닐]-페라졸-1-일}-시클로헥산카르보닐)-메틸-아미노]-3-메틸부티르산,

[0865] (190) 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[*trans*-4-(2-플루오로페닐카르바모일)시클로헥실]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘, 및

[0866] (191) *cis*-4-{5-(1-메틸시클로프로필)-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)-페롤리딘-1-카르보닐]-페라졸-1-일}-시클로헥산카르복실산.

[0867] [13] 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 의약 조성물.

[0868] [14] 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 11 β HSD1 저해제.

[0869] [15] 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.

[0870] [16] 상기 [15]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가

[0871] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,

[0872] (2) 대사 증후군,

[0873] (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,

[0874] (4) 과식증,

[0875] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,

[0876] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,

[0877] (7) 녹내장, 또는

[0878] (8) 골다공증

[0879] 인 치료제 또는 예방제.

[0880] [17] 의약상 유효량의 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 투여하는 것을 포함하는 11 β HSD1 저해 방법.

[0881] [18] 의약상 유효량의 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 투여하는 것을 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료 방법 또는 예방 방법.

[0882] [19] 상기 [18]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가

[0883] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,

[0884] (2) 대사 증후군,

[0885] (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,

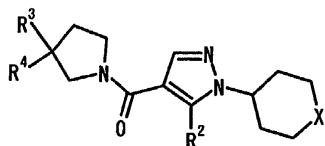
- [0886] (4) 과식증,
- [0887] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [0888] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- [0889] (7) 녹내장, 또는
- [0890] (8) 골다공증
- [0891] 인 치료 방법 또는 예방 방법.
- [0892] [20] 11 β HSD1 저해제를 제조하기 위한 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염의 용도.
- [0893] [21] 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제를 제조하기 위한 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염의 용도.
- [0894] [22] 상기 [21]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가
- [0895] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [0896] (2) 대사 증후군,
- [0897] (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [0898] (4) 과식증,
- [0899] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [0900] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- [0901] (7) 녹내장, 또는
- [0902] (8) 골다공증
- [0903] 인 용도.
- [0904] [23] 상기 [13]에 기재된 의약 조성물을
- [0905] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [0906] (2) 대사 증후군,
- [0907] (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [0908] (4) 과식증,
- [0909] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [0910] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- [0911] (7) 녹내장, 또는
- [0912] (8) 골다공증
- [0913] 으로부터 선택되는 질환의 치료 또는 예방의 용도에 사용할 수 있거나 또는 사용해야만 한다는 것을 기재한 해당 의약 조성물에 대한 기재물을 포함하는 상업 패키지.
- [0914] [24] 상기 [13]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 의약 조성물.
- [0915] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0916] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0917] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0918] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,

- [0919] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0920] [25] 상기 [14]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 11β HSD1 저해제.
- [0921] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0922] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0923] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0924] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0925] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0926] [26] 상기 [15] 또는 [16]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.
- [0927] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0928] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0929] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0930] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0931] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0932] [27] 상기 [17]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 11β HSD1 저해 방법.
- [0933] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0934] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0935] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0936] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0937] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0938] [28] 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 상기 [1] 내지 [12] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 조합하여 이루어지는 의약.
- [0939] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0940] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0941] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0942] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0943] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0944] [29] 상기 [18] 또는 [19]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료 방법 또는 예방 방법.
- [0945] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0946] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0947] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0948] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0949] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0950] [30] 상기 [20]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 11β HSD1 저

해제를 제조하기 위한 용도.

- [0951] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [0952] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [0953] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [0954] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [0955] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0956] [31] 상기 [21] 또는 [22]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제를 제조하기 위한 용도.
 - [0957] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
 - [0958] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
 - [0959] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
 - [0960] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
 - [0961] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [0962] [32] 상기 [13]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 의약 조성물.
- [0963] [33] 상기 [14]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 11 β HSD1 저해제.
- [0964] [34] 상기 [17]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 11 β HSD1 저해 방법.
- [0965] [35] 상기 [21]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 용도.
- [0966] [36] 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 상기 [14]에 기재된 11 β HSD1 저해제를 병용 투여하는 것을 포함하는 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하는 방법.
- [0967] [37] 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸.
- [0968] [38] (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸.
- [0969] [39] (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온.
- [0970] [40] (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘 또는 그의 염.
- [0971] [41] 1-(3,5-비스트리플루오로메틸페닐)-3-((1S,2S)-2-디메틸아미노시클로헥실)-티오우레아의 존재하에, 1-((E)-2-니트로비닐)-2-트리플루오로메틸벤젠과 말론산디메틸을 반응시키는 공정을 갖는 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸의 제조 방법.
- [0972] [42] 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸을 환원 및 폐환하는 공정을 갖는 (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸의 제조 방법.
- [0973] [43] (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-3-카르복실산메틸을 가수분해 및 탈탄산하는 공정을 갖는 (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온의 제조 방법.
- [0974] [44] (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온을 환원하는 공정과, 산으로 처리하여 염을 형성하는 공정을 갖는 (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 염의 제조 방법.
- [0975] 본 발명은 추가로 하기를 포함한다.
- [0976] [45] 하기 화학식 2로 표시되는 화합물 또는 그의 염.

화학식 2



[0977]

[0978] [식 중,

[0979] -X-는,

[0980] (1) -N(R¹)-(식 중, R¹은,

[0981] 1) 수소 원자,

[0982] 2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[0983] (a) 수소 원자,

[0984] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0985] a) 수산기,

[0986] b) 할로겐 원자,

[0987] c) 카르복실기,

[0988] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및[0989] e) C₁₋₆알콕시기),[0990] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기.)로 치환될 수도 있음),[0991] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[0992] a) 수산기,

[0993] b) 할로겐 원자,

[0994] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),[0995] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[0996] (i) 할로겐 원자,

[0997] (ii) 수산기,

[0998] (iii) 옥소기, 및

- [0999] (iv) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [1000] e) C_{1-6} 알콕시기, 및
- [1001] f) 카르복실기),
- [1002] (e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는
- [1003] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1004] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1005] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [1006] c) 옥소기)이거나, 또는
- [1007] (g) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1008] a) 할로겐 원자,
- [1009] b) 수산기,
- [1010] c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기),
- [1011] d) 카르복실기,
- [1012] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,
- [1013] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 와 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [1014] g) 옥소기,
- [1015] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [1016] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),
- [1017] 3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,
- [1018] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1019] a) 수산기,
- [1020] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [1021] c) C_{1-6} 알콕시기), 또는

- [1022] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1023] a) C₁₋₆알킬기,
- [1024] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [1025] c) 옥소기)임),
- [1026] 4) -COR¹¹(식 중, R¹¹은,
- [1027] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1028] a) 할로겐 원자,
- [1029] b) 수산기,
- [1030] c) -NR²⁸R²⁹(식 중, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-시클로알킬기, 또는 -S(=O)₂-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁸과 R²⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [1031] d) -CO-NR³⁰R³¹(식 중, R³⁰ 및 R³¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁰과 R³¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [1032] e) C₁₋₆알콕시기,
- [1033] f) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, (iii) C₁₋₆알콕시기, 및 (iv) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [1034] g) 카르복실기),
- [1035] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1036] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [1037] b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는
- [1038] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1039] a) C₁₋₆알킬기,
- [1040] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [1041] c) 옥소기)임),
- [1042] 5) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (d)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1043] (a) 카르복실기,
- [1044] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중,

R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1045] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1046] (d) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1047] 6) 시클로알킬기,

[1048] 7) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 할로겐 원자, 및 b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))),

[1049] 8) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

[1050] 9) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1051] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (a) 내지 (f)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1052] (a) 카르복실기,

[1053] (b) 할로겐 원자,

[1054] (c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. a) 수산기, b) 할로겐 원자, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

[1055] (d) $-NR^{38}R^{39}$ (식 중, R^{38} 및 R^{39} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-NR^{40}R^{41}$ (식 중, R^{40} 및 R^{41} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 C_{1-6} 알콕시기이거나, 또는 R^{40} 과 R^{41} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는 $-S(=O)_2R^{42}$ (식 중, R^{42} 는 C_{1-6} 알킬기임)이거나, 또는 R^{38} 과 R^{39} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는 1 이상의 옥소기로 치환될 수도 있음)를 형성할 수 있음),

[1056] (e) $-CO-NR^{43}R^{44}$ (식 중, R^{43} 및 R^{44} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{43} 과 R^{44} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1057] (f) $-COO-C_{1-6}$ 알킬기), 또는

[1058] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (g)로부터 선택되는 동일하거나

상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1059] (a) 카르복실기,

[1060] (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기, a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1061] a) 할로겐 원자,

[1062] b) 수산기, 및

[1063] c) C₁₋₆알콕시기),

[1064] (c) 시클로알킬기,

[1065] (d) 할로겐 원자,

[1066] (e) -CO-NR⁴⁵R⁴⁶(식 중, R⁴⁵ 및 R⁴⁶은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R⁴⁵와 R⁴⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1067] (f) -COO-C₁₋₆알킬기, 및

[1068] (g) 시아노기)임), 또는

[1069] (2) -C(R⁷R⁸)-(식 중, R⁷ 및 R⁸은 각각 동일하거나 상이하고,

[1070] 1) 수소 원자,

[1071] 2) -NR¹⁶R¹⁷(식 중, R¹⁶ 및 R¹⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-NR³⁶R³⁷(식 중, R³⁶ 및 R³⁷은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁶과 R³⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R¹⁶과 R¹⁷은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1072] 3) -CONR¹⁸R¹⁹(식 중, R¹⁸ 및 R¹⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, 및 (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)이거나, 또는 R¹⁸과 R¹⁹는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1073] 4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는

[1074] 5) 카르복실기임)이고;

[1075] R²는,

[1076] (1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 수산기, 및 (b) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음)이고;

[1077] R³ 및 R⁴는 각각 동일하거나 상이하고,

[1078] (1) 수소 원자,

[1079] (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 2) 수산기, 및 3) C₁₋₆알콕시기),

- [1080] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 내지 6)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1081] 1) 할로겐 원자,
- [1082] 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (a) 할로겐 원자, (b) 수산기, 및 (c) C₁₋₆알콕시기),
- [1083] 3) C₁₋₆알콕시기(해당 C₁₋₆알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음),
- [1084] 4) 카르복실기,
- [1085] 5) -COO-C₁₋₆알킬기, 및
- [1086] 6) 시아노기), 또는
- [1087] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. 1) 할로겐 원자, 및 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음))임]
- [1088] [46] 상기 [45]에 있어서, 하기 화학식 2로 표시되는 화합물 또는 그의 염.
- [1089] <화학식 2>
- [1090]
- [1091] [식 중,
- [1092] -X-는,
- [1093] (1) -N(R¹)-(식 중, R¹은,
- [1094] 1) 수소 원자,
- [1095] 2) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,
- [1096] (a) 수소 원자,
- [1097] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1098] a) 수산기,
- [1099] b) 할로겐 원자,
- [1100] c) 카르복실기,
- [1101] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및
- [1102] e) C₁₋₆알콕시기),
- [1103] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),
- [1104] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치

환될 수도 있음.

[1105] a) 수산기,

[1106] b) 할로겐 원자,

[1107] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1108] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[1109] (i) 할로겐 원자,

[1110] (ii) 수산기,

[1111] (iii) 옥소기, 및

[1112] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음), 및

[1113] e) C₁₋₆알콕시기),

[1114] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

[1115] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1116] a) C₁₋₆알킬기,

[1117] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[1118] c) 옥소기)이거나, 또는

[1119] (g) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1120] a) 할로겐 원자,

[1121] b) 수산기,

[1122] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),

[1123] d) 카르복실기,

[1124] e) -CO-C₁₋₆알킬기,

[1125] f) -CO-NR²²R²³(식 중, R²² 및 R²³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²²와 R²³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1126] g) 옥소기),

[1127] h) -NR²⁴R²⁵(식 중, R²⁴ 및 R²⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나,

또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1128] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음),

[1129] 3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

[1130] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1131] a) 수산기,

[1132] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1133] c) C_{1-6} 알콕시기), 또는

[1134] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1135] a) C_{1-6} 알킬기,

[1136] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[1137] c) 옥소기)임),

[1138] 4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

[1139] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 e)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1140] a) 할로겐 원자,

[1141] b) 수산기,

[1142] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1143] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1144] e) C_{1-6} 알콕시기),

[1145] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1146] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

[1147] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는

[1148] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나

상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1149] a) C₁₋₆알킬기,

[1150] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[1151] c) 옥소기)임),

[1152] 5) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1153] (a) 카르복실기,

[1154] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)), 및

[1155] (c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[1156] 6) 시클로알킬기,

[1157] 7) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기임(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1158] 8) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),

[1159] 9) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1160] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) 카르복실기), 또는

[1161] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1162] (a) 카르복실기,

[1163] (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1164] a) 할로겐 원자,

[1165] b) 수산기, 및

[1166] c) C₁₋₆알콕시기), 및

[1167] (c) 시클로알킬기)임), 또는

[1168] (2) -C(R⁷R⁸)-(식 중, R⁷ 및 R⁸은 각각 동일하거나 상이하고,

[1169] 1) 수소 원자,

[1170] 2) $-NR^{16}R^{17}$ (식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-NR^{36}R^{37}$ (식 중, R^{36} 및 R^{37} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{36} 과 R^{37} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1171] 3) $-CONR^{18}R^{19}$ (식 중, R^{18} 및 R^{19} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[1172] 4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기임)이고;

[1173] R^2 는,

[1174] (1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기로 치환될 수도 있음)이고;

[1175] R^3 및 R^4 는 각각 동일하거나 상이하고,

[1176] (1) 수소 원자,

[1177] (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),

[1178] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 1) 및 2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1179] 1) 할로겐 원자, 및

[1180] 2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는

[1181] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기임]

[1182] [47] 상기 [45] 또는 [46]에 있어서, $-X-$ 가 $-C(R^7R^8)-($ 식 중, R^7 및 R^8 은 상기 [46]에 기재된 것과 동일한 의미임)인 화합물 또는 그의 염.

[1183] [48] 상기 [45] 내지 [47] 중 어느 하나에 있어서, R^8 이

[1184] 1) $-NR^{16}R^{17}$ (식 중, R^{16} 및 R^{17} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{16} 과 R^{17} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1185] 2) $-CONR^{18}R^{19}$ (식 중, R^{18} 및 R^{19} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{18} 과 R^{19} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[1186] 3) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인

[1187] 화합물 또는 그의 염

[1188] [49] 상기 [45] 또는 [46]에 있어서, $-X-$ 가 $-N(R^1)-($ 식 중, R^1 은 상기 [46]에 기재된 것과 동일한 의미임)인 화합물 또는 그의 염.

[1189] [50] 상기 [45], [46] 또는 [49] 중 어느 하나에 있어서, R^1 이

[1190] 1) 수소 원자,

- [1191] 2) $-\text{CONR}^5\text{R}^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,
- [1192] (a) 수소 원자,
- [1193] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1194] a) 수산기,
- [1195] b) 할로겐 원자,
- [1196] c) 카르복실기,
- [1197] d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및
- [1198] e) C_{1-6} 알콕시기),
- [1199] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)로 치환될 수도 있음),
- [1200] (d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1201] a) 수산기,
- [1202] b) 할로겐 원자,
- [1203] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),
- [1204] d) $-\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ (식 중, R^{20} 및 R^{21} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-\text{CO-C}_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1205] (i) 할로겐 원자,
- [1206] (ii) 수산기,
- [1207] (iii) 옥소기, 및
- [1208] (iv) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음), 및
- [1209] e) C_{1-6} 알콕시기),
- [1210] (e) $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^9$ (식 중, R^9 는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는
- [1211] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1212] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1213] b) $-\text{CO-C}_{1-6}$ 알킬기, 및

[1214] c) 옥소기)이거나, 또는

[1215] (g) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1216] a) 할로겐 원자,

[1217] b) 수산기,

[1218] c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),

[1219] d) 카르복실기,

[1220] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

[1221] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 과 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1222] g) 옥소기,

[1223] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 과 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1224] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없음)),

[1225] 3) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

[1226] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1227] a) 수산기,

[1228] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1229] c) C_{1-6} 알콕시기), 또는

[1230] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1231] a) C_{1-6} 알킬기,

[1232] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[1233] c) 옥소기)임),

[1234] 4) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

[1235] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 e)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1236] a) 할로겐 원자,

[1237] b) 수산기,

[1238] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알

킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1239] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1240] e) C_{1-6} 알콕시기),

[1241] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1242] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및

[1243] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는

[1244] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1245] a) C_{1-6} 알킬기,

[1246] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[1247] c) 옥소기)임),

[1248] 5) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1249] (a) 카르복실기,

[1250] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)), 및

[1251] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[1252] 6) 시클로알킬기,

[1253] 7) $-S(=O)_2-R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기임(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1254] 8) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

[1255] 9) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음

음),

[1256] 10) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 내지 (3)으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 및 (3) 카르복실기), 또는

[1257] 11) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1258] (a) 카르복실기,

[1259] (b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1260] a) 할로겐 원자,

[1261] b) 수산기, 및

[1262] c) C₁₋₆알콕시기), 및

[1263] (c) 시클로알킬기)인

[1264] 화합물 또는 그의 염.

[1265] [51] 상기 [45], [46] 또는 [49] 중 어느 하나에 있어서, R¹이

[1266] 1) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[1267] (a) 수소 원자,

[1268] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1269] a) 수산기,

[1270] b) 할로겐 원자,

[1271] c) 카르복실기,

[1272] d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C₁₋₆알콕시기), 및

[1273] e) C₁₋₆알콕시기),

[1274] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

[1275] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1276] a) 수산기,

[1277] b) 할로겐 원자,

[1278] c)아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1279] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나,

또는 R^{20} 과 R^{21} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[1280] (i) 할로겐 원자,

[1281] (ii) 수산기,

[1282] (iii) 옥소기, 및

[1283] (iv) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음), 및

[1284] e) C_{1-6} 알콕시기),

[1285] (e) $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C_{1-6} 알킬기임), 또는

[1286] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1287] a) C_{1-6} 알킬기,

[1288] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[1289] c) 옥소기)이거나, 또는

[1290] (g) R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1291] a) 할로겐 원자,

[1292] b) 수산기,

[1293] c) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기),

[1294] d) 카르복실기,

[1295] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

[1296] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 와 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1297] g) 옥소기),

[1298] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1299] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자도, 비치환된 C_{1-6} 알킬기도 될 수 없음)),

[1300] 2) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

[1301] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

- [1302] a) 수산기,
- [1303] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [1304] c) C_{1-6} 알콕시기), 또는
- [1305] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1306] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1307] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [1308] c) 옥소기)임),
- [1309] 3) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,
- [1310] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 e)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1311] a) 할로겐 원자,
- [1312] b) 수산기,
- [1313] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),
- [1314] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및
- [1315] e) C_{1-6} 알콕시기),
- [1316] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1317] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [1318] b) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)), 또는
- [1319] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1320] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1321] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [1322] c) 옥소기)임),
- [1323] 4) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1324] (a) 카르복실기,

[1325] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 $-CO-NR^{32}R^{33}$ 으로 치환될 수도 있음(식 중, R^{32} 및 R^{33} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C_{1-6} 알콕시기)이거나, 또는 R^{32} 와 R^{33} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)), 및

[1326] (c) $-CO-NR^{34}R^{35}$ (식 중, R^{34} 및 R^{35} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{34} 와 R^{35} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),

[1327] 5) 시클로알킬기,

[1328] 6) $-S(=O)_2R^{12}$ (식 중, R^{12} 는 C_{1-6} 알킬기임(해당 C_{1-6} 알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음)),

[1329] 7) $-C(=NCN)-R^{13}$ (식 중, R^{13} 은 C_{1-6} 알킬기임),

[1330] 8) $-C(=NCN)NR^{14}R^{15}$ (식 중, R^{14} 및 R^{15} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{14} 와 R^{15} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는

[1331] 9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 및 (b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1332] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1333] a) 할로겐 원자,

[1334] b) 수산기, 및

[1335] c) C_{1-6} 알콕시기), 및

[1336] (b) 시클로알킬기)

[1337] 인 화합물 또는 그의 염.

[1338] [52] 상기 [45], [46] 또는 [48] 중 어느 하나에 있어서, R^1 이

[1339] 1) $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 및 R^6 은 각각 동일하거나 상이하고,

[1340] (a) 수소 원자,

[1341] (b) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1342] a) 수산기,

[1343] b) 할로겐 원자,

[1344] c) 카르복실기,

[1345] d) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 할로겐 원자, (ii) 수산기, 및 (iii) C_{1-6} 알콕시기), 및

[1346] e) C₁₋₆알콕시기),

[1347] (c) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)로 치환될 수도 있음),

[1348] (d) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1349] a) 수산기,

[1350] b) 할로겐 원자,

[1351] c) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)),

[1352] d) -NR²⁰R²¹(식 중, R²⁰ 및 R²¹은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, 또는 -CO-C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R²⁰과 R²¹은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (i) 내지 (iv)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1353] (i) 할로겐 원자,

[1354] (ii) 수산기,

[1355] (iii) 옥소기, 및

[1356] (iv) C₁₋₆알콕시기)를 형성할 수 있음), 및

[1357] e) C₁₋₆알콕시기),

[1358] (e) -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 또는 C₁₋₆알킬기임), 또는

[1359] (f) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1360] a) C₁₋₆알킬기,

[1361] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및

[1362] c) 옥소기)이거나, 또는

[1363] (g) R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 i)로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1364] a) 할로겐 원자,

[1365] b) 수산기,

[1366] c) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),

[1367] d) 카르복실기,

[1368] e) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기,

[1369] f) $-CO-NR^{22}R^{23}$ (식 중, R^{22} 및 R^{23} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{22} 와 R^{23} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1370] g) 옥소기,

[1371] h) $-NR^{24}R^{25}$ (식 중, R^{24} 및 R^{25} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, 또는 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{24} 와 R^{25} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1372] i) C_{1-6} 알콕시기)를 형성할 수 있음(단, R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자도, 비치환된 C_{1-6} 알킬기도 될 수 없음)),

[1373] 2) $-COOR^{10}$ (식 중, R^{10} 은,

[1374] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1375] a) 수산기,

[1376] b) $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1377] c) C_{1-6} 알콕시기), 또는

[1378] (b) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1379] a) C_{1-6} 알킬기,

[1380] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[1381] c) 옥소기)임),

[1382] 3) $-COR^{11}$ (식 중, R^{11} 은,

[1383] (a) C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 e)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1384] a) 할로겐 원자,

[1385] b) 수산기,

[1386] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기이거나, 또는 R^{28} 과 R^{29} 는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음),

[1387] d) $-CO-NR^{30}R^{31}$ (식 중, R^{30} 및 R^{31} 은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{30} 과 R^{31} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 및

[1388] e) C_{1-6} 알콕시기),

[1389] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

- [1390] a) 아릴기(해당 아릴기는, 하기 (1) 및 (2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (1) 할로겐 원자, 및 (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)), 및
- [1391] b) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)), 또는
- [1392] (c) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1393] a) C₁₋₆알킬기,
- [1394] b) -CO-C₁₋₆알킬기, 및
- [1395] c) 옥소기)임),
- [1396] 4) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 (a) 내지 (c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1397] (a) 카르복실기,
- [1398] (b) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이한 1 이상의 -CO-NR³²R³³으로 치환될 수도 있음(식 중, R³² 및 R³³은 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기)이거나, 또는 R³²와 R³³은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)), 및
- [1399] (c) -CO-NR³⁴R³⁵(식 중, R³⁴ 및 R³⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R³⁴와 R³⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음)),
- [1400] 5) 시클로알킬기,
- [1401] 6) -S(=O)₂-R¹²(식 중, R¹²는 C₁₋₆알킬기임(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환되어 있음)),
- [1402] 7) -C(=NCN)-R¹³(식 중, R¹³은 C₁₋₆알킬기임),
- [1403] 8) -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵(식 중, R¹⁴ 및 R¹⁵는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, 또는 C₁₋₆알킬기이거나, 또는 R¹⁴와 R¹⁵는 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기를 형성할 수 있음), 또는
- [1404] 9) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 하기 (a) 및 (b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1405] (a) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1406] a) 할로겐 원자,
- [1407] b) 수산기, 및
- [1408] c) C₁₋₆알콕시기), 및

- [1409] (b) 시클로알킬기)
- [1410] 인 화합물 또는 그의 염.
- [1411] [53] 상기 [45] 내지 [52] 중 어느 하나에 있어서, R²가 시클로프로필기 또는 1-메틸시클로프로필기인 화합물 또는 그의 염.
- [1412] [54] 상기 [45] 내지 [53] 중 어느 하나에 있어서, R³ 및 R⁴가 각각 동일하거나 상이하고,
- [1413] (1) 수소 원자,
- [1414] (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음. (i) 수산기, 및 (ii) C₁₋₆알콕시기),
- [1415] (3) 폐닐기(해당 폐닐기는, 하기 1) 및 2)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1416] 1) 할로겐 원자, 및
- [1417] 2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 또는
- [1418] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기
- [1419] 인 화합물 또는 그의 염.
- [1420] [55] 상기 [45]에 있어서, 이하로부터 선택되는 화합물 또는 그의 염.
- [1421] (1) 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [1422] (2) 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1423] (3)
1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘,
- [1424] (4)
1-[1-(1-카르바모일페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1425] (5) 1-{1-[1-(2-카르복시페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1426] (6) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시메틸페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1427] (7) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1428] (8) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1429] (9) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시-1,1-디메틸에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1430] (10) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1431] (11) 1-{1-[1-(2-아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1432] (12) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1,1-디옥소티오모르폴린-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-

[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1433] (13) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1434] (14) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1435] (15) 1-{1-[1-(아제티딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1436] (16) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시피롤리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1437] (17) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-피페리딘-1-일-에틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1438] (18) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4,4-디플루오로피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1439] (19) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3-디플루오로피롤리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1440] (20) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시아제티딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1441] (21) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시피롤리딘-1-카르보닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1442] (22) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-3-히드록시피롤리딘-1-카르보닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1443] (23) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-메틸에틸카르바모일]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1444] (24) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1445] (25) 1-{1-[1-(4-카르복시피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1446] (26) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소피페라진-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1447] (27) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시메틸피롤리딘-1-카르보닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1448] (28) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시메틸아제티딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1449] (29) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메틸피페라진-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1450] (30) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-이소프로필피페라진-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1451] (31) 1-{1-[1-(4-아세틸피페라진-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1452] (32) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시피페리딘-1-카르보닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1453] (33) 1-{1-[1-(4-카르바모일피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-

3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1454] (34) 1-{1-[1-(3-카르바모일아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1455] (35) 1-{1-[1-(4-아미노페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1456] (36) 1-{1-[1-(3-아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1457] (37) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1458] (38) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-디메틸아미노페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1459] (39) 1-{1-[1-(4-아세틸아미노페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1460] (40) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1461] (41) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-디메틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1462] (42) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염,

[1463] (43) 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1464] (44) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-옥소페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1465] (45) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1466] (46) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1467] (47) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1468] (48) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,4,4-테트라플루오로페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1469] (49) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-2-메틸프로필카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1470] (50) 1-(1-{1-[(S)-1-벤질-2-히드록시에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1471] (51) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-페닐에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1472] (52)
1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-3-메틸부틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

[1473] (53) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘,

- [1474] (54) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로펜틸카르바모일)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1475] (55) 1-[1-(1-벤젠술포닐아미노카르보닐페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1476] (56) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메탄술포닐아미노카르보닐페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1477] (57) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메톡시카르보닐페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1478] (58) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에톡시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1479] (59) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에톡시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1480] (60) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페리딘-1-일-에톡시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1481] (61) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페리딘-4-일-옥시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1482] (62) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페리딘-4-일-옥시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1483] (63) 1-{1-[1-(1-아세틸페리딘-4-일-옥시카르보닐)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1484] (64) 1-[1-(1-시클로프로판카르보닐페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1485] (65) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시아세틸)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1486] (66) 1-{5-시클로프로필-1-{1-[1-(4-플루오로페닐)시클로프로판카르보닐]페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1487] (67) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노아세틸)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1488] (68) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노아세틸)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1489] (69) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로판카르보닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1490] (70) 1-{1-[1-(2-아세틸아미노-2-메틸프로피오닐)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1491] (71) 1-(1-{1-[S]-2-아세틸아미노프로피오닐}페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1492] (72) 1-(1-{1-[S]-2-아세틸아미노-3-메틸부티릴}페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1493] (73) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,3-트리플루오로프로피오닐)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1494] (74) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[S]-5-옥소페롤리딘-2-카르보닐}페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,

- [1495] (75) 1-{1-[1-(3-아세틸아미노프로파오닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1496] (76) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시-2,2-디메틸프로파오닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1497] (77) 1-{1-[1-(2-아미노아세틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1498] (78) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로판카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1499] (79) 1-{1-[1-(2-아미노-2-메틸프로파오닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1500] (80) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시부티릴)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1501] (81) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-파롤리딘-2-카르보닐]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1502] (82) 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-메틸파롤리딘-2-카르보닐]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1503] (83) 1-{1-[1-(3-아미노프로파오닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1504] (84) 1-{1-{1-[(S)-2-아미노-3-메틸부티릴]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1505] (85) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메틸아미노아세틸)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1506] (86) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(파페리딘-4-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1507] (87) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-이소부티릴아미노아세틸)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1508] (88) 1-{1-[1-(2-시클로프로판카르보닐아미노아세틸)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1509] (89) 1-{1-{1-[(S)-1-아세틸파롤리딘-2-카르보닐]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1510] (90) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메탄술포닐아미노아세틸)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1511] (91) 1-{1-[1-(1-아세틸파페리딘-4-카르보닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1512] (92) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸파페리딘-4-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1513] (93) 1-{1-[1-(3-카르바모일프로파오닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘,
- [1514] (94) 1-[1-(1-카르바모일메틸파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,
- [1515] (95) 1-[5-시클로프로필-1-(1-메틸카르바모일메틸파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염,

- [1516] (96) 1-{1-[1-(1-카르바모일-1-메틸에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1517] (97) 1-{1-[1-(2-카르바모일에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1518] (98) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필메틸페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1519] (99) 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1520] (100) 1-[5-시클로프로필-1-(1-디메틸카르바모일메틸페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1521] (101) 1-[1-(1-카르복시메틸페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1522] (102) 1-[1-(1-카르복시에틸페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1523] (103) 1-{1-[1-(1-카르바모일에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1524] (104) 1-{1-[1-(2-카르복시-2-메틸프로필)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1525] (105) 1-{1-[1-(2-카르바모일-2-메틸프로필)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1526] (106) 1-{1-[1-(1-카르바모일시클로프로필메틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1527] (107) 1-[5-시클로프로필-1-{1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)시클로프로필메틸]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1528] (108) 1-[5-시클로프로필-1-(1-트리플루오로메탄술포닐페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1529] (109) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에탄술포닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1530] (110) 1-{1-[1-(1-시아노이미노에틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1531] (111) 1-(1-{1-[시아노이미노(메틸아미노)메틸]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1532] (112) 1-{1-[1-(N-시아노카르바미드일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1533] (113) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)벤조산,
- [1534] (114) 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)벤조산,
- [1535] (115) 5-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)티오펜-2-카르복실산,
- [1536] (116) 2-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산,

- [1537] (117) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1538] (118) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-시클로프로필-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1539] (119) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-히드록시메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1540] (120) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-트리플루오로메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1541] (121) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1542] (122) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1543] (123) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1544] (124) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1545] (125) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1546] (126) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1547] (127) (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-(5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐)페롤리딘 염산염,
- [1548] (128) (+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-(5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐)페롤리딘 염산염,
- [1549] (129) 1-[5-시클로프로필-1-(1-페라진-2-일-페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염,
- [1550] (130) 1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘,
- [1551] (131) 1-[5-시클로프로필-1-(trans-4-우레이도시클로헥실)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘, 및
- [1552] (132) 1-{5-시클로프로필-1-[trans-4-(1H-테트라졸-5-일)시클로헥실]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘.
- [1553] [56] 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 의약 조성물.
- [1554] [57] 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 11β HSD1 저해제.
- [1555] [58] 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.
- [1556] [59] 상기 [58]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가
- [1557] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [1558] (2) 대사 증후군,
- [1559] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [1560] (4) 과식증,

- [1561] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증을 포함하는 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [1562] (6) 면역 부전을 포함하는 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,
- [1563] (7) 녹내장, 또는
- [1564] (8) 골다공증
- [1565] 인 치료제 또는 예방제.
- [1566] [60] 의약상 유효량의 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 투여하는 것을 포함하는 11β HSD1 저해 방법.
- [1567] [61] 의약상 유효량의 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 투여하는 것을 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료 방법 또는 예방 방법.
- [1568] [62] 상기 [61]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가
- [1569] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [1570] (2) 대사 증후군,
- [1571] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [1572] (4) 과식증,
- [1573] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증을 포함하는 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [1574] (6) 면역 부전을 포함하는 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,
- [1575] (7) 녹내장, 또는
- [1576] (8) 골다공증
- [1577] 인 치료 방법 또는 예방 방법.
- [1578] [63] 11β HSD1 저해제를 제조하기 위한 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염의 용도.
- [1579] [64] 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제를 제조하기 위한 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염의 용도.
- [1580] [65] 상기 [64]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가
- [1581] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [1582] (2) 대사 증후군,
- [1583] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [1584] (4) 과식증,
- [1585] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증을 포함하는 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [1586] (6) 면역 부전을 포함하는 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,
- [1587] (7) 녹내장, 또는
- [1588] (8) 골다공증
- [1589] 인 용도.

- [1590] [66] 상기 [56]에 기재된 의약 조성물을
- [1591] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [1592] (2) 대사 증후군,
- [1593] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [1594] (4) 과식증,
- [1595] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증을 포함하는 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [1596] (6) 면역 부전을 포함하는 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,
- [1597] (7) 녹내장, 및
- [1598] (8) 골다공증
- [1599] 으로부터 선택되는 질환의 치료 또는 예방의 용도에 사용할 수 있거나 또는 사용해야만 한다는 것을 기재한 해당 의약 조성물에 대한 기재물을 포함하는 상업 패키지.
- [1600] [67] 상기 [56]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 의약 조성물.
- [1601] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1602] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1603] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1604] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1605] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1606] [68] 상기 [57]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 11β HSD1 저해제.
- [1607] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1608] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1609] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1610] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1611] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1612] [69] 상기 [58] 또는 [59]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.
- [1613] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1614] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1615] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1616] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1617] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1618] [70] 상기 [60]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 11β HSD1 저해 방법.
- [1619] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1620] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,

- [1621] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1622] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1623] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1624] [71] 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 상기 [45] 내지 [55] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 염을 조합하여 이루어지는 의약.
- [1625] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1626] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1627] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1628] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1629] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1630] [72] 상기 [61] 또는 [62]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료 방법 또는 예방 방법.
- [1631] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1632] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1633] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1634] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1635] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1636] [73] 상기 [63]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 11β HSD1 저해제를 제조하기 위한 용도.
- [1637] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1638] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1639] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1640] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1641] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1642] [74] 상기 [64] 또는 [65]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제를 제조하기 위한 용도.
- [1643] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1644] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1645] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1646] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1647] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1648] [75] 상기 [56]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 의약 조성물.
- [1649] [76] 상기 [57]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 11β HSD1 저해제.
- [1650] [77] 상기 [60]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제를 투여하는 것을 추가로 포함하는 11β HSD1 저해 방법.
- [1651] [78] 상기 [64]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값

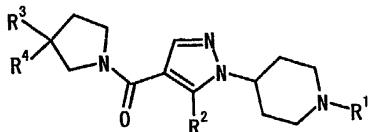
의 상승을 억제하기 위한 용도.

[1652] [79] 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 상기 [57]에 기재된 11 β HSD1 저해제를 병용 투여하는 것을 포함하는 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하는 방법.

[1653] 본 발명은 추가로 하기를 포함한다.

[1654] [80] 하기 화학식 3으로 표시되는 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염.

화학식 3



[1655]

[식 중,

R¹은,

[1658] (1) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[1659] 1) 수소 원자,

[1660] 2) C₁₋₆알킬기,

[1661] 3) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기로 치환될 수도 있음), 또는

[1662] 4) 아릴기(해당 아릴기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)임,

[1663] (2) 아릴기(해당 아릴기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는

[1664] (3) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음)이고;

R²는,

[1666] (1) 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기로 치환될 수도 있음)이고;

[1667] R³ 및 R⁴는 각각 동일하거나 상이하고,

[1668] (1) 수소 원자,

[1669] (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있음),

[1670] (3) 아릴기(해당 아릴기는, 할로겐 원자 및 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음), 또는

[1671] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기임]

[1672] [81] 상기 [80]에 있어서, R¹이

[1673] (1) -CONR⁵R⁶(식 중, R⁵ 및 R⁶은 각각 동일하거나 상이하고,

[1674] 1) 수소 원자,

[1675] 2) C₁₋₆알킬기,

[1676] 3) 시클로프로필기(해당 시클로프로필기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 C₁₋₆알킬기로 치환될 수도

있음), 또는

[1677] 4) 페닐기(해당 페닐기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음),

[1678] (2) 페닐기(해당 페닐기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음), 또는

[1679] (3) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기(해당 복소환기는, 1 이상의 카르복실기로 치환될 수도 있음)인 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염.

[1680] [82] 상기 [80]에 있어서, R²가 시클로프로필기 또는 메틸시클로프로필기인 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염.

[1681] [83] 상기 [80]에 있어서, R³ 및 R⁴가 각각 동일하거나 상이하고,

[1682] (1) 수소 원자,

[1683] (2) C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있음),

[1684] (3) 페닐기(해당 페닐기는, 할로겐 원자 및 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음), 또는

[1685] (4) 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염.

[1686] [84] 상기 [80]에 있어서, 이하로부터 선택되는 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염.

[1687] (1)

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(3-페리딘-3-일)페롤리딘,

[1688] (2) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1689] (3) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1690] (4) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1691] (5) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1692] (6) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1693] (7) 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘,

[1694] (8) (-)1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸페롤리딘 염산염,

[1695] (9) (+)1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸페롤리딘 염산염,

[1696] (10) 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]}페라졸-1-일)페페리딘-1-일)벤조산,

[1697] (11) 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]}페라졸-1-일)페페리딘-1-일)벤조산,

[1698] (12) 5-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]}페라졸-1-일)페페리딘-1-일)티오펜-2-카르복실산, 및

[1699] (13) 2-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]}페라졸-1-일)페페리딘-1-일)티

아졸-4-카르복실산.

- [1700] [85] 상기 [80] 내지 [84] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염과 의약상 허용되는 탑체를 함유하는 의약 조성물.
- [1701] [86] 상기 [80] 내지 [84] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염을 유효 성분으로서 함유하는 11β HSD1 저해제.
- [1702] [87] 상기 [80] 내지 [84] 중 어느 하나에 기재된 화합물 또는 그의 의약상 허용되는 염을 유효 성분으로서 함유하는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.
- [1703] [88] 상기 [87]에 있어서, 글루코코르티코이드가 관여하는 병태가
- [1704] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [1705] (2) 대사 증후군,
- [1706] (3) 이들 질환을 기반으로 하는 심근 경색이나 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [1707] (4) 과식증,
- [1708] (5) 인지 장애, 신경 세포의 소실을 초래하는 신경 변성 질환, 불안, 우울증 또는 조증을 포함하는 감정 장애, 정신 분열병, 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [1709] (6) 면역 부전을 포함하는 면역능 저하를 나타내는 질환의 치료 또는 예방, 또는 면역능 항진을 목적으로 한 질환,
- [1710] (7) 녹내장, 또는
- [1711] (8) 골다공증
- [1712] 인 치료제 또는 예방제.
- [1713] [89] 상기 [85]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 의약 조성물.
- [1714] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1715] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1716] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1717] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1718] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1719] [90] 상기 [86]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 11β HSD1 저해제.
- [1720] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1721] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1722] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1723] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,
- [1724] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1725] [91] 상기 [87] 또는 [88]에 있어서, 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 병용하기 위한 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제.
- [1726] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,
- [1727] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,
- [1728] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,
- [1729] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,

- [1730] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제.
- [1731] [92] 상기 [85]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 의약 조성물.
- [1732] [93] 상기 [86]에 있어서, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제와 병용하여 혈중 글루코코르티코이드값의 상승을 억제하기 위한 11 β HSD1 저해제.
- [1733] <발명을 실시하기 위한 최선의 형태>
- [1734] 이하, 본 발명을 상세히 설명한다.
- [1735] 본 발명에서 사용하는 치환기의 정의는 이하와 같다.
- [1736] "C₁₋₆알킬기"란, 탄소수 1 내지 6의 직쇄상 또는 분지쇄상의 알킬기이고, 예를 들면 메틸기, 에틸기, 프로필기, 이소프로필기, 부틸기, 이소부틸기, sec-부틸기, tert-부틸기, 펜틸기, 이소펜틸기, 네오펜틸기, tert-펜틸기, 1,2-디메틸-프로필기, 헥실기, 1,3-디메틸-부틸기 등을 들 수 있다. 바람직하게는, 탄소수 1 내지 4의 직쇄상 또는 분지쇄상의 알킬기이다.
- [1737] R¹에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기, 에틸기, 이소프로필기, 이소부틸기이다.
- [1738] R³ 또는 R⁴에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기이다.
- [1739] R⁵ 또는 R⁶에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 에틸기, 이소프로필기, tert-부틸기, 1,2-디메틸-프로필기, 1,3-디메틸-부틸기이다.
- [1740] R⁹에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기이다.
- [1741] R¹⁰에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기, 에틸기이다.
- [1742] R¹¹에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기, 에틸기, 프로필기, 이소프로필기, 이소부틸기, tert-부틸기이다.
- [1743] R¹²에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기, 에틸기이다.
- [1744] R¹³에 있어서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기이다.
- [1745] R¹⁴ 또는 R¹⁵에서, 바람직한 "C₁₋₆알킬기"는 메틸기이다.
- [1746] "C₂₋₆알케닐기"란, 탄소수 2 내지 6의 직쇄상 또는 분지쇄상의 알케닐기이고, 예를 들면 비닐기, n-프로페닐기, 이소프로페닐기, n-부테닐기, 이소부테닐기, sec-부테닐기, tert-부테닐기, n-펜테닐기, 이소펜테닐기, 네오펜테닐기, 1-메틸프로페닐기, n-헥세닐기, 이소헥세닐기, 1,1-디메틸부테닐기, 2,2-디메틸부테닐기, 3,3-디메틸부테닐기, 3,3-디메틸프로페닐기, 2-에틸부테닐기 등을 들 수 있다.
- [1747] "C₁₋₆알콕시기"란, 그 알킬 부분이 상기 정의한 "C₁₋₆알킬기"인 알콕시기이고, 예를 들면 메톡시기, 에톡시기, 프로폭시기, 이소프로필옥시기, 부톡시기, 이소부틸옥시기, tert-부틸옥시기, 펜틸옥시기, 헥실옥시기 등을 들 수 있다.
- [1748] "할로겐 원자"란, 불소 원자, 염소 원자, 브롬 원자 또는 요오드 원자이다. 바람직하게는 불소 원자 또는 염소 원자이다. 더욱 바람직하게는 불소 원자이다.
- [1749] "아릴기"란, 탄소수 6 내지 14의 방향족 탄화수소기이고, 예를 들면 폐닐기, 나프틸기, 안트릴기, 아즈레닐기, 폐난트릴기 등을 들 수 있다. 바람직하게는 폐닐기이다.
- [1750] "아릴옥시기"란, 그 아릴 부분이 상기 정의한 "아릴기"인 아릴옥시기이고, 예를 들면 폐녹시기, 나프틸옥시기 등을 들 수 있다.

- [1751] "시클로알킬기"란, 탄소수 3 내지 8의 시클로알킬기이고, 예를 들면 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기, 시클로헵틸기, 시클로옥틸기 등을 들 수 있다. 바람직하게는 탄소수 3 내지 6의 시클로알킬기이고, 구체적으로는 시클로프로필기, 시클로부틸기, 시클로펜틸기, 시클로헥실기이다. 특히 바람직하게는 시클로프로필기, 시클로펜틸기이다.
- [1752] "불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기"란, 탄소 원자 이외에 질소 원자, 산소 원자 및 황 원자로부터 선택되는 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 4개의 헤테로 원자를 갖는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기를 의미한다. 불포화란, 부분적 불포화 및 완전 불포화를 포함한다. 예를 들면 푸릴기, 티에닐기, 피롤릴기, 피라졸릴기, 이미다졸릴기, 옥사졸릴기, 이속사졸릴기, 티아졸릴기, 이소티아졸릴기, 트리아졸릴기, 옥사디아졸릴기, 테트라졸릴기, 티아디아졸릴기 등의 단환인 5원의 방향족 복소환기, 피리딜기, 피리다지닐기, 피리미디닐기, 피라지닐기, 트리아지닐기, 티아지닐기, 옥사디아지닐기, 피라닐기, 티오피라닐기 등의 단환인 6원의 방향족 복소환기를 들 수 있다. 단환인 5원의 방향족 복소환기로서 바람직하게는 티에닐기, 티아졸릴기이다. 단환인 6원의 방향족 복소환기로서 바람직하게는 피리딜기, 피리미디닐기이다.
- [1753] R¹에서, 바람직한 "불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기"는 피리딜기, 티에닐기, 티아졸릴기, 트리아졸릴기(특히 바람직하게는 1,2,4-트리아졸릴기임), 테트라졸릴기, 피리미디닐기, 피라지닐기이다.
- [1754] R³ 또는 R⁴에서, 바람직한 "불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기"는 피리딜기 또는 티아졸릴기이다. 더욱 바람직하게는 피리딜기이다.
- [1755] "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"란, 예를 들면 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 이미다졸리디닐기, 피라졸리디닐기, 옥사졸리디닐기, 2-옥소피롤리디닐기, 티아졸리디닐기, 이소티아졸리디닐기, 피페리딜기, 피페라지닐기, 모르폴리닐기, 티오모르폴리닐기, 2-옥소피페리디닐기, 4-옥소피페리디닐기, 2,6-디옥소피페리디닐기 등의 1개 이상의 질소 원자를 갖는 포화된 4원 내지 6원의 단환으로 이루어진 복소환을 의미한다. 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는, 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 피페리딜기, 피페라지닐기, 티오모르폴리닐기이다.
- [1756] -NR⁵R⁶에서, 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 피페리딜기, 피페라지닐기, 티오모르폴리닐기이다(해당 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).
- [1757] 할로겐 원자,
- [1758] 수산기,
- [1759] 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기,
- [1760] 카르복실기,
- [1761] 아세틸기,
- [1762] 카르바모일기,
- [1763] C₁₋₆알킬기 및 아세틸기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 아미노기, 및 옥소기).
- [1764] -NR²⁰R²¹에서, 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 피페리딜기이다(해당 복소환기는, 할로겐 원자 및 수산기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).
- [1766] -NR²⁶R²⁷에서, 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는 피페리딜기 또는 피롤리디닐기이다. 더욱 바람직하게는 피페리딜기이다.
- [1767] R¹⁰에서, 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는 피페리딜기이다.
- [1768] R¹¹에서, 바람직한 "단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기"는 피롤리디닐기, 피페리딜기이다(해당 복소환

기는 C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기 및 옥소기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[1769] "1 이상의 치환기로 치환될 수도 있다"란, 비치환이거나, 또는 최저 1개부터 허용될 수 있는 최대수까지의 치환기로 치환될 수도 있다는 것을 의미한다. 예를 들면, 메틸기의 경우, 1 내지 3개의 치환기로 치환될 수도 있다는 것을 의미하고, 에틸기의 경우 1 내지 5개의 치환기로 치환될 수도 있다는 것을 의미한다. 2개 이상의 치환기로 치환되어 있는 경우의 치환기는 각각 동일하거나 상이할 수도 있고, 치환기의 위치는 임의이며, 특별히 제한되지 않는다.

[1770] "동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기"로서 바람직하게는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 내지 3개의 치환기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기이다. 특히, "동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기"로서 바람직하게는, 1 내지 3개의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기이고, 더욱 바람직하게는 3개의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기이고, 더욱 바람직하게는, 트리플루오로메틸기, 2,2,2-트리플루오로에틸기이다.

[1771] 이어서, 각 기에 대한 바람직한 기는 이하와 같다.

[1772] [바람직한 환 A]

[1773] 환 A는,

[1774] (1) 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(즉, -X-가 -N(R¹)-임), 또는

[1775] (2) 시클로알킬기(즉, -X-가 -C(R⁷R⁸)-임)이고, 바람직하게는

[1776] (1) 아제티디닐기 또는 피페리딜기, 또는

[1777] (2) 시클로헥실기이다.

[1778] [바람직한 R²]

[1779] R²는, 바람직하게는 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는 수산기로 치환될 수도 있음) 및 C₁₋₆알콕시기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 시클로프로필기, 시클로헥실기이다. 더욱 바람직하게는 1 이상의 메틸기(해당 메틸기는 수산기로 치환될 수도 있음) 또는 메톡시기로 치환될 수도 있는 시클로프로필기, 시클로헥실기이다. 특히 바람직하게는 시클로프로필기, 메틸시클로프로필기, 메톡시시클로프로필기, 테트라메틸시클로프로필기, 히드록시메틸시클로프로필기 및 시클로헥실기이다.

[1780] [바람직한 R³ 및 R⁴]

[1781] R³ 및 R⁴는, 바람직하게는 동시에 수소 원자가 될 수 없다.

[1782] R³ 및 R⁴는, 보다 바람직하게는 1개가 수소 원자, 수산기, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는 할로겐 원자, 수산기, 메톡시기 및 아세틸옥시기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음) 또는 C₁₋₆알콕시기이고, 다른 1개는 할로겐 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자 또는 수산기로 치환될 수도 있음), C₁₋₆알콕시기(해당 C₁₋₆알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), C₁₋₆알콕시카르보닐기 및 시아노기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 하기 군으로부터 선택되는 치환기이다.

[1783] R³ 및 R⁴는, 더욱 바람직하게는 1개가 수소 원자, 수산기, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는 할로겐 원자, 수산기, 메톡시기 및 아세틸옥시기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음) 또는 C₁₋₆알콕시기이고, 다른 1개는 할로겐 원자, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자 또는 수산기로 치환될 수도 있음), C₁₋₆알콕시기(해당 C₁₋₆알콕시기는, 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), C₁₋₆알콕시카르보닐기 및 시아노기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 하기 군으로부터 선택되는 치환기이다.

[1784] · 폐닐기,

[1785] · 피리딜기 및

[1786] · 티아졸릴기.

[1787] R^3 및 R^4 는, 특히 바람직하게는 1개가 수소 원자, 수산기, C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 할로겐 원자, 수산기, 메톡시기 및 아세틸옥시기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음) 또는 메톡시기이고, 다른 1개는 할로겐 원자, 트리플루오로메틸기, 트리플루오로메톡시기, 메톡시카르보닐기, 히드록시메틸기 및 시아노기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 하기 군으로부터 선택되는 치환기이다.

[1788] · 폐닐기,

[1789] · 피리딜기 및

[1790] · 티아졸릴기.

[1791] [바람직한 R^5 및 R^6]

[1792] R^5 및 R^6 은, 바람직하게는 각각 동일하거나 상이하고,

[1793] · 수소 원자,

[1794] · 수산기, 할로겐 원자, 카르복실기 및 C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 1 이상의 수산기 또는 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 폐닐기,

[1795] · 탄소수 3 내지 6의 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기로 치환될 수도 있음),

[1796] · 수산기, 할로겐 원자, 폐닐기(해당 폐닐기는, 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 카르복실기 및 $-NR^{20}R^{21}$ (식 중 R^{20} 및 R^{21} 은, 화학식 1 중의 정의와 동일한 의미임)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기,

[1797] · $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 은 폐닐기, 또는 C_{1-6} 알킬기임),

[1798] · 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알콕시기,

[1799] · 할로겐 원자로 2 위치 및 6 위치에 치환될 수도 있는 피리디닐기,

[1800] · 치환될 수도 있는 질소 함유 불포화 복소환기, 또는

[1801] · C_{1-6} 알킬기, 및 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기이거나, 또는

[1802] · R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 아제티디닐기, 피롤리디닐기, 피페리딜기, 피페라지닐기 및 티오모르폴리닐기로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 디히드로인돌릴기, 디히드로[1,4]옥사지닐기 및 테트라히드로벤조[b]아제피닐기로부터 선택되는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).

[1803] 할로겐 원자,

[1804] 수산기,

[1805] 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기,

[1806] 카르복실기,

[1807] 아세틸기,

- [1808] 카르바모일기,
- [1809] C₁₋₆알킬기 및 아세틸기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 아미노기, 및
- [1810] 옥소기)를 형성할 수도 있다.
- [1811] R⁵ 및 R⁶은, 보다, 바람직하게는 각각 동일하거나 상이하고,
- [1812]
 - 수소 원자,
- [1813]
 - 수산기, 할로겐 원자, 카르복실기 및 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 수산기 또는 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)로부터 선택되는 치환기로 오르토 위치 및/또는 파라 위치에 치환될 수도 있는 페닐기,
- [1814]
 - 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기로 치환될 수도 있는 시클로프로필기 또는 시클로펜틸기,
- [1815]
 - 수산기, 할로겐 원자, 페닐기(해당 페닐기는, 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 카르복실기 및 -NR²⁰R²¹(식 중 R²⁰ 및 R²¹은, 화학식 1 중의 정의와 동일한 의미임)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환된 C₁₋₆알킬기,
- [1816]
 - -S(=O)₂-R⁹(식 중, R⁹는 페닐기, 또는 메틸기임),
- [1817]
 - C₁₋₆알콕시기,
- [1818]
 - 할로겐 원자로 2 위치 및 6 위치에 치환된 피리디닐기,
- [1819]
 - 치환될 수도 있는 티아졸릴기, 또는
- [1820]
 - C₁₋₆알킬기, 및 -CO-C₁₋₆알킬기로부터 선택되는 1개의 치환기로 1 위치에 치환될 수도 있는 피페리딘-4-일기이나, 또는
- [1821]
 - R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 아제티딘-1-일기, 피롤리딘-1-일기, 피페리딘-1-일기, 피페라진-1-일기, 및 티오모르폴린-4-일기로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 디히드로인돌-1-일기, 디히드로[1,4]옥사진-1-일기, 및 테트라히드로벤조[b]아제핀-1-일기로부터 선택되는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1822] 할로겐 원자,
- [1823] 수산기,
- [1824] 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기,
- [1825] 카르복실기,
- [1826] 아세틸기,
- [1827] 카르바모일기,
- [1828] C₁₋₆알킬기 및 아세틸기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 아미노기, 및
- [1829] 옥소기)를 형성할 수도 있다.
- [1830] R⁵ 및 R⁶은, 더욱 바람직하게는 각각 동일하거나 상이하고,
- [1831]
 - 수소 원자,
- [1832]
 - 수산기, 할로겐 원자, 카르복실기 및 C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 1 이상의 수산기 또는 할로겐 원자로 치환될 수도 있음)로부터 선택되는 치환기로 오르토 위치 및/또는 파라 위치에 치환된 페닐기,
- [1833]
 - 1 이상의 수산기로 치환된 C₁₋₆알킬기로 치환된 시클로프로필기 또는 시클로펜틸기,

- [1834] · 수산기, 할로겐 원자, 페닐기(해당 페닐기는, 할로겐 원자로 치환될 수도 있음), 카르복실기 및 $-NR^5R^6$ (식 중 R^5 및 R^6 은, 화학식 1 중의 정의와 동일한 의미임)로부터 선택되는 1개의 치환기로 치환된 C_{1-6} 알킬기,
- [1835] · $-S(=O)_2R^9$ (식 중, R^9 는 페닐기 또는 메틸기임),
- [1836] · C_{1-3} 알콕시기,
- [1837] · 할로겐 원자로 2 위치 및 6 위치에 치환된 피리딘-3-일기,
- [1838] · 티아졸릴기, 또는
- [1839] · $-CO-C_{1-6}$ 알킬기로 1 위치에 치환될 수도 있는 피페리딘-4-일기이거나, 또는
- [1840] · R^5 와 R^6 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 아제티딘-1-일기, 피롤리딘-1-일기, 피페라진-1-일기 및 티오모르폴린-4-일기로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 디히드로인돌-1-일기, 디히드로[1,4]옥사진-1-일기, 및 테트라하이드로벤조[b]아제핀-1-일기로부터 선택되는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기(해당 양 복소환기는, 하기 군으로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음).
- [1841] 할로겐 원자,
- [1842] 수산기,
- [1843] 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기,
- [1844] 카르복실기,
- [1845] 아세틸기,
- [1846] 카르바모일기,
- [1847] C_{1-6} 알킬기 및 아세틸기로부터 선택되는 동일하거나 상이한 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있는 아미노기, 및 옥소기)를 형성할 수도 있다.
- [1849] R^5 및 R^6 은, 특히 바람직하게는 각각 동일하거나 상이하고,
- [1850] · 수소 원자,
- [1851] · 2-플루오로페닐기,
- [1852] · 2-카르복시페닐기,
- [1853] · 2-히드록시메틸페닐기,
- [1854] · 1-히드록시메틸시클로프로필기,
- [1855] · 2-히드록시에틸기,
- [1856] · 2-히드록시-1,1-디메틸에틸기,
- [1857] · 2-아세틸아미노에틸기,
- [1858] · 2-아미노에틸기,
- [1859] · 2-디메틸아미노에틸기,
- [1860] · 2-피페리딘-1-일-에틸기,
- [1861] · 2-히드록시-1-메틸에틸기,
- [1862] · 피페리딘-4-일기,
- [1863] · 1-메틸-피페리딘-4-일기,

- [1864] · 1-아세틸-피페리딘-4-일기,
- [1865] · 2,2,2-트리플루오로에틸기,
- [1866] · 1-히드록시메틸-2-메틸프로필기,
- [1867] · 1-히드록시메틸-2-페닐에틸기,
- [1868] · 2-히드록시-1-페닐에틸기,
- [1869] · 1-히드록시메틸-3-메틸부틸기,
- [1870] · 2-히드록시페닐기,
- [1871] · 1-히드록시메틸-시클로펜틸기,
- [1872] · 벤젠술포닐기,
- [1873] · 4-트리플루오로메틸페닐기,
- [1874] · 2,4-디플루오로페닐기,
- [1875] · 1-카르복시-2-메틸프로필기,
- [1876] · 티아졸-2-일기,
- [1877] · Ⓡ소프로폭시기,
- [1878] · 4-플루오로벤질기,
- [1879] · 2,6-디클로로피리딘-3-일기,
- [1880] · 에톡시기, 또는
- [1881] 메실기이거나, 또는
- [1882] · R⁵와 R⁶은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 하기 군으로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기, 또는 해당 복소환과 탄소환의 축합환인 복소환기를 형성할 수도 있다.
- [1883] 아제티딘-1-일기,
- [1884] 3-히드록시아제티딘-1-일기,
- [1885] 3-히드록시메틸아제티딘-1-일기,
- [1886] 3-아세틸아제티딘-1-일기,
- [1887] 3-아세틸아미노아제티딘-1-일기,
- [1888] 3-히드록시피롤리딘-1-일기,
- [1889] 3,3-디플루오로피롤리딘-1-일기,
- [1890] 3,3,4,4-테트라플루오로피롤리딘-1-일기,
- [1891] 2-히드록시메틸피롤리딘-1-일기,
- [1892] 2-아미노피롤리딘-1-일기,
- [1893] 2-아세틸아미노피롤리딘-1-일기,
- [1894] 2-디메틸아미노피롤리딘-1-일기,
- [1895] 3-옥소-피롤리딘-1-일기,
- [1896] 4-히드록시피페리딘-1-일기,
- [1897] 4,4-디플루오로피페리딘-1-일기,
- [1898] 4-히드록시메틸피페리딘-1-일기,

- [1899] 4-카르복시피페리딘-1-일기,
- [1900] 3-히드록시피페리딘-1-일기,
- [1901] 4-카르바모일피페리딘-1-일기,
- [1902] 4-아미노피페리딘-1-일기,
- [1903] 4-디메틸아미노피페리딘-1-일기,
- [1904] 4-아세틸아미노피페리딘-1-일기,
- [1905] 4-메틸피페라진-1-일기,
- [1906] 4-օ]소프로필피페라진-1-일기,
- [1907] 4-아세틸피페라진-1-일기,
- [1908] 1,1-디옥소티오모르폴린-4-일기,
- [1909] 3-옥소-피페리딘-1-일기,
- [1910] 4-옥소-피페리딘-1-일기,
- [1911] 2,3-디히드로인돌-1-일기,
- [1912] 2,3-디히드로[1,4]옥사진-1-일기, 또는
- [1913] 2,3,4,5-테트라히드로벤조[b]아제핀-1-일기.
- [1914] 또한, 바람직하게는 R^5 및 R^6 은 동시에 수소 원자가 될 수 없다. 보다 바람직하게는, R^5 및 R^6 은 1개가 수소 원자이고, 다른 1개는 수소 원자가 아니다.
- [1915] [바람직한 R^{10}]
- [1916] R^{10} 은, 바람직하게는
- [1917] · C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 수산기, 폐닐기 및 $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 피페리딜기를 형성할 수 있음)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음), 또는 · 피페리딜기(해당 피페리딜기는, C_{1-6} 알킬기 및 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음)
- [1918] 이다.
- [1920] R^{10} 은, 보다 바람직하게는
- [1921] · C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 수산기, 폐닐기 및 $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 피페리딜기를 형성할 수 있음)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음), 또는 · 피페리딘-4-일기(해당 피페리딘-4-일기는, C_{1-6} 알킬기 및 $-CO-C_{1-6}$ 알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음)이다.
- [1923] R^{10} 은, 더욱 바람직하게는
- [1924] · C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는 수산기, 폐닐기 및 $-NR^{26}R^{27}$ (식 중, R^{26} 및 R^{27} 은 각각 동일하거나 상이하고, C_{1-6} 알킬기이거나, 또는 R^{26} 과 R^{27} 은 이들이 결합하는 질소 원자와 하나가 되어 피페리딜기를 형성할 수 있음)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음)

택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음), 또는

[1925] · 피페리딘-4-일기(해당 피페리딘-4-일기는, C₁₋₆알킬기 및 -CO-C₁₋₆알킬기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음)이다.

[1926] R¹⁰은, 특히 바람직하게는

[1927] · 메틸기,

[1928] · 2-히드록시에틸기,

[1929] · 2-디메틸아미노에틸기,

[1930] · 2-피페리딘-1-일-에틸기,

[1931] · 피페리딘-4-일기,

[1932] · 1-메틸-피페리딘-4-일기,

[1933] · 벤질기, 또는

[1934] · 1-아세틸-피페리딘-4-일기

[1935] 이다.

[1936] [바람직한 R¹¹]

[1937] R¹¹은, 바람직하게는

[1938] · C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 하기 a) 내지 g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1939] a) 할로겐 원자,

[1940] b) 수산기,

[1941] c) -NR²⁸R²⁹(식 중, R²⁸ 및 R²⁹는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C₁₋₆알킬기, -CO-C₁₋₆알킬기, -CO-시클로알킬기, 또는 -S(=O)₂-C₁₋₆알킬기임),

[1942] d) 카르바모일기,

[1943] e) 카르복실기,

[1944] f) 폐녹시기, 및

[1945] g) 플루오로페닐기),

[1946] · 시클로알킬기(해당 시클로알킬기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1947] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 아릴기, 및

[1948] b) 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기),

[1949] · 아릴기(해당 아릴기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1950] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자,

[1951] b) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C₁₋₆알킬기, 및

[1952] c) C₁₋₆알콕시기),

[1953] · 카르복실기, 또는

- [1954] · 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1955] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1956] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [1957] c) 옥소기)
- [1958] 이다.
- [1959] R^{11} 은, 보다 바람직하게는
- [1960] · C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.
- [1961] a) 할로겐 원자,
- [1962] b) 수산기,
- [1963] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기임),
- [1964] d) 카르바모일기,
- [1965] e) 카르복실기,
- [1966] f) 폐녹시기, 및
- [1967] g) 플루오로페닐기),
- [1968] · 시클로프로필기(해당 시클로프로필기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1969] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 아릴기, 및
- [1970] b) 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기),
- [1971] · 폐닐기(해당 폐닐기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1972] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자,
- [1973] b) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기, 및
- [1974] c) C_{1-6} 알콕시기),
- [1975] · 카르복실기, 또는
- [1976] · 피롤리디닐기 및 피페리딜기로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.
- [1977] a) C_{1-6} 알킬기,
- [1978] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및
- [1979] c) 옥소기)
- [1980] 이다.
- [1981] R^{11} 은, 더욱 바람직하게는
- [1982] · C_{1-6} 알킬기(해당 C_{1-6} 알킬기는, 하기 a) 내지 g)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로

치환되어 있음.

[1983] a) 할로겐 원자,

[1984] b) 수산기,

[1985] c) $-NR^{28}R^{29}$ (식 중, R^{28} 및 R^{29} 는 각각 동일하거나 상이하고, 수소 원자, C_{1-6} 알킬기, $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, $-CO-$ 시클로알킬기, 또는 $-S(=O)_2-C_{1-6}$ 알킬기임),

[1986] d) 카르바모일기,

[1987] e) 카르복실기,

[1988] f) 페녹시기, 및

[1989] g) 플루오로페닐기),

[1990] · 시클로프로필기(해당 시클로프로필기는, 하기 a) 및 b)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1991] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 아릴기, 및

[1992] b) 1 이상의 수산기로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기),

[1993] · 폐닐기(해당 폐닐기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환되어 있음.

[1994] a) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자,

[1995] b) 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 할로겐 원자로 치환될 수도 있는 C_{1-6} 알킬기, 및 c) C_{1-6} 알콕시기),

[1996] · 카르복실기, 또는

[1997] · 피롤리딘-2-일기 및 피페리딘-4-일기로부터 선택되는 단환으로 이루어진 질소 함유 포화 복소환기(해당 복소환기는, 하기 a) 내지 c)로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음.

[1998] a) C_{1-6} 알킬기,

[1999] b) $-CO-C_{1-6}$ 알킬기, 및

[2000] c) 옥소기)

[2001] 이다.

[2002] R^{11} 은, 특히 바람직하게는

[2003] · 2,2,2-트리플루오로에틸기,

[2004] · 히드록시메틸기,

[2005] · 3-히드록시-프로필기,

[2006] · 2-히드록시-1,1-디메틸-에틸기,

[2007] · 아미노메틸기,

[2008] · 2-아미노-에틸기,

[2009] · 1-아미노-1-메틸-에틸기,

[2010] · 1-아미노-2-메틸-프로필기,

[2011] · 메틸아미노-메틸기,

[2012] · 디메틸아미노-메틸기,

- [2013] · 아세틸아미노-메틸기,
 - [2014] · 1-아세틸아미노-에틸기,
 - [2015] · 2-아세틸아미노-에틸기,
 - [2016] · 1-아세틸아미노-1-메틸-에틸기,
 - [2017] · 1-아세틸아미노-2-메틸-프로필기,
 - [2018] · 이소부티릴아미노-메틸기,
 - [2019] · 시클로프로판카르보닐-아미노-메틸기,
 - [2020] · 메탄술포닐아미노-메틸기,
 - [2021] · 2-카르바모일-에틸기,
 - [2022] · 시클로프로필기,
 - [2023] · 1-(4-플루오로-페닐)-시클로프로필기,
 - [2024] · 1-메틸-시클로프로필기,
 - [2025] · 1-히드록시메틸-시클로프로필기,
 - [2026] · 피롤리딘-1-일기,
 - [2027] · 피롤리딘-2-일기,
 - [2028] · 피페리딘-4-일기,
 - [2029] · 1-메틸-피롤리딘-2-일기,
 - [2030] · 1-메틸-피페리딘-4-일기,
 - [2031] · 1-아세틸-피롤리딘-2-일기,
 - [2032] · 1-아세틸-피페리딘-4-일기,
 - [2033] · 2-카르복시-2-메틸프로필기,
 - [2034] · 페녹시메틸기,
 - [2035] · 2-클로로페닐기,
 - [2036] · 3-클로로페닐기,
 - [2037] · 4-클로로페닐기,
 - [2038] · 카르복실기,
 - [2039] · 4-플루오로벤질기,
 - [2040] · 3-트리플루오로메틸페닐기,
 - [2041] · 3-메톡시페닐기, 또는
 - [2042] · 5-옥소-피롤리딘-2-일기이다.
- [2043] 본 발명 화합물의 염으로서는, 의약상 허용되는 염이 바람직하다. 화학식 1'로 표시되는 본 발명 화합물의 염은, 통상법에 따라 제조할 수 있다. 화학식 1'로 표시되는 본 발명 화합물의 염은, 화합물 [1'](이하, 이들과 그의 염을 통합하여 본 발명 화합물이라고도 함)과, 예를 들면 염산, 황산, 인산, 브롬화수소산 등의 무기산; 옥살산, 말론산, 시트르산, 푸마르산, 락트산, 말산, 숙신산, 타르타르산, 아세트산, 트리플루오로아세트산, 글루콘산, 아스코르브산, 메틸술폰산, 벤질술폰산 등의 유기산; 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화칼슘, 수산화마그네슘, 수산화암모늄 등의 무기 염기; 메틸아민, 디에틸아민, 트리에틸아민, 트리에탄올아민, 에틸렌디아민, 트리스(히드록시메틸)메틸아민, 구아니딘, 콜린, 신코닌 등의 유기 염기; 리신, 아르기닌, 알라닌 등의 아미노산 등을 반응시킴으로써 얻을 수 있다. 또한, 본 발명에서는, 본 발명 화합물의 함수물, 수화물 및 용매화물도

포함된다.

[2044] 또한, 본 발명 화합물에서는 다양한 이성질체가 존재한다. 예를 들면, 기하 이성질체로서 E체 및 Z체가 존재하고, 비대칭 탄소 원자가 존재하는 경우에는, 이들에 기초하는 입체 이성질체로서의 거울상이성질체 및 부분입체 이성질체가 존재하고, 호변 이성질체도 존재할 수 있다. 따라서, 본 발명에는, 이들 모든 이성질체 및 이들의 혼합물이 포함된다. 또한, 본 발명은, 본 발명 화합물 이외에 균등 화합물로서 이들 화합물의 프로드러그 화합물 및 대사 화합물도 포함한다.

[2045] 여기서, "프로드러그"란, 화학적 또는 대사적으로 분해할 수 있는 기를 갖고, 가수분해나 가용매 분해에 의해, 또는 생리적 조건하에서 분해함으로써, 의약적으로 활성을 나타내는 유도체이다. 프로드러그는, 예를 들면 경구 투여에서의 흡수 개선을 위해, 또는 표적 부위로의 표적화를 위해 이용된다. 화학적 또는 대사적으로 분해할 수 있는기가 어떠한 것인지, 해당 기를 화합물에 어떻게 도입하는지는 의약 분야에서 충분히 확립되어 있기 때문에, 본 발명에서도 그와 같은 공지된 기술이 이용될 수 있다. 프로드러그화를 위한 수식 부위로서는, 예를 들면 본 발명 화합물 중의 수산기, 카르복실기, 아미노기, 티올기 등의 반응성이 높은 관능기를 들 수 있다.

[2046] 예를 들면, 수산기에 대해서는 -CO-C₁₋₆알킬기, -CO₂-C₁₋₆알킬기, -CONH-C₁₋₆알킬기, -CO-C₂₋₆알케닐기, -CO₂-C₂₋₆알케닐기, -CONH-C₂₋₆알케닐기, -CO-아릴기, -CO₂-아릴기, -CONH-아릴기, -CO-복소환기, -CO₂-복소환기, -CONH-복소환기(해당 C₁₋₆알킬기, C₂₋₆알케닐기, 아릴기, 복소환기는 할로겐 원자, C₁₋₆알킬기, 수산기, C₁₋₆알콕시기, 카르복실기, 아미노기, 아미노산 잔기, -PO₃H₂, -SO₃H, -CO-폴리에틸렌글리콜 잔기, -CO₂-폴리에틸렌글리콜 잔기, -CO-폴리에틸렌글리콜모노알킬에테르 잔기, -CO₂-폴리에틸렌글리콜모노알킬에테르잔기 등으로 치환될 수도 있음) 등의 치환기가 도입되어 있는 유도체를 들 수 있다.

[2047] 아미노기에 대해서는 -CO-C₁₋₆알킬기, -CO₂-C₁₋₆알킬기, -CO-C₂₋₆알케닐기, -CO₂-C₂₋₆알케닐기, -CO-아릴기, -CO₂-아릴기, -CO-복소환기, -CO₂-복소환기(해당 C₁₋₆알킬기, C₂₋₆알케닐기, 아릴기, 복소환기는 할로겐 원자, C₁₋₆알킬기, 수산기, C₁₋₆알콕시기, 카르복실기, 아미노기, 아미노산 잔기, -PO₃H₂, -SO₃H, -CO-폴리에틸렌글리콜 잔기, -CO₂-폴리에틸렌글리콜 잔기, -CO-폴리에틸렌글리콜모노알킬에테르 잔기, -CO₂-폴리에틸렌글리콜모노알킬에테르잔기, -PO₃H₂ 등으로 치환될 수도 있음) 등의 치환기가 도입되어 있는 유도체를 들 수 있다.

[2048] 카르복실기에 대해서는 C₁₋₆알콕시기, 아릴옥시기(해당 C₁₋₆알콕시기, 아릴옥시기는, 할로겐 원자 C₁₋₆알킬기, 수산기, C₁₋₆알콕시기, 카르복실기, 아미노기, 아미노산 잔기, -PO₃H₂, -SO₃H, 폴리에틸렌글리콜 잔기, 폴리에틸렌글리콜모노알킬에테르 잔기 등으로 치환될 수도 있음) 등의 치환기가 도입되어 있는 유도체를 들 수 있다.

[2049] 또한, 상기에서 "복소환기"란, 탄소 원자 이외에 질소 원자, 산소 원자 및 황 원자로부터 선택되는 1개 이상, 바람직하게는 1 내지 4개의 혜테로 원자를 갖는 포화 또는 불포화(부분적 불포화 및 완전 불포화를 포함함)된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기, 또는 이를 복소환기리의 축합환기 또는 이를 복소환과 벤젠, 시클로펜탄 및 시클로헥산으로부터 선택되는 탄소환의 축합환기를 의미한다.

[2050] "포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기"로서는, 예를 들면 피롤리디닐기, 테트라히드로푸릴기, 테트라히드로티에닐기, 이미다졸리디닐기, 피라졸리디닐기, 1,3-디옥소라닐기, 1,3-옥사티오라닐기, 옥사졸리디닐기, 티아졸리디닐기, 피페리디닐기, 피페라지닐기, 테트라히드로피라닐기, 테트라히드로티오피라닐기, 디옥사닐기, 모르폴리닐기, 티오모르폴리닐기, 2-옥소피롤리디닐기, 2-옥소피페리디닐기, 4-옥소피페리디닐기, 2,6-디옥소피페리디닐기 등을 들 수 있다.

[2051] "불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기"로서는, 예를 들면 피롤릴기, 푸릴기, 티에닐기, 이미다졸릴기, 1,2-디히드로-2-옥소이미다졸릴기, 피라졸릴기, 디아졸릴기, 옥사졸릴기, 이소옥사졸릴기, 티아졸릴기, 이소티아졸릴기, 트리아졸릴기(1,2,4-트리아졸릴기, 1,2,3-트리아졸릴기), 테트라졸릴기, 1,3,4-옥사디아졸릴기, 1,2,4-옥사디아졸릴기, 1,3,4-티아디아졸릴기, 1,2,4-티아디아졸릴기, 푸라자닐기, 피리딜기, 피리미디닐기, 3,4-디히드로-4-옥소피리미디닐기, 피리다지닐기, 피라지닐기, 1,3,5-트리아지닐기, 이미다졸리닐기, 피라졸리닐기, 옥사졸리닐기(2-옥사졸리닐기, 3-옥사졸리닐기, 4-옥사졸리닐기), 이소옥사졸리닐기, 티아졸리닐기, 이소티아졸리닐기, 피라닐기, 2-옥소피라닐기, 2-옥소-2,5,-디히드로푸라닐기, 1,1-디옥소-1H-이소티아졸릴기를 들 수 있다.

[2052] "축합환인 복소환기"로서는, 예를 들면 인돌릴기(예를 들면, 4-인돌릴기, 7-인돌릴기 등), 이소인돌릴기, 1,3-

디히드로-1,3-디옥소이소인돌릴기, 벤조푸라닐기(예를 들면, 4-벤조푸라닐기, 7-벤조푸라닐기 등), 인다졸릴기, 이소벤조푸라닐기, 벤조티오페닐기(예를 들면, 4-벤조티오페닐기, 7-벤조티오페닐기 등), 벤조옥사졸릴기(예를 들면, 4-벤조옥사졸릴기, 7-벤조옥사졸릴기 등), 벤즈이미다졸릴기(예를 들면, 4-벤즈이미다졸릴기, 7-벤즈이미다졸릴기 등), 벤조티아졸릴기(예를 들면, 4-벤조티아졸릴기, 7-벤조티아졸릴기 등), 인돌리디닐기, 퀴놀릴기, 이소퀴놀릴기, 1,2-디히드로-2-옥소퀴놀릴기, 퀴나졸리닐기, 퀴녹살리닐기, 신놀리닐기, 프탈라지닐기, 퀴놀리디닐기, 푸릴기, 프테리디닐기, 인돌리닐기, 이소인돌리닐기, 5,6,7,8-테트라하드로퀴놀릴기, 1,2,3,4-테트라하드로퀴놀릴기, 2-옥소-1,2,3,4-테트라하드로퀴놀릴기, 벤조[1,3]디옥솔릴기, 3,4-메틸렌디옥시피리딜기, 4,5-에틸렌디옥시피리미디닐기, 크로메닐기, 크로마닐기, 이소크로마닐기 등을 들 수 있다.

[2053] "의약 조성물"이란, 의약으로서의 유효 성분과 배합제 등을 포함하는 소위 "조성물" 이외에, 다른 약제의 합제 등을 포함하는 것이다. 본 발명의 의약 조성물은, 의료 현장에서 허용되는 범위에서 어떠한 다른 약제와 병용하여도 상관없다. 따라서, 본 의약 조성물은 다른 약제와의 병용을 위한 의약 조성물이라고 할 수 있다.

[2054] 또한, 본 발명의 의약 조성물은 인간으로 한정되지 않으며, 다른 포유 동물(마우스, 래트, 햄스터, 토끼, 고양이, 개, 소, 말, 양, 원숭이 등)에게 투여할 수 있다. 따라서, 본 발명의 의약 조성물은, 인간은 물론 동물용 의약품으로서도 유용하다.

[2055] 본 발명 화합물 또는 그의 염은, 의약상 허용되는 담체와 배합하여, 정제, 환제, 산제, 과립제, 좌제, 주사제, 점안제, 액제, 캡슐제, 트로키제, 에어졸제, 엘릭시르제, 혼탁제, 유제, 시럽제 등으로서 경구 또는 비경구적으로 투여할 수 있다.

[2056] "의약상 허용되는 담체"로서는, 제제 소재로서 관용의 각종 유기 또는 무기 담체 물질이 사용되고, 부형제, 활택제, 결합제, 붕괴제, 용제, 용해 보조제, 혼탁화제, 등장화제, 완충제, 무통화제 등으로서 배합된다. 또한, 필요에 따라 보존제, 항산화제, 착색제, 감미제 등의 제제 첨가물을 사용할 수도 있다. 상기 부형제로서는, 예를 들면 젖당, 백당, D-만니톨, 전분, 결정 셀룰로오스, 경질 규산 무수를 등을 들 수 있다. 상기 활택제로서는, 예를 들면 스테아르산마그네슘, 스테아르산칼슘, 탈크, 콜로이드실리카 등을 들 수 있다. 상기 결합제로서는, 예를 들면 결정 셀룰로오스, 백당, D-만니톨, 텍스트린, 히드록시프로필셀룰로오스, 히드록시프로필메틸셀룰로오스, 폴리비닐파리돈 등의 고분자 화합물을 들 수 있다. 상기 붕괴제로서는, 예를 들면 전분, 카르복시메틸셀룰로오스, 카르복시메틸셀룰로오스칼슘, 크로스카르멜로스나트륨, 카르복시메틸스타치나트륨 등을 들 수 있다. 상기 용제로서는, 예를 들면 주사용수, 알코올, 프로필렌글리콜, 마크로글, 참기름, 옥수수유, 프로필렌글리콜 지방산 에스테르 등을 들 수 있다. 상기 용해 보조제로서는, 예를 들면 폴리에틸렌글리콜, 프로필렌글리콜, D-만니톨, 벤조산벤질, 에탄올, 트리스아미노메탄, 콜레스테롤, 트리에탄올아민, 탄산나트륨, 시트르산나트륨 등을 들 수 있다. 상기 혼탁화제로서는, 예를 들면 스테아릴트리에탄올아민, 라우릴황산나트륨, 라우릴아미노프로피온산, 레시틴, 염화벤잘코늄, 염화벤제토늄, 모노스테아르산글리세린 등의 계면활성제; 폴리비닐알코올, 폴리비닐파리돈, 카르복시메틸셀룰로오스나트륨, 메틸셀룰로오스, 히드록시메틸셀룰로오스 등을 들 수 있다. 상기 등장화제로서는, 예를 들면 염화나트륨, 글리세린, D-만니톨 등을 들 수 있다. 상기 완충제로서는, 예를 들면 인산염, 아세트산염, 탄산염, 시트르산염 등의 완충액 등을 들 수 있다. 상기 무통화제로서는, 예를 들면, 벤질알코올 등을 들 수 있다. 상기 보존제로서는, 예를 들면 파라옥시벤조산에스테르류, 클로로부탄올, 벤질알코올, 페네틸알코올, 디히드로아세트산, 소르브산 등을 들 수 있다. 상기 항산화제로서는, 예를 들면 아황산염, 아스코르브산 등을 들 수 있다. 상기 감미료로서는, 예를 들면 아스파탐, 사카린나트륨, 스테비아 등을 들 수 있다. 상기 착색제로서는, 예를 들면 식용 황색 5호, 식용 적색 2호 및 식용 청색 2호 등의 식용 색소, 식용 레이크 색소, 산화철 등을 들 수 있다.

[2057] "11 β HSD1 저해제"란, 11 β HSD1의 효소로서의 기능을 특이적으로 저해하여 그 활성을 소실 또는 감소시키는 것을 의미하고, 예를 들면 후술하는 시험예 1의 조건에 기초하여, 11 β HSD1의 기능을 특이적으로 저해하는 것을 의미하며, 바람직하게는 후술하는 시험예 1의 조건하에, 11 β HSD1에 대한 50 % 저해 농도가 10 μM 미만, 보다 바람직하게는 1 μM 미만, 더욱 바람직하게는 100 nM 미만, 특히 바람직하게는 10 nM 미만인 것을 의미한다.

[2058] "글루코코르티코이드가 관여하는 병태"란, 예를 들면

(1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,

(2) 대사 증후군,

(3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,

- [2062] (4) 과식증,
- [2063] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [2064] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- [2065] (7) 녹내장, 또는
- [2066] (8) 골다공증
- [2067] 등을 의미한다.
- [2068] 본 발명 화합물을 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료약 또는 예방약으로서 사용하는 경우, 전신적 또는 국소적으로, 경구 또는 비경구로 투여할 수 있다. 투여량은 연령, 체중, 증상, 치료 효과 등에 따라 상이하지만, 예를 들면 통상적으로 성인 1인당, 1회에 0.1 mg 내지 1 g의 범위에서 1일 1회 내지 수회 투여할 수 있다. 또한, 본 발명 화합물은, 인간은 물론 인간 이외의 동물, 특히 포유류의 상기 질환의 치료약 및 예방약에도 사용할 수 있다. 본 발명 화합물을
- [2069] (1) 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 또는 지방간을 포함하는 대사성 질환,
- [2070] (2) 대사 증후군,
- [2071] (3) 심근 경색 또는 뇌졸중을 포함하는 치사적 혈관 사건,
- [2072] (4) 과식증,
- [2073] (5) 인지 장애, 신경 변성 질환, 감정 장애, 정신 분열병, 또는 식욕 증진을 포함하는 신경 기능 장애의 질환,
- [2074] (6) 면역능 저하를 나타내는 질환,
- [2075] (7) 녹내장, 또는
- [2076] (8) 골다공증
- [2077] 등의 치료약 또는 예방약으로서 사용하는 경우도 마찬가지이다.
- [2078] 본 발명 화합물은, 경구 투여를 위한 고체 조성물 및 액체 조성물, 또는 비경구 투여를 위한 주사제 등의 제제로 하기 위해, 적당한 희석제, 분산제, 흡착제, 용해제 등의 첨가제를 혼합할 수 있다. 또한, 본 발명의 의약 조성물은, 예를 들면 정제, 환제, 산제, 과립제, 좌제, 주사제, 점안제, 액제, 캡슐제, 트로키제, 에어졸제, 엘리시르제, 혼탁제, 유제, 시럽제 등의 공지된 형태를 가질 수도 있다.
- [2079] 본 발명의 의약 조성물이, 예를 들면 정제, 환제, 산제, 과립제 등의 고형 제제인 경우, 첨가제로서는, 예를 들면 젖당, 만니톨, 포도당, 히드록시프로필셀룰로오스, 미정성 셀룰로오스, 전분, 폴리비닐피롤리돈, 메타규산알루민산마그네슘, 규산 분말 무수물 등을 들 수 있다. 정제 또는 환제로 제조하는 경우에는, 필요에 따라 백당, 젤라틴, 히드록시프로필셀룰로오스 또는 히드록시메틸셀룰로오스프탈레이트 등의 위용성 또는 장용성 물질의 필름으로 피막할 수도 있고, 2 이상의 층을 포함하는 다층정일 수도 있다.
- [2080] 본 발명의 화합물, 의약 조성물 또는 약제는, 다른 의약 조성물 또는 약제(이하, 병용 약제라고도 함)와 조합하여 사용(이하, 병용이라고도 함)할 수 있다.
- [2081] 본 발명의 의약 조성물 또는 약제 및 병용 약제의 투여 시기는 한정되지 않으며, 이들을 투여 대상에 대하여 배합제로서 투여할 수도 있고, 동시에 투여할 수도 있고, 시간차를 두고 투여할 수도 있다. 또한, 본 발명의 의약 조성물 또는 약제 및 병용 약제를 포함하는 키트인 것을 특징으로 하는 약제일 수도 있다. 병용 약제의 투여량은, 임상상 사용되고 있는 투여량에 준할 수 있고, 투여 대상, 투여 대상의 연령 및 체중, 증상, 투여 시간, 제형, 투여 방법, 조합 등에 따라 적절하게 선택할 수 있다. 병용 약제의 투여 형태는 특별히 한정되지 않으며, 본 발명의 의약 조성물 또는 약제와 병용 약제가 조합될 수 있다.
- [2082] 하기 (1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제와 본 발명 화합물 또는 그의 염을 조합하여 이루어지는 의약이란, 해당 "의약"이 배합제인 것을 특징으로 하는 경우, 해당 "의약"이 해당 "(1) 내지 (5)로부터 선택되는 1 내지 3개의 약제"를 함유하여 이루어지는 약제와 본 발명 화합물을 함유하여 이루어지는 약제를 포함하는 키트인 것을 특징으로 하는 경우, 또는 해당 "의약"과 본 발명 화합물을 함유하여 이루어지는 약제가 동시에 또는 일정한 간격을 두고 투여되는 것을 특징으로 하는 경우, 등의 의약을 의미한다. 해당 의약에서, 바람직하게

는 글루코코르티코이드가 관여하는 병태의 치료제 또는 예방제이다.

[2083] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,

[2084] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,

[2085] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,

[2086] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,

[2087] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제

[2088] 병용 약제로서는,

[2089] (1) 고지혈증의 치료제 또는 예방제,

[2090] (2) 비만증의 치료제 또는 예방제,

[2091] (3) 당뇨병의 치료제 또는 예방제,

[2092] (4) 당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제,

[2093] (5) 고혈압증의 치료제 또는 예방제

[2094] 를 들 수 있고, 이들 1 내지 3개의 약제와 본 발명 화합물을 조합하여 사용할 수 있다.

[2095] "고지혈증의 치료제 또는 예방제"로서는, 예를 들면

[2096] (1) 피브레이트계의 약제(PPAR α 수용체 아고니스트),

[2097] (2) PPAR δ 수용체 아고니스트,

[2098] (3) 마이크로솜트리글리세리드 전송 단백(MTP) 저해제,

[2099] (4) 콜레스테릴에스테르 전송 단백(CETP) 저해제,

[2100] (5) 스타틴계의 약제(HMG-CoA 환원 효소 저해제),

[2101] (6) 음이온 교환 수지,

[2102] (7) 프로부콜,

[2103] (8) 니코틴산계의 약제,

[2104] (9) 식물 스테롤,

[2105] (10) 아포리포 단백질-A1(Apo-A1) 유도제,

[2106] (11) 리포 단백질 리파아제(LPL) 활성화제,

[2107] (12) 내피 리파아제 저해제,

[2108] (13) 에제티미브,

[2109] (14) IBAT 저해제,

[2110] (15) 스쿠알렌 합성 효소 저해제,

[2111] (16) ACAT 저해제,

[2112] (17) LXR 수용체 아고니스트,

[2113] (18) FXR 수용체 아고니스트,

[2114] (19) FXR 수용체 길항제,

[2115] (20) 아데노신 A1 아고니스트

[2116] 를 들 수 있고, 구체적으로는 클로피브레이트, 베자피브레이트, 페노피브레이트, 로바스타틴, 심바스타틴, 프라바스타틴, 플루바스타틴, 아트로바스타틴, 피타바스타틴, 로수바스타틴, 세리바스타틴, 클레스티라민, 콜레스티

미드, 니코틴산토코페롤, 니코몰, 니세리트롤, 소이스테롤 및 감마오리자놀 등을 들 수 있다.

[2117] "비만증의 치료제 또는 예방제"로서는, 예를 들면

[2118] (1) 렙틴 제제,

[2119] (2) 췌장 리파이아제 저해제,

[2120] (3) 노르아드레날린 · 세로토닌 재흡수 저해제,

[2121] (4) 카나비노이드 수용체 길항제,

[2122] (5) 모노 아민 재흡수 저해제,

[2123] (6) 디아실글리세롤아실트랜스페라아제 (DGAT) 저해제,

[2124] (7) 글루코오스 의존성 인슐린 분비 촉진 폴리펩티드(GIP) 수용체 길항제,

[2125] (8) 렙틴 수용체 아고니스트,

[2126] (9) 봄베신 수용체 서브 타입 3(BRS-3) 아고니스트,

[2127] (10) 페릴리핀 저해제,

[2128] (11) 아세틸-CoA 카르복실라아제1(ACC1) 저해제,

[2129] (12) 아세틸-CoA 카르복실라아제2(ACC2) 저해제,

[2130] (13) 지방산 신타아제 저해제,

[2131] (14) sn-1-아실-글리세롤-3-인산아실트랜스페라아제 (AGPAT) 저해제,

[2132] (15) 췌장 포스포리파이아제A2(pPLA2) 저해제,

[2133] (16) 멜라노코르틴(MC) 수용체 아고니스트,

[2134] (17) 신경 펩티드Y5(NPY5) 수용체 길항제,

[2135] (18) 탈공액 단백질(UCP) 유도제 또는 활성화제,

[2136] (19) 카르니틴 O-팔미토일트랜스페라아제1(CPT-1) 활성화약,

[2137] (20) CCK1(CCKA) 아고니스트,

[2138] (21) 모양체 신경 영양 인자(CNTF),

[2139] (22) CRF2 아고니스트,

[2140] (23) 신경 펩티드Y2(NPY2) 수용체 길항제,

[2141] (24) 신경 펩티드Y4(NPY4) 수용체 길항제,

[2142] (25) 갑상선 호르몬 수용체 베타 아고니스트,

[2143] (26) 성장 호르몬,

[2144] (27) ATP 시트레이트 리아제 저해약,

[2145] (28) 5-HT6 길항제, 및

[2146] (29) 5-HT2C 아고니스트

[2147] 를 들 수 있고, 구체적으로는 렙틴, 올리스타트, 시부트라민, 리모나반트 및 마진돌 등을 들 수 있다.

[2148] "당뇨병의 치료제 또는 예방제"로서는, 예를 들면

[2149] (1) 인슐린 제제(주사제),

[2150] (2) 저분자 인슐린 경구제,

[2151] (3) 술포닐우레이 수용체 아고니스트(SU제),

- [2152] (4) 비슬포닐우레아제 인슐린 분비 촉진제(SU제),
- [2153] (5) 칼륨 의존성 ATP(KATP) 채널 개구제,
- [2154] (6) α 글루코시다아제 저해제,
- [2155] (7) α 아밀라아제 저해제,
- [2156] (8) 인슐린 감수성 증강제,
- [2157] (9) 저분자 tGLP-1 수용체 아고니스트,
- [2158] (10) tGLP-1 펩티드 아날로그,
- [2159] (11) 디펩티딜 펩티다아제IV(DPP-IV) 저해제,
- [2160] (12) 글루카곤 수용체 길항제,
- [2161] (13) 글루코코르티코이드 수용체 길항제,
- [2162] (14) 비구아니드제,
- [2163] (15) SGLUT 저해제,
- [2164] (16) 과당-1,6-비스포스파타아제(FBPase) 저해제,
- [2165] (17) 글리코겐 신타아제 키나아제3(GSK-3) 저해제,
- [2166] (18) 포스포에놀피루브산 카르복시키나아제(PEPCK) 저해제,
- [2167] (19) 단백질 티로신 포스파타아제1B(PTPase1B) 저해제,
- [2168] (20) SH2 도메인 함유 이노시톨 포스파타아제(SHIP2) 저해제,
- [2169] (21) 글리코겐 포스포릴라아제(GP) 저해제,
- [2170] (22) 글루코키나아제 활성화제,
- [2171] (23) GPR40 수용체 아고니스트,
- [2172] (24) 피루브산 디히드로제나아제 키나아제(PDHK) 저해제,
- [2173] (25) 글루타민: 과당-6-인산 아미노트랜스페라아제(GFAT) 저해제,
- [2174] (26) 항산화약; 일산화질소 스캐빈저,
- [2175] (27) 카르니틴 0-팔미토일트랜스페라아제1(CPT-1) 저해약,
- [2176] (28) 성장 호르몬-방출 인자(GHRF),
- [2177] (29) 트리아실글리세롤 리파아제(호르몬 감수성 리파아제) 저해약,
- [2178] (30) PPAR γ 수용체 아고니스트,
- [2179] (31) PPAR γ 수용체 길항제,
- [2180] (32) PPAR α / γ 수용체 아고니스트,
- [2181] (33) AMP-활성화 단백질 키나아제(AMPK) 활성화제,
- [2182] (34) 아디포넥틴 수용체 아고니스트, 및
- [2183] (35) β 3 아드레날린 수용체 아고니스트
- [2184] 를 들 수 있고, 구체적으로는 인슐린, 툴부타미드, 글리클로피라미드, 아세토헥사미드, 클로르프로파미드, 글리부졸, 글리벤클라마이드, 글리클라자이드, 글리메피리드, 미티글리니드, 레파글리니드, 나테글리니드, 보글리보스, 아카르보스, 미글리톨, 말레산로시글리타존, 염산메트포르민, 염산피오글리타존 및 염산부포르민 등을 들 수 있다.

- [2185] "당뇨병 합병증의 치료제 또는 예방제"로서는, 예를 들면
- [2186] (1) 단백질 키나아제C β (PKC β) 저해제,
- [2187] (2) 앤지오텐신 II 수용체 길항제,
- [2188] (3) 알도오스 환원 효소 저해제,
- [2189] (4) 앤지오텐신 변환 효소(ACE) 저해제,
- [2190] (5) 당화 최종 산물(AGE) 생산 억제제,
- [2191] (6) 신경 장애 치료제, 및
- [2192] (7) 당뇨병성 신증 치료제
- [2193] 를 들 수 있고, 구체적으로는 에팔레스타트(키네닥), 염산멕실레틴, 및 염산이미다프릴 등을 들 수 있다.
- [2194] "고혈압증의 치료제 또는 예방제"로서는, 예를 들면
- [2195] (1) 티아지드계 이뇨약,
- [2196] (2) 티아지드계 유사 이뇨약,
- [2197] (3) 루프 이뇨약,
- [2198] (4) K 유지성 이뇨약,
- [2199] (5) β 차단약,
- [2200] (6) α , β 차단약,
- [2201] (7) α 차단약,
- [2202] (8) 중추성 교감 신경 억제약,
- [2203] (9) 말초성 교감 신경 억제약(라우윌피아 제제),
- [2204] (10) Ca 길항약(벤조티아제핀계),
- [2205] (11) Ca 길항약(디히드로페리딘계),
- [2206] (12) 혈관 확장약,
- [2207] (13) 앤지오텐신 변환 효소(ACE) 저해약,
- [2208] (14) 앤지오텐신 II 수용체 길항약,
- [2209] (15) 질산약,
- [2210] (16) 엔도셀린 ETA 수용체 길항제,
- [2211] (17) 엔도셀린-변환 효소 저해약; 네프릴라이신 저해약,
- [2212] (18) 프로스타글란дин; 프로스타노이드 FP 아고니스트,
- [2213] (19) 레닌 저해약,
- [2214] (20) NOS3 발현 인핸서; 프로스타사이클린 아날로그,
- [2215] (21) 포스포디에스테라아제V(PDE5A) 저해약,
- [2216] (22) 프로스타사이클린 아날로그, 및
- [2217] (23) 알도스테론 길항제

[2218] 를 들 수 있고, 구체적으로는 히드로클로로티아지드, 트리클로르메티아지드, 벤질히드로클로로티아지드, 메티크란, 인다파미드, 트리파미드, 클로르탈리돈, 메프루시드, 푸로세미드, 스피로놀락톤, 트리암테렌, 아테놀롤, 푸마르산비소프롤롤, 염산베타솔롤, 염산베반톨롤, 타르타르산메토프롤롤, 염산아세부톨롤, 염산셀리프롤롤, 니프라딜롤, 염산틸리솔롤, 나돌롤, 염산프로프라놀롤, 염산인데놀롤, 염산카르테올롤, 핀돌롤, 핀돌롤 서방제, 염

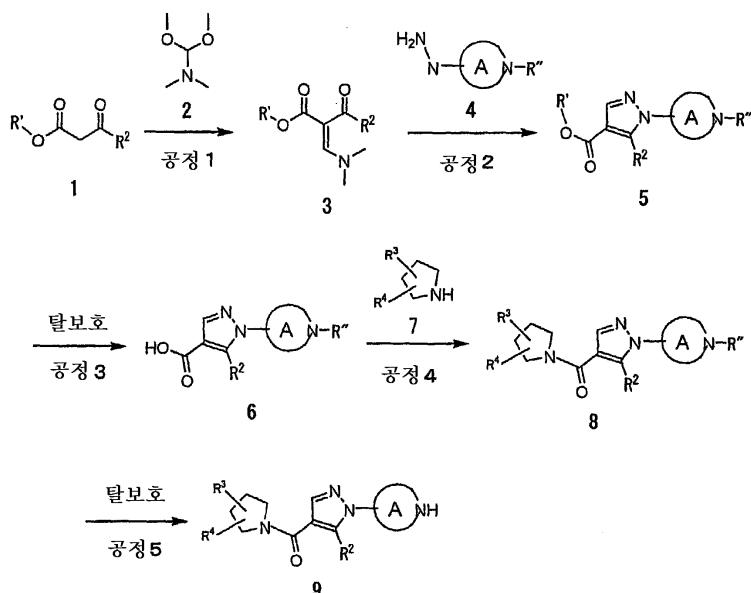
산부니트롤, 황산펜부토롤, 말론산보핀돌, 염산아모술랄, 염산아로티놀, 카르베딜, 염산라베탈, 우라피딜, 염산테라조신, 메실산독사조신, 염산부나조신, 염산프라조신, 메실산펜토라민, 염산클로니딘, 염산구안파신, 아세트산구아나벤즈, 메틸도파, 레세르핀, 레스신나민, 베실산암로디핀, 아라니디핀, 염산에포니디핀, 실니디핀, 염산니카르디핀, 니솔디핀, 니트렌디핀, 니페디핀, 니페디핀 서방제, 닐바디핀, 염산바르니디핀, 펠로디핀, 염산베니디핀, 염산마니디핀, 아젤니디핀, 염산델티아펩, 염산히드라진, 염산토도랄라진, 부드랄라진, 카드랄라진, 캡토프릴, 말레산에날라프릴, 알라세프릴, 염산델라프릴, 실라자프릴, 리시노프릴, 염산베나제프릴, 염산이미다프릴, 염산데모카프릴, 염산퀴나프릴, 트란돌라프릴, 폐린도프릴, 칸데사르탄실렉세틸, 발사르탄, 텔미사르탄, 올메사르탄메독소밀, 니트로프루시드나트륨 및 니트로글리세린 등을 들 수 있다.

[2219] 병용 약제로서는, 혈중 글루코코르티코이드값이 상승하는 약제, 예를 들면 부신피질 호르몬제 등을 들 수 있다. 혈중 글루코코르티코이드는, 내인성의 글루코코르티코이드, 예를 들면 코르티코스테론, 코르티솔 등 뿐만 아니라, 부신피질 호르몬제를 투여함에 따른 외인성의 글루코코르티코이드도 의미한다. 이들 1 내지 3개의 약제와 본 발명 화합물을 조합하여 사용할 수 있다.

[2220] 이어서, 본 발명 화합물의 제조 방법을 구체적으로 설명한다. 그러나, 본 발명 화합물의 제조 방법은 이것으로 한정되지 않는다. 본 제조 방법에 기재하지 않아도, 필요에 따라 관능기에 보호기를 도입하여 후속 공정에서 탈보호를 행하거나, 또는 각 공정의 순서를 교체하는 등의 방안에 의해 효율적으로 제조를 행할 수 있다. 보호기로서는, 예를 들면 카르복시 보호기(여기서 카르복시 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 카르복시 보호기를 의미하고, 예를 들면 메틸기, 에틸기, 프로필기, tert-부틸기, 벤질기, 파라메톡시벤질기 등을 들 수 있으며, 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 카르복실산으로 유도되는 에스테르를 형성하고 있음), 아미노 보호기(여기서 아미노 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 아미노 보호기를 의미하고, 예를 들면 tert-부톡시카르보닐기, 벤질옥시카르보닐기, 벤질기 등을 들 수 있으며, 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 아미노기로 유도할 수 있음), 수산기 보호기(여기서 수산기 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 수산기 보호기를 의미하고, 예를 들면 테트라하이드로피라닐기, 메톡시메틸기, 메톡시에톡시메틸기, 벤질옥시메틸기, 벤질기, p-메톡시벤질기, p-니트로벤질기, 트리메틸실릴기, t-부틸디메틸실릴기, 아세틸기, 벤조일기, 알릴기, t-부틸기 등을 들 수 있으며, 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 수산기로 유도할 수 있음) 등을 들 수 있다. 또한, 각 공정에서, 반응 후의 처리는 통상적으로 행해지는 방법으로 행할 수 있고, 단리 정제는 결정화, 재결정화, 실리카겔 크로마토그래피, 분광 HPLC 등의 관용되는 방법을 적절하게 선택하여, 조합하여 행할 수 있다.

[2221] 제조 방법 1

[2222] 본 발명 화합물 [1']에서, -X-가 -NH-인 화합물은 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2223]

[2224] (식 중, R'는 카르복시 보호기(여기서 카르복시 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 카르복시 보호기를 의미하고, 예를 들면 메틸기, 에틸기, 프로필기, tert-부틸기, 벤질기, 파라메톡시벤질기 등을

들 수 있음)를 나타내고, 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 카르복실산으로 유도되는 에스테르를 형성하고 있고, R''는 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 제거할 수 있는 아미노보호기(여기서 아미노 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 아미노 보호기를 의미하고, 예를 들면 tert-부톡시카르보닐기, 벤질옥시카르보닐기, 벤질기 등을 들 수 있음)를 나타내고, 기타 각 기호는 상기와 동일한 의미임).

[2225] 공정 1

이미 알려진 방법으로 합성한 β -케토에스테르 (1)에 디메틸포름아미드디메틸아세탈 (2)를 용매 중 또는 용매비존재하에 반응시킴으로써, 화합물 (3)이 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 디메틸포름아미드디메틸아세탈 (2)의 사용량은, β -케토에스테르 (1) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1.5 내지 약 3몰이다. 또한, 용매의 사용량은 특별히 한정되지 않으며, 반응 기질(β -케토에스테르 (1) 및 디메틸포름아미드디메틸아세탈 (2))의 종류나 사용량, 반응 온도, 반응 시간 등에 따라 적절하게 선택할 수 있다(이하에 설명하는 각 공정에서의 용매의 사용량에 대해서도 동일함).

[2227] 공정 2: 피라졸환을 구축하는 공정

이미 알려진 방법으로 합성한 히드라진 (4)와 화합물 (3)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (5)가 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, n-부탄올, 이소프로판올, 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 히드라진 (4)의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 히드라진 (4)가 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2229] 공정 3: 카르복실 보호기의 탈보호의 공정

공지된 방법으로 화합물 (5)의 카르복실 보호기 R'의 탈보호를 행함으로써, 화합물 (6)이 얻어진다.

[2231] 공정 4: 아미드화의 공정

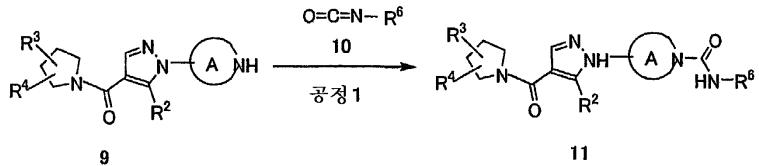
화합물 (6)과 아민 (7)을 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (8)이 얻어진다. 축합제로서는 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디아미다졸(CDI), 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시숙신산아미드(HOSu), 4-디메틸아미노피리딘(DMAP) 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 아세토니트릴, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (7)의 사용량은, 화합물 (6) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (6) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 아민 (7)이 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에 반응을 행할 수 있다. 또한, 카르복실산 (6)을 산할로겐화물 또는 혼합산 무수물로 유도하고, 염기 존재하에 아민 (7)과 반응시킬 수도 있다. 또한, 염기의 사용량은, 화합물 (6) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

[2233] 공정 5: 아미노 보호기의 탈보호의 공정

공지된 방법으로 화합물 (8)의 아미노 보호기 R''의 탈보호를 행함으로써, 화합물 (9)가 얻어진다. 필요하면 공지된 방법으로 염으로 할 수도 있다.

[2235] 제조 방법 2

본 발명 화합물 [1']에서 -X-가 $-N(R^1)-\circ$ 이고, $R^1\circ$ 이 $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 는 수소 원자임)인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2237]

(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2239] 공정 1: 우레아화의 공정

1) R^6 이 수소 이외인 경우

화합물 (9)에 이소시아네이트 (10)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (11)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су폴시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 이소시아네이트 (10)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다. 또한, 화합물 (9)와 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI)을 반응시킨 후(CDI의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 3몰임), 대응하는 아민과 반응시킬수도 있다.

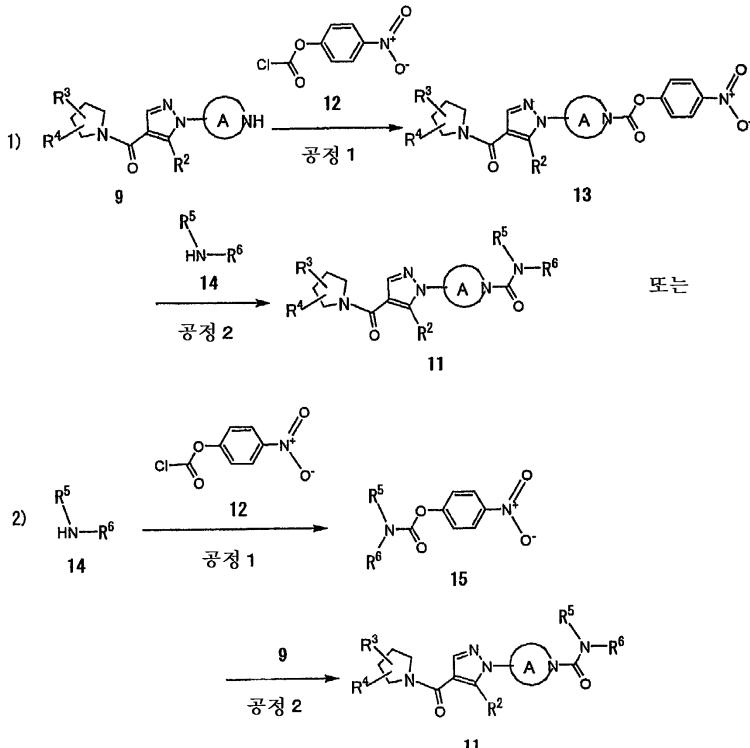
또한, R^6 이 관능기를 갖는 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 우레아화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등에 치환기를 갖는 경우, 우레아화한 후, 이를 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서, 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬су포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술폴시드로의 변환을 들 수 있다.

2) R^6 이 수소인 경우

화합물 (9)에 시안산염을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (11)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 물, 아세트산 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 시안산염의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 10몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2245] 제조 방법 3

[2246] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 $-CONR^5R^6$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2247]

[2248] (식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2249] 공정 1: 폐닐카르바메이트화의 공정

[2250] 화합물 (9)와 클로로포름산 4-니트로페닐 (12)를 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (13)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су 폭시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 염기로서는 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 클로로포름산 4-니트로페닐 (12)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 염기의 사용량을 화합물 (9) 1몰에 대하여, 약 2 내지 약 4몰로 반응을 행할 수 있다.

[2251] 공정 2: 우레아화의 공정

[2252] 폐닐카르바메이트 중간체 (13)에 아민 (14)를 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (11)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 디메틸су 폭시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 150 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (14)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 3몰이다. 아민 (14)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (13) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 3몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2253] 다른 방법으로서 화학식 2)로 표시된 바와 같이, 공정 1에서 아민 (14)와 클로로포름산 4-니트로페닐 (12)를 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (15)을 얻고, 공정 2에서 화합물이 (15)에 아민 (9)를 반응시킴으로써 화합물 (11)을 얻을 수 있다.

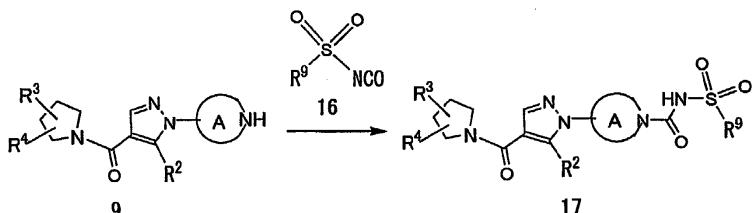
[2254] 또한, 클로로포름산 4-니트로페닐 (12) 대신에 다른 클로로포름산에스테르, 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI)을 사용할 수도 있다.

[2255] 또한, R⁵ 및/또는 R⁶이 관능기를 갖는 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등인 경우, 적절하게 보호기에

의해 보호하여 우레아화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등에 치환기를 갖는 경우, 우레아화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬су포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술폐시드로의 변환을 들 수 있다.

제조 방법 4

[2257] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 $-CONR^5R^6$ (식 중, R^5 는 수소 원자, $R^6=-S(=O)_2R^9$)인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2258]

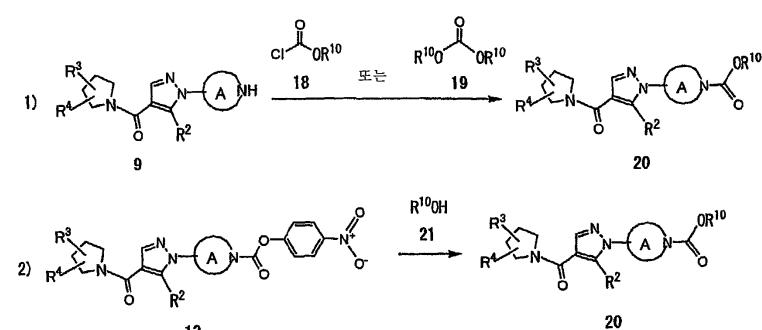
(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2260] 공정 1: 술폐닐우레아화의 공정

화합물 (9)에 술폐닐이소시아네이트 (16)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (17)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸술폭시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 술폐닐이소시아네이트 (16)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2262] 제조 방법 5

[2263] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 $-COOR^{10}$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2264]

(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2265] 공정 1: 카르바메이트화의 공정

화합물 (9)에 클로로탄산에스테르 (18) 또는 탄산에스테르 (19)를 염기 존재하에, 용매 중 또는 무용매로 반응시킴으로써 화합물 (20)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸술폭시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 염기로서는 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 150 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 클로로탄산에스테르 (18) 또는 탄산에스테르 (19)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 염기의

사용량을 화합물 (9) 1몰에 대하여 약 2 내지 약 4몰로 반응을 행할 수 있다.

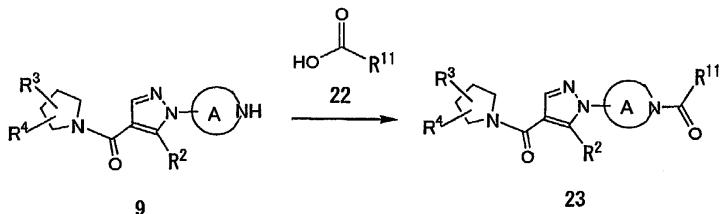
또한, R^{10} 이 관능기를 갖는 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 카르바메이트화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등에 치환기를 갖는 경우, 카르바메이트화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬슬포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 슬피드로부터 술폰, 술폭시드로의 변환을 들 수 있다.

다른 방법으로서 화학식 2)로 표시된 바와 같이, 제조 방법 3의 공정 1에서 제조한 폐닐카르바메이트 중간체 (13)에 알코올 (21)을 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (20)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 디메틸솔忿시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 염기로서는 수소화나트륨, 수소화칼륨, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 150 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 알코올 (21)의 사용량은, 폐닐카르바메이트 중간체 (13) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 3몰이다. 염기의 사용량은, 폐닐카르바메이트 중간체 (13) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다.

또한, R¹⁰이 관능기를 갖는 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 카르바메이트화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등에 치환기를 갖는 경우, 카르바메이트화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬슬포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술폭시드로의 변환을 들 수 있다.

제조 방법 6

본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 $-COR^{11}$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



(신증간경총는상기의통인척암모인)

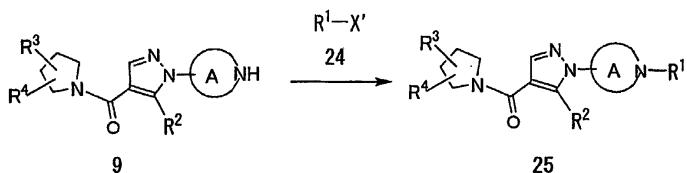
고점 1: 이미드 희의 고점

화합물 (9)와 카르복실산 (22)를 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (23)이 얻어진다. 축합제로서는 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염 (WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI), 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시숙신산이미드(HOSu), 4-디메틸아미노피리딘 (DMAP) 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 아세토니트릴, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 카르복실산 (22)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 화합물 (9)가 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에, 반응을 행할 수 있다. 또한, 카르복실산 (22)를 산활로겐화물 또는 혼합산 무수물로 유포하고, 염기 존재하에 화합물 (9)과 반응시킬 수도 있다. 또한, 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

또한, R¹¹이 관능기를 갖는 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 아미드화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기, 시클로알킬기, 아릴기, 복소환기 등에 치환기를 갖는 경우, 아미드화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬슬포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술폭시드로의 변환을 들 수 있다.

제조 방법 7

본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)$ -이고, R^1 이 C_{1-6} 알킬기 또는 시클로알킬기인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



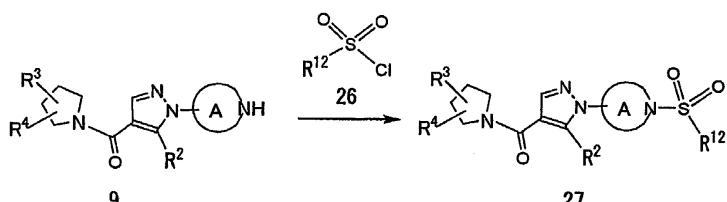
(식 중, X'는 할로겐 원자를 나타내고, 기타 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

화합물 (9)와 알킬할라이드 (24)를 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (25)가 얻어진다. 염기로서는 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 수소화나트륨, 수소화칼륨, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 용매로서는 아세토니트릴, 아세톤, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су포시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 30분 내지 24시간이다. 알킬할라이드 (24)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 염기의 사용량을 화합물 (9) 1몰에 대하여 약 2 내지 약 4몰로 반응을 행할 수 있다. 또한, 화합물 (9)와 대응하는 알데히드, 케톤, 또는 이들의 등가체로부터 환원적 아미노화를 행할 수도 있다.

또한, R¹이 관능기를 갖는 알킬기인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 N-알킬화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기에 치환기를 갖는 경우, N-알킬화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬술포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술퍼드로부터 숤폰, 술폴시드로의 변환을 들 수 있다.

제조 방법 8

본 발명 화합물 [1']]에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 $-S(=O)-R^{12}$ 인 화합물을, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

공정 1: 술포닐화의 공정

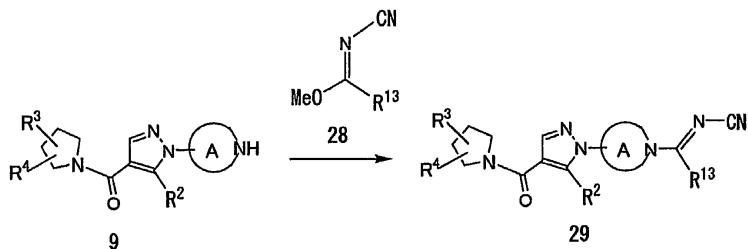
화합물 (9)와 염화 술포닐 (26)을 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (27)이 얻어진다. 염기로서

는 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화리튬, 수소화나트륨, 수소화칼륨, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 용매로서는 아세토니트릴, 아세톤, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су 폴시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 툴루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 30분 내지 24시간이다. 염화 술포닐 (26)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 염기의 사용량을 화합물 (9) 1몰에 대하여 약 2 내지 약 4몰로 반응을 행할 수 있다. 또한, 화합물 (9)와 대응하는 술폰산 무수물을 반응시킬 수도 있다.

[2291] 또한, R¹²가 관능기를 갖는 알킬기인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하여 술포닐화한 후, 탈보호를 행할 수 있다. 알킬기에 치환기를 갖는 경우, 술포닐화한 후, 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬술포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술퍼드로부터 술폰, 술폴시드로의 변환을 들 수 있다.

[2292] 제조 방법 9

[2293] 본 발명 화합물 [1']에서 -X-가 -N(R¹)-이고, R¹이 -C(=NCN)R¹³인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2294]

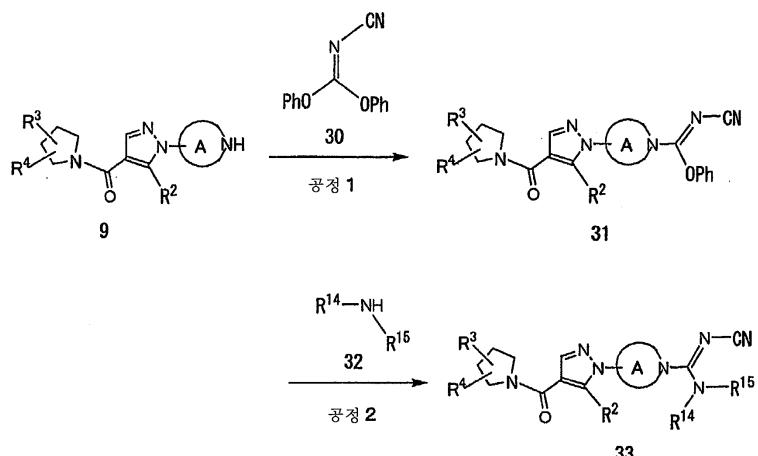
[2295] (식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2296] 공정 1: N-시아노아미딘의 제조 공정

[2297] 화합물 (9)와 N-시아노이미드아세트산에스테르 (28)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (29)가 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су 폴시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 툴루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. N-시아노이미드아세트산에스테르 (28)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2298] 제조 방법 10

[2299] 본 발명 화합물 [1']에서 -X-가 -N(R¹)-이고, R¹이 -C(=NCN)NR¹⁴R¹⁵인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2300]

(식 중, Ph는 폐닐기를 나타내고, 기타 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2302] 공정 1

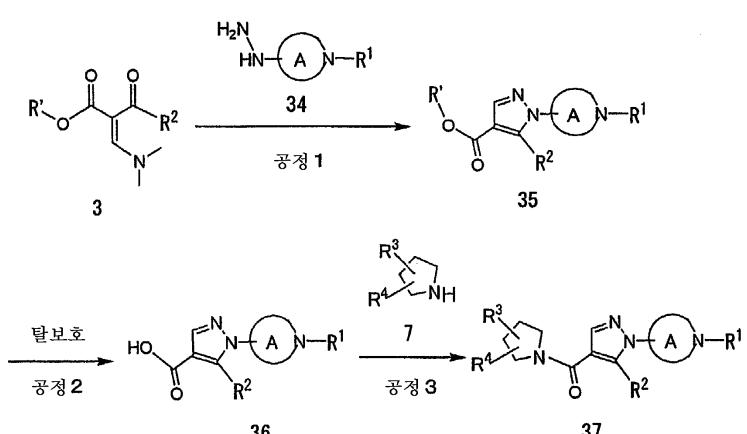
화합물 (9)에 디페닐 N-시아노카르본이미데이트 (30)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (31)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су 폴시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 디페닐 N-시아노카르본이미데이트 (30)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (9)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2304] 공정 2: N-시아노구아니딘의 제조 공정

화합물 (31)에 아민 (32)를 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (33)이 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, N-메틸피롤리돈, 디메틸су 폴시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 150 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (32)의 사용량은, 화합물 (31) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 5몰이다. 아민 (32)가 염인 경우, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (31) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 20몰임) 반응을 행할 수 있다.

[2306] 제조 방법 11

본 발명 화합물 [1']에서 -X-가 -N(R¹)-이고, R¹이 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2308]

(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

공정 1: 히드라진 (34)와 화합물 (3)으로부터 피라졸환을 구축하는 공정

이미 알려진 방법으로 합성한 히드라진 (34)와 제조 방법 1의 공정 1에서 얻은 화합물 (3)을 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (35)가 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, n-부탄올, 이소프로판올, 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 히드라진 (34)의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1.5 내지 약 3몰이다. 히드라진 (34)가 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1.5 내지 약 3몰임) 반응을 행할 수 있다.

공정 2: 카르복실 보호기 R'의 탈보호의 공정

공지된 방법으로 카르복실 보호기 R'의 탈보호를 행함으로써, 화합물 (36)이 얻어진다.

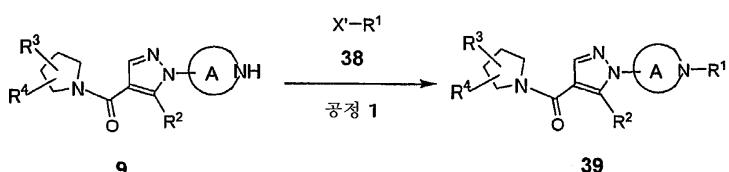
공정 3: 아미드화의 공정

화합물 (36)과 아민 (7)을 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (37)이 얻어진다. 축합제로서는, 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디아미다졸(CDI), 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시 숙신산이미드(HOSu), 4-디메틸아미노페리딘 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 아세토니트릴, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (7)의 사용량은, 화합물 (36) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (36) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 아민 (7)이 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 퍼리딘 등의 염기 존재하에 반응을 행할 수 있다. 또한, 카르복실산 (36)을 산할로겐화물로 유도한 후, 염기 존재하에 아민 (7)과 반응시킬 수도 있다. 또한, 염기의 사용량은, 화합물 (36) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

또한, R¹이 관능기를 갖는 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하고, 그 후 탈보호를 행할 수 있다. 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기에 치환기를 갖는 경우, 그 후 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬술포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술퍼드로부터 술폰, 술폭시드로의 변환을 들 수 있다.

제조 방법 12

본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 화합물을, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



(식 출 가 기호는 삼기와 독일학 의미이)

문제 1: 팔라듐 촉매 불호발트/하트비크(Buchwald/Hartwig) 혼 아미노화의 과정

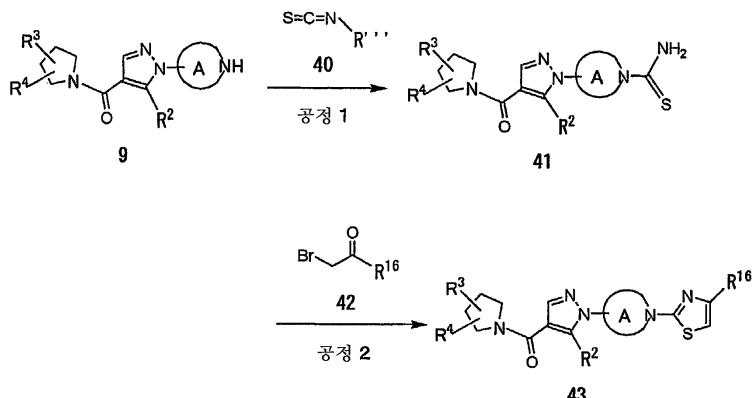
제조 방법 1에서 얻은 화합물 (9)와 방향족 할라이드 (38)을 팔라듐 촉매 및 염기의 존재하에, 용매 중 반응시
킴으로써 화합물 (39)가 얻어진다. 팔라듐 촉매로서는, 아세트산팔라듐과 2,2'-비스(디페닐포스피노)-1,1'-비

나프탈의 혼합물, 비스(디페닐포스피노)페로센염화팔라듐(II), 트리스(디벤질리텐아세톤)디팔라듐 등을 들 수 있다. 염기로서는, 인산삼칼륨(K_3PO_4), 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산세슘, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 칼륨tert-부톡시드 등을 들 수 있다. 용매로서는 1,2-디메톡시에탄, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, 벤젠, 톨루엔, 크실렌, tert-부탄올 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 방향족 할라이드 (38)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 팔라듐 촉매 및 염기의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 0.01 내지 약 0.1몰 및 약 1 내지 약 2몰이다.

[2323] 또한, R^1 이 관능기를 갖는 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 경우, 적절하게 보호기에 의해 보호하고, 그 후 탈보호를 행할 수 있다. 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환에 치환기를 갖는 경우, 그 후 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬су포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 슬퍼드로부터 술폰, 술폭시드로의 변환을 들 수 있다.

[2324] 제조 방법 13

[2325] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 아릴기 또는 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2326]

[2327] (식 중, R''' 는 질소 원자 위의 치환기(에톡시카르보닐기, 벤조일기, 9-플루오레닐메톡시카르보닐기 등을 들 수 있음)이고, 기타 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2328] 공정 1: 티오우레아화의 공정

[2329] 제조 방법 1에서 얻은 화합물 (9)와 이소티오시아네이트 (40)을 용매 중 반응시킨 후, 이미 알려진 방법에 의해 질소 원자 위의 치환기(R'''')를 제거하여 화합물 (41)을 얻는다. 이소티오시아네이트 (40)으로서는, 에톡시카르보닐이소티오시아네이트, 벤조일이소티오시아네이트, 9-플루오레닐메톡시카르보닐이소티오시아네이트 등을 들 수 있다. 용매로서는 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸су포시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 이소티오시아네이트 (40)의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 또한, 화합물 (9)에 티오포스겐을 작용시킨 후(티오포스겐의 사용량은, 화합물 (9) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰임), 암모니아 처리를 행할 수 있다.

[2330] 공정 2: 티아졸환을 구축하는 공정

[2331] 화합물 (41)과 할로메틸케톤 (42)를 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (43)이 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, n-부탄올, 이소프로판올, 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 할로메틸케톤 (42)의 사용량은, 화합물 (41) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

[2332]

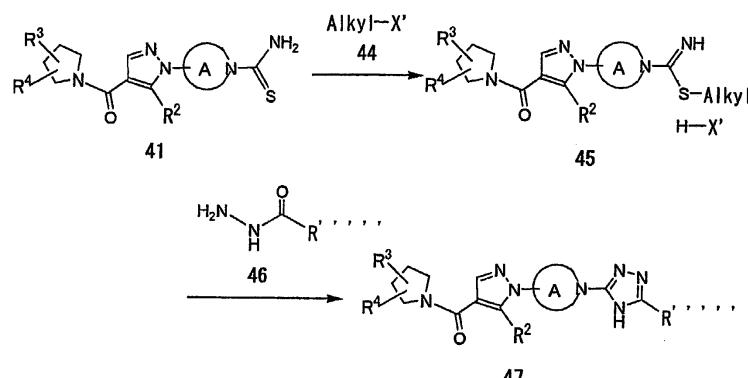
또한, 관능기를 갖는 티아졸릴기는, 적절하게 보호기에 의해 보호하고, 그 후 탈보호를 행할 수 있다. 티아졸릴기에 치환기를 갖는 경우, 그 후 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬술포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술풍시드로의 변환을 들 수 있다.

[2333]

제조 방법 14

[2334]

본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 이고, R^1 이 불포화된 단환인 5원 또는 6원의 복소환기인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2335]

(식 중, X'는 할로겐 원자, AlkyI은 C₁₋₆알킬기, R'''''는 카르복실기, C₁₋₆알킬기(해당 C₁₋₆알킬기는, 할로겐 원자 및 수산기로부터 선택되는 동일하거나 상이할 수 있는 1 이상의 치환기로 치환될 수도 있음), 또는 시클로알킬기를 나타내고, 기타 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2336]

공정 1

[2338]

제조 방법 13의 공정 1에서 얻은 화합물 (41)과 알킬할라이드 (44)를 용매 중 반응시킴으로써, 이소티오우레아·할로겐화수소산염 (45)가 얻어진다. 용매로서는 아세토니트릴, 아세톤, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸술포시드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 30분 내지 24시간이다. 알킬할라이드 (44)의 사용량은, 화합물 (41) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다.

[2339]

공정 2: 이소티오우레아와 히드라지드로부터 트리아졸환을 구축하는 공정.

[2340]

이소티오우레아·할로겐화수소산염 (45)와 공지된 방법으로 합성한 히드라지드 (46)을 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (47)이 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, 이소프로판올, n-부탄올, 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디메틸술포시드, 디클로로메탄, 1,2-디클로로에탄, 클로로포름, 벤젠, 클로로벤젠, O-디클로로벤젠, 톨루엔, 크실렌, 피리딘, 2,6-루티딘, 2,4,6-콜리딘, 아세트산, 물 또는 이를 혼합 용매 등을 들 수 있다. 염기로서는 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수소화나트륨, 수소화칼륨, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 30분 내지 24시간이다. 히드라지드 (46)의 사용량은, 이소티오우레아·할로겐화수소산염 (45) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 이소티오우레아·할로겐화수소산염 (45) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 히드라지드 (46)이 염인 경우, 염기의 사용량을 이소티오우레아·할로겐화수소산염 (45) 1몰에 대하여 약 2 내지 약 4몰로 반응을 행할 수 있다.

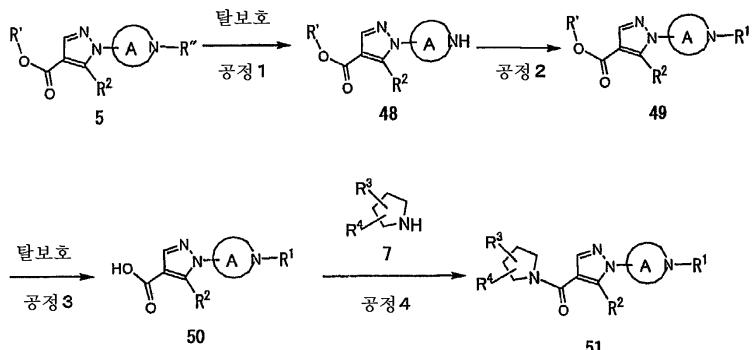
[2341]

또한, 관능기를 갖는 트리아졸릴기는, 적절하게 보호기에 의해 보호하고, 그 후 탈보호를 행할 수 있다. 트리아졸릴기에 치환기를 갖는 경우, 그 후 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬술포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기,

술피드로부터 술폰, 술포시드로의 변환을 들 수 있다.

[2342] 제조 방법 15

[2343] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-N(R^1)-$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2344]

[2345] (식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

[2346] 공정 1: 아미노 보호기의 탈보호의 공정

[2347] 제조 방법 1의 공정 2에서 얻은 화합물 (5)의 아미노 보호기 R'' 의 탈보호를 행함으로써 화합물 (48)이 얻어진다.

[2348]

공정 2: R^1 의 도입

[2349]

제조 방법 2 내지 10, 제조 방법 12 내지 14와 동일한 방법으로 화합물 (48)에 R^1 을 도입함으로써, 화합물 (49)이 얻어진다.

[2350]

공정 3: 카르복실 보호기의 탈보호의 공정

[2351]

공지된 방법으로 화합물 (49)의 카르복실 보호기 R' 의 탈보호를 행함으로써, 화합물 (50)이 얻어진다.

[2352]

공정 4: 아미드화의 공정

[2353]

화합물 (50)과 아민 (7)을 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (51)이 얻어진다. 축합제로서는 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI), 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시숙신산이미드(HOSu), 4-디메틸아미노페리딘(DMAP) 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 테트라하이드로푸란, 아세토니트릴, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (7)의 사용량은, 화합물 (50) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (50) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 아민 (7)이 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 페리딘 등의 염기 존재하에(염기의 사용량은, 화합물 (50) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰임) 반응을 행할 수 있다.

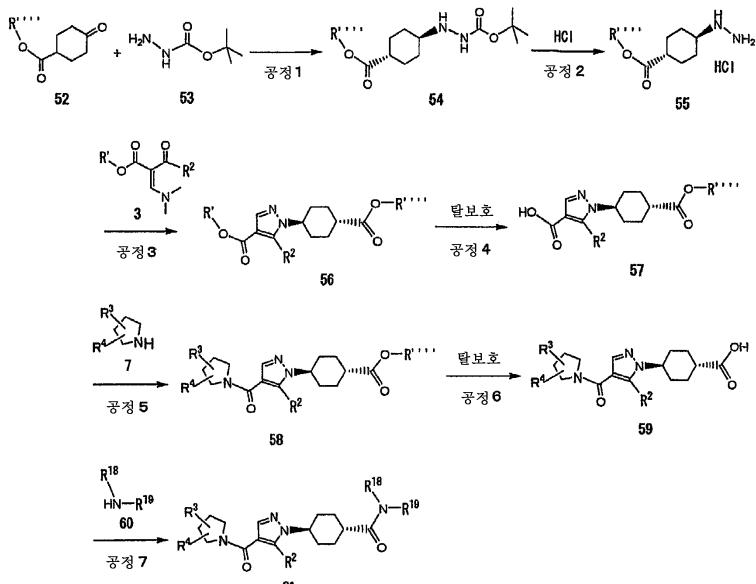
[2354]

또한, 관능기를 갖는 R^1 은 적절하게 보호기에 의해 보호하고, 그 후 탈보호를 행할 수 있다. R^1 에 치환기를 갖는 경우, 그 후 이들을 이미 알려진 방법으로 다른 관능기로 변환하는 것도 가능하다. 예로서 히드록실기로부터 알콕시기 또는 케톤, 아미노기로부터 알킬아미노기, 알킬카르보닐아미노기, 알킬су포닐아미노기, 알콕시카르보닐기로부터 카르복실기, 아미노카르보닐기, 알킬아미노카르보닐기, 히드록시메틸기, 술피드로부터 술폰, 술포시드로의 변환을 들 수 있다.

[2355]

제조 방법 16

[2356] 본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-C(R^7R^8)-$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2357]

(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미이고, 여기서 $R^{''''}$ 는 카르복시 보호기(여기서 카르복시 보호기란, 유기 합성 화학의 분야에서 일반적으로 사용되는 카르복시 보호기를 의미하고, 예를 들면 메틸기, 에틸기, 프로필기, tert-부틸기, 벤질기, 파라메톡시벤질기 등을 들 수 있음)를 나타내고, 가수분해 또는 접촉 수소 첨가 반응 등에 의해 용이하게 카르복실산으로 유도되는 에스테르를 형성할 수 있음)

[2359]

공정 1: 환원적 알킬화

[2360]

케톤 (52)와 카르바진산 tert-부틸 (53)을 환원제 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (54)가 얻어진다. 환원제로서는 수소화붕소나트륨, 수소화시아노붕소나트륨, 트리아세톡시수소화붕소나트륨, 보란 착체 등을 들 수 있다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, n-부탄올, 이소프로판올, 디클로로메탄, 클로로포름, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 벤젠, 톨루엔, 크릴렌, 아세트산 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 환원제의 사용량은, 화합물 (52) 1몰에 대하여 통상적으로 약 2 내지 약 5몰이다.

[2361]

공정 2: 탈BOC(tert-부톡시카르보닐기)

[2362]

화합물 (54)에 4 N 염산아세트산에틸 용액, 또는 4 N 염산 1,4-디옥산 용액을 첨가하여 반응시킴으로써 히드라진 염산염 (55)가 얻어진다. 또한, 용매 중 트리플루오로아세트산을 작용시켜 탈BOC한 후, 염산염으로 할 수도 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름 등을 들 수 있다.

[2363]

공정 3: 히드라진 염산염 (55)와 화합물 (3)으로부터 피라졸환을 구축하는 공정

[2364]

히드라진 염산염 (55)와 화합물 (3)을 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (56)이 얻어진다. 용매로서는 메탄올, 에탄올, n-프로판올, n-부탄올, 이소프로판올, 아세토니트릴, 디에틸에테르, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 디클로로메탄, 클로로포름, 벤젠, 톨루엔, 크릴렌, 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 염기로서는 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 250 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 히드라진 염산염 (55)의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 화합물 (3) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다.

[2365]

공정 4: 카르복실 보호기의 탈보호의 공정

[2366]

공지된 방법으로 화합물 (56)의 카르복실 보호기 R'의 탈보호를 행함으로써, 화합물 (57)이 얻어진다.

[2367]

공정 5: 아미드화의 공정

[2368] 화합물 (57)과 아민 (7)을 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (58)이 얻어진다. 축합제로서는 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI), 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시숙신산이미드(HOSu), 4-디메틸아미노페리딘(DMAP) 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 아세토니트릴, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (7)의 사용량은, 화합물 (57) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (57) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 아민 (7)이 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 페리딘 등의 염기 존재하에, 반응을 행할 수 있다. 또한, 카르복실산 (57)을 산할로겐화물 또는 혼합산 무수물로 유도하고, 염기 존재하에 아민 (7)과 반응시킬 수도 있다. 또한, 염기의 사용량은, 화합물 (57) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

[2369] 공정 6: 카르복실 보호기의 탈보호의 공정

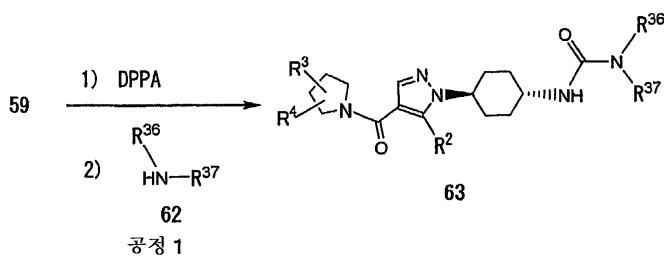
[2370] 공지된 방법으로 화합물 (58)의 카르복실 보호기 R⁴의 탈보호를 행함으로써, 카르복실산 (59)가 얻어진다.

[2371] 공정 7: 아미드화의 공정

[2372] 카르복실산 (59)와 아민 (60)을 축합제 및 첨가제의 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 화합물 (61)이 얻어진다. 축합제로서는 디시클로헥실카르보디이미드(DCC), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카르보디이미드 염산염(WSC·HCl), 디이소프로필카르보디이미드, 1,1'-카르보닐디이미다졸(CDI) 또는 디페닐포스포릴아지드(DPPA) 등을 들 수 있다. 첨가제로서는 1-히드록시벤조트리아졸(HOBT), N-히드록시숙신산이미드(HOSu), 4-디메틸아미노페리딘(DMAP) 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 아세토니트릴, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아민 (60)의 사용량은, 카르복실산 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다. 또한, 축합제 및 첨가제의 사용량은, 화합물 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 각각 약 1 내지 약 1.5몰 및 약 1 내지 약 1.5몰이다. 아민 (60)이 염인 경우, 탄산나트륨, 탄산칼륨, 탄산수소나트륨, 탄산수소칼륨, 아세트산나트륨, 아세트산칼륨, 수산화나트륨, 수산화칼륨, 수산화리튬, 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 페리딘 등의 염기 존재하에, 반응을 행할 수 있다. 또한, 카르복실산 (59)를 산할로겐화물 또는 혼합산 무수물로 유도하고, 염기 존재하에 아민 (60)과 반응시킬 수도 있다. 또한, 염기의 사용량은, 카르복실산 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 1.5몰이다.

[2373] 제조 방법 17

[2374] 본 발명 화합물 [1']에서 -X-가 -C(R⁷R⁸)⁸-인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



[2375]

[2376] (식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

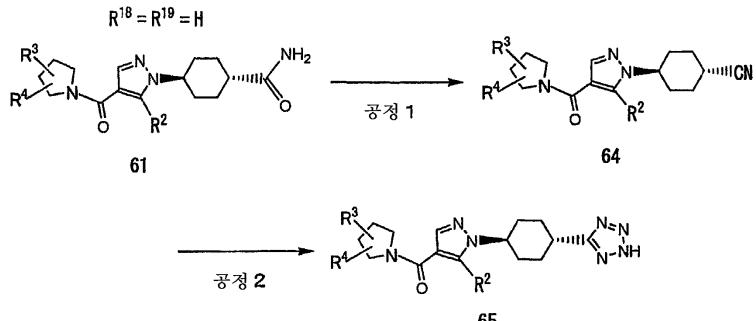
[2377] 공정 1: 우레아화의 공정

[2378] 카르복실산 (59)를 디페닐포스포릴아지드(DPPA)와 염기 존재하에 용매 중 반응시켜 이소시아네이트로 유도한 후, 아민 (62)와 반응시킴으로써 우레아 (63)이 얻어진다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 테트라하이드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 벤젠, 톨루엔, 크실렌 등을 들 수 있다. 염기로서는 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 페리딘 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 이소시아네이트로 유도하는 공정이 통상적으로 20 °C 내지 150 °C이고, 우레아로 유도하는 공정이 통상적으로 0 °C 내지 100 °C이다. 반응

시간은, 양 공정 모두 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. DPPA의 사용량은, 카르복실산 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 카르복실산 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 아민 (62)의 사용량은, 카르복실산 (59) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 5몰이다.

제조 방법 18

본 발명 화합물 [1']에서 $-X-$ 가 $-C(R^7R^8)-$ 인 화합물은, 이하의 공정에 의해 제조할 수 있다.



(식 중, 각 기호는 상기와 동일한 의미임)

공정 1: 시아노화의 공정

아미드 (61)과 탈수제를 염기 존재하에, 용매 중 반응시킴으로써 니트릴 (64)가 얹어진다. 탈수제로서는 트리플루오로메탄술폰산 무수물, p-톨루엔솔포닐클로라이드, 염화트리를로로아세틸, 트리플루오로아세트산 무수물, 옥시염화인, 염화티오닐 등을 들 수 있다. 염기로서는 트리에틸아민, N,N-디이소프로필에틸아민, 피리딘 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 테트라히드로푸란, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 피리딘 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 100 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 탈수제의 사용량은, 아미드 (61) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다. 염기의 사용량은, 아미드 (61) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다.

공정 2: 테트라졸환을 구축하는 공정

니트릴 (64)를 아지드화제 존재하에 용매 중 반응시킴으로써, 테트라졸 (65)가 얻어진다. 아지드화제로서는 아지화나트륨, 아지드트리메틸주석, 아지드트리부틸주석, 아지드트리메틸실란 등을 들 수 있다. 용매로서는 디클로로메탄, 클로로포름, 테트라히드로포란, 1,2-디메톡시에탄, 1,4-디옥산, N,N-디메틸포름아미드, 벤젠, 툴루엔, 크실렌 또는 이들 혼합 용매 등을 들 수 있다. 반응 온도는, 통상적으로 20 °C 내지 150 °C이다. 반응 시간은, 통상적으로 1 시간 내지 24 시간이다. 아지드화제의 사용량은, 니트릴 (64) 1몰에 대하여 통상적으로 약 1 내지 약 2몰이다.

또한, 본 명세서에서 기재한 제조 방법은, 본 발명 화합물의 제조 방법의 일례이고, 유기 합성 화학의 분야에서 공지된 통상법을 조합함으로써, 상기에서 설명한 이외의 화합물에 대해서도 제조할 수 있다.

실시예

이하, 본 발명의 복소환 화합물 및 그의 제조 방법을 실시예에 의해 구체적으로 설명하지만, 본 발명은 이들 실시예에 의해 한정되지 않는다.

실시예 1

1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조

공정 1

2-시클로프로필카르보닐-3-디메틸아미노아크릴산메틸의 제조

3-시클로프로필-3-옥소프로피온산메틸(2.0 g)을 톨루엔(20 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 디메틸포름아미드 디메틸아세탈(3.0 mL)을 첨가하여 3 시간 동안 환류하였다. 반응 혼합물을 방냉한 후 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(n -헥산:아세톤=2:1)로 정제하여, 황색 유상의 표기 화합물(2.61 g)을 얻었다.

[2394] 공정 2

[2395] 1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산메틸의 제조

[2396] 이전 공정에서 제조한 2-시클로프로필카르보닐-3-디메틸아미노아크릴산메틸(1.0 g)과 이미 알려진 방법으로 합성한 4-히드라지노피페리딘-1-카르복실산벤질 염산염(1.49 g)을 에탄올에 혼탁시켰다. 얻어진 혼탁액에 트리에틸아민(0.78 mL)을 첨가하여 3.5 시간 동안 환류하였다.

[2397] 반응 혼합물에 물을 첨가하여 디에틸에테르로 추출하였다. 디에틸에테르층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(n-헥산:아세트산에틸=2.5:1)로 정제하여, 황색 유상의 표기 화합물(1.58 g)을 얻었다.

[2398] 공정 3

[2399] 1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산의 제조

[2400] 이전 공정에서 제조한 1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산메틸(1.58 g)을 테트라히드로푸란(5 mL), 메탄올(5 mL), 물(10 mL)에 용해하고, 수산화리튬 1수화물(834 mg)을 첨가하여 50 °C에서 6 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 2 N 염산으로 산성으로 한 후, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디에틸에테르, n-헥산을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(1.27 g)을 얻었다.

[2401] 공정 4

[2402] 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(피리딘-3-일)파롤리딘의 제조

[2403] 이전 공정에서 제조한 1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산(800 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(332 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(498 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(10 mL)에 용해하고, 15분간 교반하였다. 얻어진 용액에 3-(피리딘-3-일)파롤리딘(330 mg), 4-디메틸아미노피리딘(촉매량)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=11:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(1.06 g)을 얻었다.

[2404] 공정 5

[2405] 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(피리딘-3-일)파롤리딘의 제조

[2406] 이전 공정에서 제조한 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(피리딘-3-일)파롤리딘(970 mg)을 메탄올(12 mL)에 용해하고, 10 % 팔라듐 탄소(50 % 함수)(200 mg)를 첨가하여, 수소 분위기하에 2.5 시간 동안 교반하였다. 촉매를 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 크로마토그래피(중성 알루미나)(클로로포름:메탄올=7:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(718 mg)을 얻었다.

[2407] 실시예 2

[2408] 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2409] 공정 1

[2410] (S)-3-아세틸-4-이소프로필-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온의 제조

[2411] 아르곤 분위기하에, (S)-4-이소프로필-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온(1.56 g)을 테트라히드로푸란(22 mL)에 혼탁시키고, 냉장하에 1.6 M의 n-부틸리튬/n-헥산 용액(3.64 mL)을 첨가하였다. 10분 후 염화아세틸(0.47 mL)을 첨가하고, 서서히 실온으로 되돌리면서 밤새 교반하였다. 반응액에 포화 염화암모늄수를 첨가한 후, 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하고, 아세트산에틸층을 1 N 염산, 물, 포화 탄산수소나트륨수, 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마

토그래피(n-헥산:아세트산에틸=4:1)로 정제하여, 백색 결정의 표기 화합물(1.69 g)을 얻었다.

[2412] 공정 2

(S)-4-이소프로필-3-[(S)-4-나트로-3-(2-트리플루오로메틸페닐)부티릴]-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온의 제조

이전 공정에서 제조한 (S)-3-아세틸-4-이소프로필-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온(4.74 g)을 아르곤 분위기하에, 디클로로메탄(73 mL)에 용해하고, -78 °C에서 사염화티탄(3.17 mL), N,N-디이소프로필에틸아민(3.06 mL)을 첨가하였다. 30분에 걸쳐서 서서히 0 °C로 승온시킨 후, 재차 -78 °C로 하여 1-[(E)-2-나트로비닐]-2-트리플루오로메틸벤젠(3.50 g)의 디클로로메탄 용액(27 mL)을 첨가하였다. 사염화티탄(3.17 mL)을 첨가하고, 2 시간 후 반응액에 포화 염화암모늄수를 첨가하였다. 아세트산에틸로 추출하고, 아세트산에틸층을 1 N 염산, 물, 포화 탄산수소나트륨수, 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물을 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(n-헥산:아세트산에틸=5:1)로 정제하여, 디에틸에테르:n-펜тан으로 결정화시킴으로써 백색 결정의 표기 화합물(2.62 g)을 얻었다.

[2415] 공정 3

(S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온의 제조

이전 공정에서 제조한 (S)-4-이소프로필-3-[(S)-4-나트로-3-(2-트리플루오로메틸페닐)부티릴]-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온(2.51 g)에 에탄올(35 mL), 아세트산에틸(35 mL)을 첨가하고, 레이니(Raney) 니켈(50 % 함수)(2.8 g)을 첨가하였다. 수소 분위기하에 밤새 교반한 후, 셀라이트로 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 백색 결정의 표기 화합물(850 mg)을 얻었다.

[2418] 공정 4

(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조

이전 공정에서 제조한 (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-2-온(803 mg)에 테트라히드로푸란(7 mL)을 첨가하고, 수소화리튬알루미늄(200 mg)을 첨가하였다. 1.5 시간 동안 가열 환류시킨 후, 냉각하에 물(0.2 mL), 4 N 수산화나트륨 수용액(0.2 mL), 물(0.4 mL)을 첨가하였다. 황산마그네슘 무수물을 첨가하고, 셀라이트로 불용물을 여과 분별하며, 여과액을 감압 농축하여 담황색 유상의 표기 화합물(722 mg)을 얻었다.

[2421] $[\alpha]^{25}_D = +23.9$ ($c=0.504$, EtOH)

[2422] 공정 5

1-[1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

실시예 1의 공정 3에서 제조한 1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르복실산(235 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(127 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(159 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(6 mL)에 용해하고, 15분간 교반하였다. 얻어진 용액에 이전 공정에서 제조한 (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘(151 mg), 4-디메틸아미노피리딘(78 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 1 N 황산수소칼륨수, 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산나트륨 무수물을 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=40:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(287 mg)을 얻었다.

[2425] 공정 6

1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

이전 공정에서 제조한 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘(2.0 g)을 메탄올(14 mL)에 용해하고, 수산화팔라듐 탄소(0.2 g)를 첨가하여, 수소 분위기하에 15 시간 동안 교반하였다. 셀라이트로 촉매를 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 잔사를 메탄올(6.4 mL)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(1.32 mL)을 첨가하였다. 감압 농축하

고, 아세트산에틸+디이소프로필에테르로 결정화시킴으로써 백색 결정의 표기 화합물(1.45 g)을 얻었다.

[2428] 공정 7

[2429] 상기 공정 4에서 제조한 (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘 또는 그의 염산염은, 이하의 공정에 따라 제조할 수도 있다.

[2430] 공정 7-1

[2431] 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸의 제조

[2432] 1-((E)-2-니트로비닐)-2-트리플루오로메틸벤젠(4.34 g)에 툴루엔(40 mL)을 첨가하고, 냉장하에 말론산디메틸(3.4 mL)과, 문헌 [WO2005/000803 및 J. Am. Chem. Soc., 2005, 127, 119-125]에 기재된 1-(3,5-비스트리플루오로메틸페닐)-3-((1S,2S)-2-디메틸아미노시클로헥실)-티오우레아(413 mg)를 첨가하고, 냉장하에서 24 시간 동안 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 2-프로판올을 첨가하여 결정화시킴으로써 백색 결정의 표제 화합물(5.31 g)을 얻었다.

[2433] 또한, 이 반응은 1-(3,5-비스트리플루오로메틸페닐)-3-((1S,2S)-2-디메틸아미노시클로헥실)-티오우레아 대신에, 문헌 [J. Am. Chem. Soc., 1999, 121, 10215-10216, J. Am. Chem. Soc., 2005, 127, 9958-9959, J. Am. Chem. Soc., 2006, 128, 1454-1455] 등에 기재된 촉매를 사용하여 행하는 것도 가능하다.

[2434] 공정 7-2

[2435] (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-3-카르복실산메틸의 제조

[2436] 레이니 니켈(2.0 g)의 테트라히드로푸란(10 mL)/메탄올(10 mL) 혼탁액에 이전 공정에서 제조한 2-[(S)-2-니트로-1-(2-트리플루오로메틸페닐)에틸]말론산디메틸(4.0 g)을 첨가하고, 3.5기압의 수소 분위기하에 실온에서 24 시간 동안 교반하였다. 셀라이트를 통해 불용물을 여과 분별하고, 여과액과 세정액을 합하여 감압 농축한 후, 잔사에 툴루엔을 첨가하고, 10 % 탄산칼륨 수용액 및 물로 세정하여, 유기층을 감압 농축하였다. 잔사를 툴루엔+n-헥산으로 결정화하여, 백색 결정의 표제 화합물(2.38 g)을 얻었다.

[2437] 또한, 이 반응은 레이니 니켈 대신에 팔라듐 탄소를 사용하고, 아세트산, 토실산, 메실산 등의 산을 첨가하여 행하는 것도 가능하다.

[2438] 공정 7-3

[2439] (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-2-온의 제조

[2440] 이전 공정에서 제조한 (S)-2-옥소-4-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-3-카르복실산메틸(1.0 g)에 메탄올(3.8 mL)을 첨가하고, 1N-수산화나트륨 수용액(3.8 mL)을 첨가하여 65 °C에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 냉장하에 1 N-염산을 첨가하여 산성으로 한 후, 아세트산부틸로 2회 추출하였다. 유기층을 합하여 포화 식염수로 세정하고, 황산마그네슘 무수물로 건조한 후, 감압 농축하였다. 잔사에 새롭게 아세트산부틸(10 mL)을 첨가하고, 100 °C에서 밤새 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 잔사에 n-헥산을 첨가하여 결정화하여, 백색 결정의 표제 화합물(667 mg)을 얻었다.

[2441] 공정 7-4

[2442] (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘 염산염의 제조

[2443] 이전 공정에서 제조한 (S)-4-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-2-온(22.9 g)의 THF(100 mL) 용액에 아르곤 기류하에, 85 °C에서 1 M 수소화알루미늄리튬 THF 용액(100 mL)을 1 시간에 걸쳐서 적하하고, 동일한 온도에서 1 시간 동안 교반하였다. 방냉한 후, 냉장하에 50 % 로셀염 수용액을 첨가하여 교반하고, 물 및 아세트산에틸을 첨가하여 분액하며, 유기층을 분취한 후 감압 농축하였다. 잔사에 아세트산에틸 및 물을 첨가하여 분액하고, 유기층을 황산마그네슘 무수물로 건조한 후, 감압 농축하였다. 잔사에 아세트산에틸 60 mL를 첨가하고, 냉장하에 4 N-염산아세트산에틸 용액(37.5 mL)을 첨가하여 실온에서 교반하며, 석출된 결정을 여과 취출하여 백색 결정의 표제 화합물(20.6 g)을 얻었다.

[2444] $[\alpha]^{25}_D = +10.3 (c=0.55, \text{MeOH})$

[2445] 실시예 3

- [2446] 1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [2447] 실시예 1의 공정 5에서 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘(100 mg)을 클로로포름(2 mL)에 용해하고, 트리에틸아민(38 μ L), 2-플루오로페닐이소시아네이트(34 μ L)를 첨가하여, 실온에서 3 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=11:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(111 mg)을 얻었다.
- [2448] 실시예 4
- [2449] 1-[1-(1-카르바모일페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2450] 실시예 1의 공정 5와 동일한 방법으로 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(1.0 g)을 아세트산(3 mL), 물(6 mL)에 용해하고, 실온에서 시안산나트륨(300 mg)의 수용액(6 mL)을 적하하였다. 6 시간 동안 실온에서 교반하고, 이때 시안산나트륨을 합계 750 mg 추가하였다. 아세트산에틸로 추출하고, 아세트산에틸층을 1 N 염산, 물, 포화 탄산수소나트륨수, 물, 포화 식염수로 세정하며, 황산마그네슘 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하며, 디에틸에테르(10 mL)를 첨가하여 실온에서 2 시간 동안 교반하였다. 석출된 고체를 여과 취출하고, 건조하여 백색 결정의 표기 화합물(581 mg)을 얻었다.
- [2451] 실시예 5
- [2452] 1-{1-[1-(2-카르복시페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2453] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(703 mg)을 클로로포름(7 mL)에 혼탁하고, 트리에틸아민(0.23 mL)을 첨가하였다. 빙냉하에 2-메톡시카르보닐페닐이소시아네이트(292 mg)를 첨가하고, 실온에서 2 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=30:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메톡시카르보닐페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(992 mg)을 얻었다.
- [2454] 얻어진 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메톡시카르보닐페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(244 mg)을 테트라히드로푸란(0.4 mL), 메탄올(0.2 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(0.4 mL)을 첨가하여, 60 °C에서 4 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 빙냉하에 2 N 염산으로 산성으로 하고, 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 황산나트륨 무수물로 건조하고, 감압 농축하였다. 잔사에 n-헥산을 첨가하고, 정석하였다. n-헥산으로 세정한 후, 감압 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(181 mg)을 얻었다.
- [2455] 실시예 6
- [2456] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시메틸페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2457] 실시예 5에서 얻어진 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메톡시카르보닐페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(213 mg)을 테트라히드로푸란(2 mL), 에탄올(2 mL)에 용해하고, 빙냉하에 염화리튬(30 mg), 수소화붕소나트륨(26 mg)을 첨가하여 실온에서 밤새 교반하였다. 석출된 불용물을 여과 분별하고, 클로로포름으로 세정하였다. 여과액과 세정액을 합하여 물, 포화 염화나트륨 수용액으로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=30:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(109 mg)을 얻었다.
- [2458] 실시예 7
- [2459] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2460] 실시예 5와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(1.07 g)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(530 mg)을 얻었

다.

[2461] 실시예 8

1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 5와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(206 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(202 mg)을 얻었다.

[2464] 실시예 9

1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시-1,1-디메틸에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 5와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(350 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(341 mg)을 얻었다.

[2467] 실시예 10

1-{1-[1-(2-아세틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2469] 공정 1

1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(5.04 g)에 클로로포름(50 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 N,N-디이소프로필에틸아민(4.68 mL), 클로로포름산 4-니트로페닐(2.39 g)을 첨가하여, 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 1 N 염산으로 산성으로 한 후, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 박황색 부정형의 표기 화합물(5.41 g)을 얻었다.

[2472] 공정 2

1-{1-[1-(2-아세틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

이전 공정에서 제조한 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg)을 N-메틸페롤리돈(1 mL)에 용해하고, N-(2-아미노에틸)-아세트아미드(96 μL)를 첨가하였다. 80 °C에서 밤새 교반하였다. 빙냉한 후 10 % 탄산칼륨 수용액을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 1 N 염산, 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 백색 부정형의 표기 화합물(65 mg)을 얻었다.

[2475] 실시예 11

1-{1-[1-(2-아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조

실시예 10의 공정 1에서 제조한 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg), (2-아미노에틸)카르바미드산 t-부틸(160 mg)을 아세토니트릴(1 mL)에 용해하고, 밤새 가열 환류하였다. 클로로포름으로 회석하고, 물, 포화 탄산수소칼륨수, 물, 포화 식염수로 세정하여, 황산마그네슘 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하였다. 얻어진 부정형 고체를 아세트산에틸(1 mL)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(4 mL)을 첨가하였다. 석출된 고체를 여과 취출하고, 건조하여 백색 부정형 고체의

표기 화합물(111mg)을 얻었다.

[2478] 실시예 12

1-[5-시클로프로필-1-[1-(1,1-디옥소티오모르폴린-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 10의 공정 1에서 제조한 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(250 mg), 티오모르폴린(0.13 ml)을 N-메틸페롤리돈(1 ml)에 용해하고, 100 °C에서 밤새 교반하였다. 방냉한 후, 디에틸에테르로 회색하고, 물, 5 % 탄산칼륨수, 포화 식염수로 세정하여, 황산나트륨 무수물로 건조하였다. 김압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=30:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 1-[5-시클로프로필-1-[1-(티오모르폴린-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(224 mg)을 얻었다. 이것을 클로로포름(4 ml)에 용해하고, 빙냉하에 ml-클로로파벤조산(319 mg)을 첨가하였다. 서서히 실온으로 되돌리면서 3 시간 동안 교반하였다. 포화 티오황산나트륨수, 포화 탄산수소나트륨수를 첨가한 후, 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름총을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하였다. 김압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=30:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(198 mg)을 얻었다.

[2481] 실시예 13

1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조

실시예 10과 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(130 mg)을 얻었다.

[2484] 실시예 14

1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 10과 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(176 mg)을 얻었다.

[2487] 실시예 15

1-[1-[1-(아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 10과 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(150 mg)을 얻었다.

[2490] 실시예 16

1-[5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

실시예 10과 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(175 mg)을 얻었다.

[2493] 실시예 17

1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에틸카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조

실시예 10과 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-니트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-

카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(170 mg)을 얻었다.

[2496] 실시예 18

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4,4-디플루오로페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2498] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(132 mg)을 얻었다.

[2499] 실시예 19

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3-디플루오로피롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2501] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(152 mg)을 얻었다.

[2502] 실시예 20

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2504] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(158 mg)을 얻었다.

[2505] 실시예 21

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시피롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2507] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(171 mg)을 얻었다.

[2508] 실시예 22

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-3-히드록시피롤리딘-1-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2510] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(172 mg)을 얻었다.

[2511] 실시예 23

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-메틸에틸카르바모일]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2513] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(60 mg)을 얻었다.

[2514] 실시예 24

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2516] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-

4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(150 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(94 mg)을 얻었다.

[2517] 실시예 25

1-{1-[1-(4-카르복시페리딘-1-카르보닐)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조

[2519] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(172 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(65 mg)을 얻었다.

[2520] 실시예 26

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소페라진-1-카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조

[2522] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(143 mg)을 얻었다.

[2523] 실시예 27

1-{5-시클로프로필-1-[1-[(S)-2-히드록시메틸피롤리딘-1-카르보닐]페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조

[2525] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(150 mg)을 얻었다.

[2526] 실시예 28

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시메틸아제티딘-1-카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조

[2528] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(178 mg)을 얻었다.

[2529] 실시예 29

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메틸페라진-1-카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘 염산염의 제조

[2531] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(150 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(66 mg)을 얻었다.

[2532] 실시예 30

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-이소프로필페라진-1-카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘 염산염의 제조

[2534] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(150 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(50 mg)을 얻었다.

[2535] 실시예 31

1-{1-[1-(4-아세틸페라진-1-카르보닐)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조

[2537] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-

4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(150 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(56 mg)을 얻었다.

[2538] 실시예 32

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(R)-3-히드록시피페리딘-1-카르보닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2540] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(170 mg)을 얻었다.

[2541] 실시예 33

1-{1-[1-(4-카르바모일피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2543] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(150 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(108 mg)을 얻었다.

[2544] 실시예 34

1-{1-[1-(3-카르바모일아제티딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2546] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(171 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(93 mg)을 얻었다.

[2547] 실시예 35

1-{1-[1-(4-아미노피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2549] 실시예 11과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(302 mg)을 얻었다.

[2550] 실시예 36

1-{1-[1-(3-아미노피롤리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2552] 실시예 11과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(635 mg)을 얻었다.

[2553] 실시예 37

1-{5-시클로프로필-1-[1-(피페리딘-4-일-카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2555] 실시예 11과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(59 mg)을 얻었다.

[2556] 실시예 38

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-디메틸아미노피페리딘-1-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2558] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-

4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(74 mg)을 얻었다.

[2559] 실시예 39

1-{1-[1-(4-아세틸아미노페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2561] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(100 mg)을 얻었다.

[2562] 실시예 40

1-{1-[1-(3-아세틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2564] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(127 mg)을 얻었다.

[2565] 실시예 41

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-디메틸아미노페롤리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2567] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(478 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(141 mg)을 얻었다.

[2568] 실시예 42

1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2570] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(181 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(116 mg)을 얻었다.

[2571] 실시예 43

1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-일-카르바모일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2573] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(181 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(41 mg)을 얻었다.

[2574] 실시예 44

1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-옥소페페리딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2576] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(5.40 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(155 mg)을 얻었다.

[2577] 실시예 45

1-{1-[1-(3-아세틸아미노아제티딘-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2579] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-

4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘(90 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(6.8 mg)을 얻었다.

[2580] 실시예 46

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-옥소파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2582] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(155 mg)을 얻었다.

[2583] 실시예 47

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2585] 공정 1

(2,2,2-트리플루오로에틸)카르바미드산 4-나트로페닐의 제조

[2587] 2,2,2-트리플루오로에틸아민(392 mg)을 클로로포름(4 mL)에 용해하고, 빙냉하에 파리딘(0.35 mL), 클로로포름산 4-나트로페닐(2.39 g)을 첨가하여, 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸층을 1 N 염산, 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디이소프로필에테르를 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(501 mg)을 얻었다.

[2588] 공정 2

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에틸카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2590] 이전 공정에서 제조한 (2,2,2-트리플루오로에틸)카르바미드산 4-나트로페닐(113 mg), 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(200 mg)을 파리딘(1 mL)에 용해하고, 80 °C에서 2 시간 동안 교반하였다. 방냉한 후 톤투엔을 첨가하여 감압 농축하고, 10 % 탄산칼륨수를 첨가하여 아세트산에틸층을 추출하였다. 아세트산에틸층을 10 % 탄산칼륨 수용액, 물, 1 N 염산, 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 박황색 부정형의 표기 화합물(162 mg)을 얻었다.

[2591] 실시예 48

1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,4,4-테트라플루오로파롤리딘-1-카르보닐)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2593] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(468 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(138 mg)을 얻었다.

[2594] 실시예 49

1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-2-메틸프로필카르바모일]파페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2596] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(250 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(166 mg)을 얻었다.

[2597] 실시예 50

1-(1-{1-[(S)-1-벤질-2-히드록시에틸카르바모일]파페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

- [2599] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(140 mg)을 얻었다.
- [2600] 실시예 51
- [2601] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-2-히드록시-1-페닐에틸카르바모일]피페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2602] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(170 mg)을 얻었다.
- [2603] 실시예 52
- [2604] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-히드록시메틸-3-메틸부틸카르바모일]피페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2605] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(250 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(256 mg)을 얻었다.
- [2606] 실시예 53
- [2607] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2608] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(125 mg)을 얻었다.
- [2609] 실시예 54
- [2610] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로펜틸카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2611] 실시예 47과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(92 mg)을 얻었다.
- [2612] 실시예 55
- [2613] 1-[1-(1-벤젠솔포닐아미노카르보닐피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2614] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(25.0 mg)에 클로로포름(3 ml)을 첨가하고, 트리에틸아민(81 μ l), 톨루엔솔포닐이소시아네이트(78 μ l)를 첨가하여 2 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하였다. 얻어진 고체를 아세트산에틸로 재결정하여, 담황색 고체의 표기 화합물(40 mg)을 얻었다.
- [2615] 실시예 56
- [2616] 1-[5-시클로프로필-1-(1-메탄솔포닐아미노카르보닐피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조
- [2617] 실시예 55와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염(500 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(200 mg)을 얻었다.

- [2618] 실시예 57
- [2619] 1-[5-시클로프로필-1-(1-페톡시카르보닐페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2620] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)을 클로로포름(2.0 mL)에 혼탁하고, 빙냉하에 탄산칼륨(177 mg)을 첨가하였다. 클로로포름 산메틸(49.4 μ L)을 첨가하고, 실온으로 되돌려 1.5 시간 동안 교반하였다. 추가로 클로로포름산메틸(49.4. μ L)을 첨가하고, 실온에서 15.5 시간 동안 교반하였다. 반응액에 포화 탄산수소나트륨수를 첨가하고, 아세트산 에틸로 3회 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=30:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(210 mg)을 얻었다.
- [2621] 실시예 58
- [2622] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2623] 실시예 57과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(214 mg)을 얻었다.
- [2624] 실시예 59
- [2625] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2626] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(166 mg)을 얻었다.
- [2627] 실시예 60
- [2628] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페페리딘-1-일-에톡시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2629] 실시예 10과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(300 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(219 mg)을 얻었다.
- [2630] 실시예 61
- [2631] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2632] 실시예 11과 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(102 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(53 mg)을 얻었다.
- [2633] 실시예 62
- [2634] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2635] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(124 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(64 mg)을 얻었다.
- [2636] 실시예 63
- [2637] 1-{1-[1-(1-아세틸페페리딘-4-일-옥시카르보닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-

(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

- [2638] 실시예 12와 동일한 방법으로, 1-[5-시클로프로필-1-[1-(4-나트로페녹시카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(122 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(65 mg)을 얻었다.
- [2639] 실시예 64
- [2640] 1-[1-(1-시클로프로판카르보닐페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2641] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)에 클로로포름(5 mL), 트리에틸아민(0.13 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 시클로프로판카르복실산클로라이드(0.047 mL)를 첨가하였다. 실온에서 밤새 교반한 후, 감압하에 용매를 제거하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=10:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(170 mg)을 얻었다.
- [2642] 실시예 65
- [2643] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-히드록시아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2644] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(250 mg)에 클로로포름(5 mL), 트리에틸아민(0.16 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 염화아세톡시아세틸(0.069 mL)을 첨가하였다. 실온에서 밤새 교반한 후, 감압하에 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정하여, 황산나트륨 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=10:1)로 정제하였다. 얻어진 부정형 고체를 테트라히드로푸란(2 mL), 메탄올(2 mL), 물(4 mL)에 용해하고, 수산화리튬 1수화물(103 mg)을 첨가하였다. 60 °C에서 4 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 5 % 황산수소칼륨수를 첨가하여, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(아세트산에틸:메탄올=20:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(30 mg)을 얻었다.
- [2645] 실시예 66
- [2646] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-(4-플루오로페닐)시클로프로판카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2647] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(193 mg)을 얻었다.
- [2648] 실시예 67
- [2649] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-디메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2650] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(217 mg)을 얻었다.
- [2651] 실시예 68
- [2652] 1-{1-[1-(2-아세틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2653] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(119 mg)을 얻었다.

- [2654] 실시예 69
- [2655] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2656] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(178 mg)을 얻었다.
- [2657] 실시예 70
- [2658] 1-{1-[1-(2-아세틸아미노-2-메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2659] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(94 mg)을 얻었다.
- [2660] 실시예 71
- [2661] 1-(1-{1-(S)-2-아세틸아미노프로파오닐}페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2662] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(183 mg)을 얻었다.
- [2663] 실시예 72
- [2664] 1-(1-{1-(S)-2-아세틸아미노-3-메틸부티릴}페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2665] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(212 mg)을 얻었다.
- [2666] 실시예 73
- [2667] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3,3,3-트리플루오로프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2668] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(150 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(151 mg)을 얻었다.
- [2669] 실시예 74
- [2670] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-5-옥소페롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2671] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(127 mg)을 얻었다.
- [2672] 실시예 75
- [2673] 1-{1-[1-(3-아세틸아미노프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2674] 실시예 64와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(355 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(263 mg)을 얻었다.

- [2675] 실시예 76
- [2676] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-히드록시-2,2-디메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2677] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(250 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(238 mg)을 얻었다.
- [2678] 실시예 77
- [2679] 1-{1-[1-(2-아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2680] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(219 mg)을 얻었다.
- [2681] 실시예 78
- [2682] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-히드록시메틸시클로프로판카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘
- [2683] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(250 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(168 mg)을 얻었다.
- [2684] 실시예 79
- [2685] 1-{1-[1-(2-아미노-2-메틸프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2686] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(154 mg)을 얻었다.
- [2687] 실시예 80
- [2688] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시부티릴)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2689] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(166 mg)을 얻었다.
- [2690] 실시예 81
- [2691] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-페롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2692] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(450 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(569 mg)을 얻었다.
- [2693] 실시예 82
- [2694] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-메틸페롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2695] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(450 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(192 mg)을 얻었다.
- [2696] 실시예 83

- [2697] 1-[1-(3-아미노프로파오닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2698] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(355 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(414 mg)을 얻었다.
- [2699] 실시예 84
- [2700] 1-(1-{1-[(S)-2-아미노-3-메틸부티릴]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2701] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(150 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(182 mg)을 얻었다.
- [2702] 실시예 85
- [2703] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-메틸아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2704] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(150 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(183 mg)을 얻었다.
- [2705] 실시예 86
- [2706] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(페페리딘-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조
- [2707] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(404 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(478 mg)을 얻었다.
- [2708] 실시예 87
- [2709] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-이소부티릴아미노아세틸)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2710] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(214 mg)을 얻었다.
- [2711] 실시예 88
- [2712] 1-{1-[1-(2-시클로프로판카르보닐아미노아세틸)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2713] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(190 mg)을 얻었다.
- [2714] 실시예 89
- [2715] 1-(1-{1-[(S)-1-아세틸페롤리딘-2-카르보닐]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2716] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(450 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(189 mg)을 얻었다.
- [2717] 실시예 90

- [2718] 1-[5-시클로프로필-1-[1-(2-메탄술포닐아미노아세틸)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2719] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(152 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(134 mg)을 얻었다.
- [2720] 실시예 91
- [2721] 1-{1-[1-(1-아세틸피페리딘-4-카르보닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2722] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(404 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(145 mg)을 얻었다.
- [2723] 실시예 92
- [2724] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸피페리딘-4-카르보닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2725] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(404 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(151 mg)을 얻었다.
- [2726] 실시예 93
- [2727] 1-{1-[1-(3-카르바모일프로피오닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조
- [2728] 실시예 65와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(61 mg)을 얻었다.
- [2729] 실시예 94
- [2730] 1-[1-(1-카르바모일메틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2731] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(2.5 mL)에 용해하고, 탄산칼륨(9.3 mg), 2-브로모아세트아미드(50.7 mg)를 첨가하여 실온에서 2 시간 동안 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 3회 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 1-[1-(1-카르바모일메틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(167 mg)을 얻었다.
- [2732] 이전 공정에서 얻어진 1-[1-(1-카르바모일메틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(154 mg)에 아세트산에틸(2 mL)을 첨가하여 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸용액(159 μL)을 첨가하여, 10분간 교반하였다. 석출된 결정을 여과 취출하고, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(109 mg)을 얻었다.
- [2733] 실시예 95
- [2734] 1-[5-시클로프로필-1-(1-메틸카르바모일메틸피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2735] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(2.5 g)을 N,N-디메틸포름아미드(20 mL)에 용해하고, 탄산칼륨(1.62 g), 브로모아세트산에틸(0.98 g)을 첨가하여 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 2회 추출하였다.

유기충을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=25:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 1-[5-시클로프로필-1-[1-(에톡시카르보닐메틸)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(2.79 g)을 얻었다.

[2736] 이전 공정에서 얻어진 1-[5-시클로프로필-1-[1-(에톡시카르보닐메틸)페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(1.4 g)에 테트라하이드로푸란(5.5 mL), 메탄올(2.7 mL)을 첨가하여 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(1.4 mL)을 첨가하여 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 수증을 디에틸에테르로 2회 세정한 후, 냉장화에 2 N 염산으로 pH를 5 내지 6으로 하고, 클로로포름으로 3회 추출하였다. 클로로포름층을 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 n-헥산을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하고, 건조하여 백색 고체의 1-[1-(1-카르복시메틸페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(1.17 g)을 얻었다.

[2737] 이전 공정에서 얻어진 1-[1-(1-카르복시메틸페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(150 mg)에 N,N-디메틸포름아미드(3.0 mL)를 첨가하고, 1-히드록시벤조트리아졸(61 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(76 mg)을 첨가하여 실온에서 1시간 동안 교반한 후, 40 % 메틸아민 수용액(106 μ L)을 첨가하여 5시간 동안 교반하고, 추가로 40 % 메틸아민 수용액(318 μ L)을 첨가하여 실온에서 13시간 동안 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 클로로포름으로 추출하였다. 유기충을 포화 탄산수소나트륨수, 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하였다. 얻어진 부정형 고체를 아세트산에틸(2.0 mL)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(100 μ L)을 첨가하여 10분간 교반하였다. 석출된 결정을 여과 취출하고, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(16.9 mg)을 얻었다.

[2738] 실시예 96

[2739] 1-[1-[1-(1-카르바모일-1-메틸에틸)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염의 제조

[2740] 쿠밀아민(1.1 g), 트리에틸아민(1.2 mL)을 클로로포름(10 mL)에 용해하고, 냉장화에 2-브로모이소부티릴브로마이드(1.0 mL)의 클로로포름(2 mL) 용액을 5분에 걸쳐서 첨가하여, 실온에서 15분간 교반였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 아세트산에틸을 첨가하여 물 및 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 백색 고체를 디이소프로필에테르로 세정하고, 건조하여 백색 고체의 2-브로모-2-메틸-N-(1-메틸-1-페닐에틸)-프로필아미드(1.73 g)를 얻었다.

[2741] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염을 테트라하이드로푸란(5.5 mL)에 용해하고, 60 % 수소화나트륨(104 mg)을 첨가하여 60 °C에서 1시간 동안 교반한 후, 실온에서 5분간 교반하였다. 이전 공정에서 제조한 2-브로모-2-메틸-N-(1-메틸-1-페닐에틸)-프로필아미드(329 mg)를 첨가하고, 60 °C에서 22시간 동안 교반하였다. 냉장한 후 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 담황색 부정형의 1-[5-시클로프로필-1-{1-[1-메틸-1-(1-메틸-1-페닐에틸카르바모일)에틸]페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(78 mg)을 얻었다.

[2742] 이전 공정에서 제조한 1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-메틸-1-(1-메틸-1-페닐에틸카르바모일)에틸]페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘을 트리플루오로아세트산(2 mL)에 용해하고, 80 °C에서 8시간 동안 교반하였다. 트리플루오로아세트산(1 mL)을 추가하고, 80 °C에서 추가로 8시간 동안 교반하였다. 냉장한 후, 감압 농축하여 얻어진 잔사를 아세트산에틸에 용해하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:아세톤=4:5→클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하였다. 얻어진 잔사를 아세트산에틸(1 mL)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(1 mL), 디에틸에테르(1.5 mL)를 첨가하였다. 얻어진 고체를 여과 취출하고, 건조하여 담황색 고체의 표기 화합물(36 mg)을 얻었다.

[2743] 실시예 97

[2744] 1-[1-[1-(2-카르바모일에틸)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메

틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

- [2745] 실시예 94와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(149 mg)을 얻었다.
- [2746] 실시예 98
- [2747] 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필메틸피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2748] 실시예 94와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(150 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(133 mg)을 얻었다.
- [2749] 실시예 99
- [2750] 1-[5-시클로프로필-1-(1-시클로프로필피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2751] 실시예 94와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 담황갈색 부정형 고체의 표기 화합물(144 mg)을 얻었다.
- [2752] 실시예 100
- [2753] 1-[5-시클로프로필-1-(1-디메틸카르바모일메틸피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2754] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(2.5 g)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(20 mg)을 얻었다.
- [2755] 실시예 101
- [2756] 1-[1-(1-카르복시메틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2757] 실시예 95에서 제조한 1-[1-(1-카르복시메틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(112 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(24 mg)을 얻었다.
- [2758] 실시예 102
- [2759] 1-[1-(1-카르복시에틸피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2760] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(350 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(295 mg)을 얻었다.
- [2761] 실시예 103
- [2762] 1-{1-[1-(1-카르바모일에틸)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2763] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(350 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(146 mg)을 얻었다.
- [2764] 실시예 104
- [2765] 1-{1-[1-(2-카르복시-2-메틸프로필)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조
- [2766] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-

3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘 염산염(400 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(71 mg)을 얻었다.

[2767] 실시예 105

1-{1-[1-(2-카르바모일-2-메틸프로필)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2769] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(400 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(52 mg)을 얻었다.

[2770] 실시예 106

1-{1-[1-(1-카르바모일시클로프로필메틸)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2772] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(400 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(82 mg)을 얻었다.

[2773] 실시예 107

1-(5-시클로프로필-1-{1-[1-(2-히드록시에틸카르바모일)시클로프로필메틸]페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염의 제조

[2775] 실시예 95와 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(400 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(84 mg)을 얻었다.

[2776] 실시예 108

1-[5-시클로프로필-1-(1-트리플루오로메탄술포닐페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2778] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)을 염화메틸렌(2.0 mL)에 용해하고, 아르곤 분위기하에 -78 °C로 냉각하며, 트리에틸아민(178 μL), 트리플루오로메탄술포산 무수물(78.8 μL)을 첨가하여 2.5 시간 동안 교반하였다. 추가로 트리플루오로메탄술포산 무수물(78.8 μL)을 첨가하고, 2 시간 동안 교반하였다. -78 °C에서 포화 탄산수소나트륨수를 반응액에 첨가하고, 클로로포름으로 추출하였다. 유기층을 1 N 염산, 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 황색 부정형의 표기 화합물(192 mg)을 얻었다.

[2779] 실시예 109

1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,2,2-트리플루오로에탄술포닐)페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2781] 실시예 108과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(200 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(29 mg)을 얻었다.

[2782] 실시예 110

1-{1-[1-(1-시아노이미노에틸)페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2784] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘 염산염(300 mg)을 클로로포름(5 mL)에 용해하고, 트리에틸아민(97 μL), 메틸 N-시아노아세토이미데이트(66 μL)를 첨가하였다. 실온에서 30분, 45 °C에서 1.5 시간 동안 교반한 후, 트리에틸아민(97 μL), 메틸 N-시아노아세토이미데이트(66 μL)를 추가하여, 45 °C에서 2 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를

실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 담황색 부정형의 표기 화합물(214 mg)을 얻었다.

[2785] 실시예 111

1-(1-{1-[시아노이미노(메틸아미노)메틸]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2787] 공정 1

1-(1-{1-[시아노이미노(페녹시)-메틸]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2789] 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(500 mg)에 클로로포름(5 mL)을 첨가하고, 트리에틸아민(0.162 mL), 디페닐 N-시아노카르본이미데이트(284 mg)를 첨가하여 1.5 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:아세톤=1:1→2:3→1:2)로 정제하여, 담황색 부정형의 표기 화합물(575 mg)을 얻었다.

[2790] 공정 2

1-(1-{1-[시아노이미노(메틸아미노)메틸]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2792] 이전 공정에서 제조한 1-(1-{1-[시아노이미노(페녹시)-메틸]페페리딘-4-일}-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐)-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘(575 mg)을 클로로포름(10 mL)에 용해하고, 메틸아민염산염(81 mg), 트리에틸아민(0.31 mL)을 첨가하여, 실온에서 30분, 55 °C에서 5 시간 동안 교반하였다. 메틸아민염산염(81 mg), 트리에틸아민(2 mL)을 추가하고, 55 °C에서 1 시간, 60 °C에서 30분간 동안 교반하였다. 메틸아민염산염(162 mg)을 추가하고, 60 °C에서 2.5 시간 동안 교반하였다. 방냉한 후 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 클로로포름에 용해하여 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(242 mg)을 얻었다.

[2793] 실시예 112

1-{1-[1-(N-시아노카르바미드일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2795] 실시예 111과 동일한 방법으로, 실시예 2의 1-[5-시클로프로필-1-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘 염산염(302 mg)으로부터 담황색 부정형 고체의 표기 화합물(249 mg)을 얻었다.

[2796] 실시예 113

4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]페라졸-1-일}페페리딘-1-일)벤조산의 제조

[2798] 공정 1

1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르복실산 tert-부틸의 제조

[2800] 실시예 1의 공정 1과 동일한 방법으로 제조한 2-시클로프로필카르보닐-3-디메틸아미노아크릴산 tert-부틸(1.12 g)과 이미 알려진 방법으로 제조한 4-(4-히드라지노페페리딘-1-일)벤조산에틸 염산염(692 mg)을 에탄올(15 mL)에 혼탁시켰다. 얻어진 혼탁액에 트리에틸아민(0.81 mL)을 첨가하고, 밤새 환류하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(n-헥산:아세트산에틸=3:1)로 정제하여, 황색 유상의 표기 화합물(673 mg)을 얻었다.

[2801] 공정 2

1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르복실산의 제조

[2803] 이전 공정에서 제조한 1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르복실산 tert-부틸(673 mg)을 클로로포름(4 mL)에 용해하고, 빙냉하에 트리플루오로아세트산(4 mL)을 첨가하여 40 °C에

서 2 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디에틸에테르, n-헥산을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하고, 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(556 mg)을 얻었다.

[2804] 공정 3

[2805] 5-시클로프로필-1-{1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-{3-(2-트리플루오로메틸페닐)}피롤리딘의 제조

[2806] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산(550 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(285 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(357 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(8 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(308 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(아세트산에틸)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(757 mg)을 얻었다.

[2807] 공정 4

[2808] 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)벤조산의 제조

[2809] 이전 공정에서 제조한 1-{1-[1-(4-에톡시카르보닐페닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-{3-(2-트리플루오로메틸페닐)}피롤리딘(720 mg)을 테트라히드로푸란(3 mL), 메탄올(1.5 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(1.2 mL)을 첨가하여 실온에서 4 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 수층을 디에틸에테르로 세정한 후, 빙냉하에 2 N 염산으로 산성으로 하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디에틸에테르:n-헥산(1:1)을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(600 mg)을 얻었다.

[2810] 실시예 114

[2811] 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)벤조산의 제조

[2812] 실시예 1과 동일한 방법으로 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(195 mg), 3-요오드벤조산에틸(142 mg)을 1,4-디옥산(1mL), tert-부탄올(1 mL)에 용해하고, 트리스(디벤질리덴아세톤)디팔라듐(14.2 mg), 2-디시클로헥실포스피로-2'-(N,N-디메틸아미노)비페닐(24.3 mg), 탄산세슘(235 mg)을 첨가하여 밤새 가열 환류하였다. 방냉한 후 셀라이트로 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 포화 탄산수소나트륨수를 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(n-헥산:아세톤=1:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)벤조산에틸(179 mg)을 얻었다.

[2813] 이전 공정에서 제조한 3-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)벤조산에틸(179 mg)을 테트라히드로푸란(1 mL), 에탄올(1 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(1 mL)을 첨가하여 2 시간 동안 가열 환류하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하여 빙냉하에 2 N 염산으로 산성으로 하였다. 석출된 고체를 여과 취출하고, 물로 세정한 후 감압 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(165 mg)을 얻었다.

[2814] 실시예 115

[2815] 5-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}피페리딘-1-일)티오펜-2-카르복실산의 제조

[2816] 실시예 1과 동일한 방법으로 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(220 mg), 5-브로모티오펜-2-카르복실산에틸(137 mg)을 톨루엔(4 mL)에 용해하고, 아세

트산팔라듐(13 mg), 2,2'-비스(디페닐포스피노)-1,1'-비나프틸(36 mg), 탄산세슘(265 mg)을 첨가하여 6 시간 동안 가열 환류하였다. 냉각한 후 세리아트로 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 포화 탄산수소나트륨수를 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(n-헥산:아세톤=1:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 5-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)티오펜-2-카르복실산에틸(162 mg)을 얻었다.

[2817] 이전 공정에서 제조한 5-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-일)티오펜-2-카르복실산에틸(162 mg)을 테트라히드로푸란(1 mL), 에탄올(1 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(1 mL)을 첨가하여 3 시간 가열 환류하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하여, 냉각하에 2 N 염산으로 산성으로 하였다. 석출된 고체를 여과 취출하고, 물로 세정한 후 감압 건조하였다. 얻어진 고체를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:아세톤=6:1)로 정제한 후, 아세트산에틸로 재결정하여 담록색 고체의 표기 화합물(28 mg)을 얻었다.

[2818] 실시예 116

[2819] 2-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산의 제조

[2820] 공정 1

[2821] 4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-티오카르복실산아미드의 제조

[2822] 실시예 1과 동일한 방법으로 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘(420 mg)을 클로로포름(10 mL)에 용해하고, 실온에서 트리에틸아민(0.139 mL), 9-플루오레닐메톡시카르보닐이소티오시아네이트(285 mg)를 첨가하여, 1 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=50:1)로 정제하였다. 얻어진 정제물을 N,N-디메틸포름아미드(7 mL)에 용해하고, 실온에서 파페리딘(0.7 mL)을 첨가하여 1 시간 동안 교반하였다. 혼합물을 감압 농축하고, 잔사를 아세트산에틸에 용해하여 물, 포화 식염수로 세정하며, 황산나트륨 무수물로 건조한 후 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디에틸에테르를 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 물로 세정한 후 감압 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(287 mg)을 얻었다.

[2823] 공정 2

[2824] 2-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산의 제조

[2825] 이전 공정에서 제조한 4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-티오카르복실산아미드(280 mg)를 에탄올(5 mL)에 혼탁시키고, 얻어진 혼탁액에 브로모포루브산에틸(0.09 mL)을 첨가하여 2 시간 동안 환류하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 2-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산에틸(361 mg)을 얻었다.

[2826] 이전 공정에서 제조한 2-(4-(5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일)파페리딘-1-일)티아졸-4-카르복실산에틸(355 mg)을 테트라히드로푸란(0.6 mL), 메탄올(0.3 mL)에 용해하고, 실온에서 4 N 수산화나트륨 수용액(0.57 mL)을 첨가하여 3 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 1 N 수산화나트륨 수용액을 첨가하여 디에틸에테르로 세정하였다. 수층을 2 N 염산으로 산성으로 하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 물로 세정한 후 감압 건조하여, 백색 고체의 표기 화합물(272 mg)을 얻었다.

[2827] 실시예 117

[2828] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2829] 공정 1

[2830] 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-이미드티
오카르복실산메틸 요오드화수소산염의 제조

[2831] 실시예 116의 공정 1과 동일한 방법으로 제조한 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-티오카르복실산아미드(500 mg)를 클로로포름(5 ml)에 용해하고, 요오드화메틸(0.1 ml)을 첨가하였다. 실온에서 밤새 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 디에틸에테르를 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 담황색 고체의 표기 화합물(654 mg)을 얻었다.

[2832] 공정 2

[2833] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2834] 이전 공정에서 제조한 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-이미드티오카르복실산메틸 요오드화수소산염(317 mg), 아세트산히드라지드(50 mg), 아세트산나트륨(43 mg)을 디옥산(2 ml), 물(0.4 ml)에 혼탁시키고, 밤새 가열 환류하였다. 감압하에 용매를 제거하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정하고, 황산마그네슘 무수물로 건조하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하였다. 얻어진 부정형 고체를 아세트산에틸(1 ml)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(0.4 ml)을 첨가하였다. 석출된 고체를 여과 취출하고, 건조하여 백색 결정의 표기 화합물(72 mg)을 얻었다.

[2835] 실시예 118

[2836] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-시클로프로필-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2837] 실시예 117과 동일한 방법으로, 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-이미드티오카르복실산메틸 요오드화수소산염(475 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(253 mg)을 얻었다.

[2838] 실시예 119

[2839] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-히드록시메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2840] 실시예 117과 동일한 방법으로, 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-이미드티오카르복실산메틸 요오드화수소산염(317 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(25 mg)을 얻었다.

[2841] 실시예 120

[2842] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(5-트리플루오로메틸-4H-[1,2,4]트리아졸-3-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2843] 실시예 117과 동일한 방법으로, 4-{5-시클로프로필-4-[*(S)*-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-이미드티오카르복실산메틸 요오드화수소산염(317 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(130 mg)을 얻었다.

[2844] 실시예 121

[2845] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

[2846] 공정 1

[2847] 5-시클로프로필-1-(파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르복실산메틸의 제조

[2848] 실시예 1의 공정 2에서 제조한 1-(1-벤질옥시카르보닐파페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르복실산메틸(15.9 g)을 메탄올(12 ml)에 용해하고, 팔라듐 탄소(1.5 g)를 첨가하여 수소 분위기하에 밤새 교반하였다. 축매를 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 n-헥산을 첨가하고, 여과 취출함으로써 백색

부정형 고체의 표기 화합물(9.66 g)을 얻었다.

[2849] 공정 2

[2850] 5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산메틸의 제조

[2851] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산메틸(2.82 g)을 클로로포름(28 mL)에 용해하고, 트리에틸아민(1.58 mL)을 첨가하였다. 얻어진 혼합물을 빙냉하에 2-플루오로페닐이소시아네이트(1.4 mL)를 첨가하고, 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(*n*-헥산:아세트산에틸=2:3)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(4.23 g)을 얻었다.

[2852] 공정 3

[2853] 5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산의 제조

[2854] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산메틸(4.23 g)을 테트라히드로푸란(11 mL), 메탄올(5 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(11 mL)을 첨가하여 60 °C에서 6 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 방냉한 후 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 수증을 디에틸에테르로 세정한 후, 빙냉하에 농염산으로 산성으로 하고, 석출된 고체를 여과 추출하였다. 물, *n*-헥산으로 세정한 후 감압 건조하여, 백색 고체의 표기 화합물(3.89 g)을 얻었다.

[2855] 공정 4

[2856] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-*{(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)}*피롤리딘의 제조

[2857] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산(101 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(46 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(57 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(15 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 (*R*)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(65 mg)*, 4-디메틸아미노피페리딘(37 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(136 mg)을 얻었다.

[2858] [α]²⁵D=+10.9(g=c=0.495, EtOH)

[2859] *(*R*)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘은, (*R*)-4-이소프로필-5,5-디페닐옥사졸리딘-2-온을 사용하여, 실시예 2의 공정 1 내지 공정 4와 동일한 방법으로 제조하였다. [α]²⁵D=-21.0(g=c=0.500, EtOH)

[2860] 실시예 122

[2861] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-*{(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)}*피롤리딘의 제조

[2862] 공정 1

[2863] 5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르복실산메틸의 제조

[2864] 1-메틸시클로프로판-1-카르복실산(1.81 g), 디페닐포스포릴아지드(4.67 mL), 트리에틸아민(2.77 mL)을 톨루엔(30 mL)에 용해하고, 1 시간 동안 가열 환류하여 이소시아네이트를 생성하였다.

[2865] 실시예 121의 공정 1에서 제조한 5-시클로프로필-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산메틸(1.50 g), 트리에틸아민(0.84 mL)을 테트라히드로푸란(15 mL)에 용해하고, 앞서 제조한 이소시아네이트의 톨루엔 용액을 원료(1-(피페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산메틸)이 소실될 때까지 첨가하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 물을 첨가하여 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(1.92 g)을 얻었다.

[2866] 공정 2

- [2867] 5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산의 제조
- [2868] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산메틸(1.92 g)을 테트라히드로푸란(20 mL), 메탄올(10 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(15 mL)을 첨가하여 60 °C에서 6 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 방냉한 후 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 수증을 디에틸에테르로 세정한 후, 빙냉하에 농염산으로 산성으로 하고, 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 아세트산에틸을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(1.68 g)을 얻었다.
- [2869] 공정 3
- [2870] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2871] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산(91 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(46 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(57 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(1.5 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 (R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘(65 mg), 4-디메틸아미노페페리딘(37 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(123 mg)을 얻었다.
- [2872] $[\alpha]^{25}_{\text{D}} = +13.1 (\text{c}=0.495, \text{EtOH})$
- [2873] 실시예 123
- [2874] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2875] 공정 1
- [2876] 5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산메틸의 제조
- [2877] 실시예 121의 공정 1에서 제조한 5-시클로프로필-1-(페페리딘-4-일)-1H-페라졸-4-카르복실산메틸(1.87 g)을 클로로포름(20 mL)에 용해하고, 트리에틸아민(1.05 mL)을 첨가하였다. 얻어진 혼합물에 빙냉하에 이소프로필이소시아네이트(0.7 mL)를 첨가하고, 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(2.00 g)을 얻었다.
- [2878] 공정 2
- [2879] 5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산의 제조
- [2880] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산메틸(2.00 g)을 테트라히드로푸란(6 mL), 메탄올(3 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(6 mL)을 첨가하여, 60 °C에서 4.5 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 방냉한 후 감압 농축하고, 얻어진 잔사를 물에 용해하였다. 수증을 디에틸에테르로 세정한 후, 빙냉하에 농염산으로 산성으로 하고, 클로로포름으로 추출하였다. 클로로포름층을 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 n-헥산을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 고체의 표기 화합물(1.58 g)을 얻었다.
- [2881] 공정 3
- [2882] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조
- [2883] 이전 공정에서 제조한 5-시클로프로필-1-[1-(1-이)소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산(88 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(46 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(57 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(1.5 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 (R)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘(65 mg), 4-디메틸아미노페페리딘(37 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸

로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 젤 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로써 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(120 mg)을 얻었다.

[2884] $[\alpha]^{25}_D = +14.2 (c=0.500, \text{EtOH})$

[2885] 실시예 124

[2886] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2887] 실시예 121의 공정 4와 동일한 방법으로, 5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산(123 mg), (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘(78 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(127 mg)을 얻었다.

[2888] $[\alpha]^{25}_D = -10.8 (c=0.510, \text{EtOH})$

[2889] 실시예 125

[2890] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2891] 실시예 123의 공정 3과 동일한 방법으로, 5-시클로프로필-1-[1-(1-이소프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산(107 mg), (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘(79 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(123 mg)을 얻었다.

[2892] $[\alpha]^{25}_D = -13.2 (c=0.515, \text{EtOH})$

[2893] 실시예 126

[2894] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]페롤리딘의 제조

[2895] 실시예 122의 공정 3과 동일한 방법으로, 5-시클로프로필-1-[1-(1-메틸시클로프로필카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르복실산(107 mg), (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘(76 mg)으로부터 백색 부정형 고체의 표기 화합물(149 mg)을 얻었다.

[2896] $[\alpha]^{25}_D = -13.6 (c=0.500, \text{EtOH})$

[2897] 실시예 127

[2898] (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-헵타드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(페리미딘-2-일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}페롤리딘 염산염의 제조

[2899] 공정 1

[2900] 시아노-(4-플루오로페닐)아세트산에틸의 제조

[2901] 4-플루오로페닐아세토니트릴(15.0 g)에 톤후엔(40 mL)을 첨가하고, 탄산디에틸(66.9 mL), 나트륨에톡시드(8.30 g)를 첨가하여 110 °C 내지 130 °C에서 용매를 증류 제거하면서 2 시간 동안 교반하였다. 냉장한 후 반응액을 수중에 붓고, 아세트산(13 mL)을 첨가하여 5분간 교반하며, 아세트산에틸로 3회 추출을 행하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조한 후, 감압 농축하여 담황색 유상의 표기 화합물(25.0 g)을 얻었다.

[2902] 공정 2

[2903] 2-시아노-2-(4-플루오로페닐)숙신산디에틸의 제조

[2904] 60 % 수소화나트륨(2.12 g)에 테트라히드로푸란(40 mL)을 첨가하고, 냉장하에 이전 공정에서 제조한 시아노-(4-플루오로페닐)아세트산에틸(10.0 g)의 테트라히드로푸란(40 mL) 용액을 적하하고, 40분간 교반하였다. 냉장 하에 브로모아세트산에틸(6.4 mL)을 첨가하고, 실온에서 3 시간 동안 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 잔

사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 3회 추출을 행하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(*n*-헥산:아세트산에틸=5:1)로 정제하여, 담황색 유상의 표기 화합물(14.7 g)을 얻었다.

[2905] 공정 3

3-(4-플루오로페닐)-5-옥소-피롤리딘-3-카르복실산에틸의 제조

[2907] 레이너 니켈(7.0 g)에 이전 공정에서 제조한 2-시아노-2-(4-플루오로페닐) 숙신산디에틸(7.0 g)의 에탄올(50 mL) 용액을 첨가하고, 수소 분위기하에 밤새 교반하였다. 반응액을 셀라이트로 여과하고, 여과액과 세정액을 합하여 감압 농축을 행하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=25:1)로 정제하고, 얻어진 고체 잔사에 디에틸에테르와 *n*-헥산의 혼합 용매를 첨가하고, 여과 취출하고, 건조하여 백색 결정의 표기 화합물(3.96 g)을 얻었다.

[2908] 공정 4

1-벤질-3-(4-플루오로페닐)-5-옥소-피롤리딘-3-카르복실산에틸의 제조

[2910] 60 % 수소화나트륨(1.63 g)에 테트라히드로푸란(25 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 이전 공정에서 제조한 3-(4-플루오로페닐)-5-옥소-피롤리딘-3-카르복실산에틸(10.3 g)의 테트라히드로푸란(30 mL)/N,N-디메틸포름아미드(10 mL) 용액을 적하하고, 10분간 교반하였다. 빙냉하에 벤질브로마이드(4.86 mL)를 첨가하고, 동일한 온도에서 30분간 교반한 후, 실온에서 3.5 시간 동안 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 3회 추출을 행하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(*n*-헥산:아세트산에틸=2:1)로 정제하여, 담황색 유상의 표기 화합물(12.1 g)을 얻었다.

[2911] 공정 5

1-벤질-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘의 제조

[2913] 수소화리튬알루미늄(1.16 g)에 테트라히드로푸란(20 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 이전 공정에서 제조한 1-벤질-3-(4-플루오로페닐)-5-옥소-피롤리딘-3-카르복실산에틸(4.16 g)의 테트라히드로푸란(20 mL) 용액을 적하하여, 3.5 시간 동안 환류 교반하였다. 방냉한 후, 빙냉하에 물(0.9 mL), 4 N 수산화나트륨 수용액(0.9 mL), 물(2.7 mL)을 차례로 첨가하고, 디에틸에테르, 황산마그네슘을 첨가하여 20분 교반하였다. 셀라이트 여과하고, 여과액과 세정액을 합하여 감압 농축하여, 담황색 유상의 표기 화합물(3.18 g)을 얻었다.

[2914] 공정 6

3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘의 제조

[2916] 이전 공정에서 제조한 1-벤질-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘(3.18 g)의 메탄올(30 mL) 용액에 수산화칼라듐(300 mg)을 첨가하고, 3기압 수소 분위기하에 밤새 교반하였다. 반응액을 셀라이트 여과하고, 여과액과 세정액을 합하여 감압 농축하여, 담황색 유상의 표기 화합물(2.30 g)을 얻었다.

[2917] 공정 7

3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-피롤리딘-1-카르복실산 tert-부틸의 제조

[2919] 이전 공정에서 제조한 3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘(2.30 g)에 테트라히드로푸란(40 mL), 트리에틸아민(5.7 mL)을 첨가하고, 빙냉하에 디 tert-부틸디카르보네이트(4.60 g)를 첨가하여 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액을 감압 농축하고, 아세트산에틸을 첨가하여 물, 포화 식염수로 세정하며, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(*n*-헥산:아세트산에틸=2:1)로 정제하여, 무색 유상의 표기 화합물(2.70 g)을 얻었다.

[2920] 공정 8

(-)3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘의 제조

[2922] 이전 공정에서 제조한 3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-피롤리딘-1-카르복실산 tert-부틸(1.02 g)에 클로로포름(10 mL), 트리에틸아민(962 μ L), 4-디메틸아미노피리딘(421 mg)을 첨가하고, 빙냉하에 (S)-(+)3,3,3-트리플루오로-2-메톡시-2-페닐프로페오닐클로라이드(969 μ L)를 첨가하여 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응액

을 감압 농축하고, 잔사에 물을 첨가하여 아세트산에틸로 3회 추출을 행하였다. 유기층을 황산수소칼륨 수용액, 물, 탄산수소나트륨 수용액, 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(*n*-헥산:디에틸에테르=5:3)로 정제하여, 저극성 부분입체이성질체의 무색 유상물(871 mg)을 얻었다. 또한, 고극성 부분입체이성질체의 무색 유상물(781 mg)도 함께 얻었다.

[2923] 저극성 부분입체이성질체의 무색유 상물(871 mg)을 테트라히드로푸란(4 mL), 메탄올(2 mL)에 용해하고, 4 N 수산화나트륨 수용액(2.6 mL)을 첨가하여 60 °C에서 40분간 교반하였다. 반응액을 감압 농축한 후, 잔사에 물을 첨가하고, 디에틸에테르로 3회 추출을 행하였다. 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여, 감압 농축하여 무색 유상물(481 mg)을 얻었다.

[2924] 얻어진 무색 유상물(481 mg)에 메탄올(3 mL), 4 N 염산아세트산에틸 용액(3.3 mL)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액을 감압 농축한 후, 잔사에 물을 첨가하고, 디에틸에테르로 세정하며, 수증을 2 N 수산화나트륨 수용액으로 알칼리성으로 한 후, 클로로포름으로 5회 추출하였다. 유기층을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여, 감압 농축하여 무색 유상의 표기 화합물(312 mg)을 얻었다.

[2925] $[\alpha]^D = 9.70 (c=0.598, \text{EtOH})$

[2926] (+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘의 제조

[2927] 고극성 부분입체이성질체의 무색 유상물(781 mg)을 사용하여, (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘의 제조와 동일한 방법으로 무색 유상의 표기 화합물(251 mg)을 얻었다.

[2928] $[\alpha]^D = +10.37 (c=0.588, \text{EtOH})$

[2929] 공정 9

[2930] 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-피리미딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산 tert-부틸의 제조

[2931] 실시예 121의 공정 1과 동일한 방법으로 제조한 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산 tert-부틸(1.15 g), 2-클로로피리미딘(700 mg)을 1,4-디옥산(12 mL)에 용해하고, 아세트산팔라듐(85 mg), 2,2'-비스(디페닐포스파노)-1,1'-비나프틸(352 mg), 탄산세슘(1.84 g)을 첨가하여, 3 시간 동안 가열 환류하였다. 방냉한 후, 셀라이트로 불용물을 여과 분별하고, 여과액을 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 포화 탄산수소나트륨수를 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 식염수로 세정하고, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(*n*-헥산:아세트산에틸=2:1)로 정제하여, 백색 부정형 고체의 표기 화합물(922 mg)을 얻었다.

[2932] 공정 10

[2933] 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-피리미딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산 염산염의 제조

[2934] 이전 공정에서 제조한 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-피리미딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산 tert-부틸(922 mg)을 클로로포름(2 mL)에 용해하고, 트리플루오로아세트산(4 mL)을 첨가하여, 실온으로써 밤새 교반하였다. 반응 혼합물을 감압 농축하고, 얻어진 결정을 테트라히드로푸란에 용해하며, 4 N 염산아세트산에틸 용액(2 mL)을 첨가하여 감압 농축하였다. 얻어진 결정성 잔사를 아세트산에틸(10 mL)로 1 시간 동안 슬러리 세정하여, 백색 고체의 표기 화합물(800 mg)을 얻었다.

[2935] 공정 11

[2936] (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(피리미딘-2-일)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}피롤리딘 염산염의 제조

[2937] 이전 공정에서 제조한 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-피리미딘-2-일-피페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르복실산 염산염(150 mg), 1-히드록시벤조트리아졸(81 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(102 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(3 mL)에 용해하였다. 얻어진 용액에 공정 8에서 제조한 (-)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸피롤리딘(88 mg), 트리에틸아민(0.057 mL), 4-디메틸아미노피리딘(50 mg)을 첨가하고, 실온에서 밤새 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 포화 탄산수소나트륨수, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하고, 얻어진 유리 염기를 메탄올(3 mL)에 용해하며, 4 N 염산 1,4-디옥산 용액(0.2 mL)을 첨가하여 감압 농축하였다. 얻어진 결정성 잔사를 아세트산에틸(3 mL)로 15분간 슬러리

세정하여, 백색 결정의 표기 화합물(203 mg)을 얻었다.

[2938] $[\alpha]^{25}_D = -21.3 (c=0.506, \text{ MeOH})$

실시예 128

(+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리디디-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염의 제조

[2941] 실시예 127의 공정 11과 동일한 방법으로, 5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-파리미딘-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르복실산 염산염(150 mg), 실시예 127의 공정 8에서 제조한 (+)-3-(4-플루오로페닐)-3-히드록시메틸파롤리딘(88 mg)으로부터 백색 결정의 표기 화합물(198 mg)을 얻었다.

[2942] $[\alpha]^{25}_D = +26.0 (c=0.508, \text{ MeOH})$

실시예 129

1-[5-시클로프로필-1-(1-파라진-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘 염산염의 제조

[2945] 실시예 127과 동일한 방법으로 제조한 1-[5-시클로프로필-1-(1-파라진-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르복실산 염산염(281 mg)으로부터 황색 부정형 고체의 표기 화합물(165 mg)을 얻었다.

실시예 130

1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]파롤리딘의 제조

공정 1

trans-4-(2-tert-부톡시카르보닐하드라지노)시클로헥산카르복실산에틸의 제조

[2950] 4-시클로헥사논카르복실산에틸에스테르(8.0 g)와 카르바진산 tert-부틸(6.2 g)을 클로로포름(150 ml)에 용해하고, 냉장하에 아세트산(5.4 ml), 트리아세톡시수소화붕소나트륨(30 g)을 첨가하며, 서서히 실온으로 되돌려 7시간 동안 교반하였다. 반응액을 포화 탄산수소나트륨수에 끊고, 아세트산에틸로 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(n-헥산:아세트산에틸=4:1)로 정제하여, 백색 고체의 표기 화합물(4.63 g)을 얻었다.

공정 2

trans-4-하드라지노시클로헥산카르복실산에틸 염산염의 제조

[2953] 이전 공정에서 제조한 trans-4-(2-tert-부톡시카르보닐하드라지노)시클로헥산카르복실산에틸(4.63 g)을 에탄올(30 ml)에 용해하고, 4 N 염산아세트산에틸 용액(82 ml)을 첨가하여 5.5 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하고, 얻어진 잔사에 디에틸에테르를 첨가하고, 여과 취출하고, 건조하여 백색 분말의 표기 화합물(3.86 g)을 얻었다.

공정 3

1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥산)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르복실산 tert-부틸의 제조

[2956] 이전 공정에서 얻어진 trans-4-하드라지노시클로헥산카르복실산에틸염산염(3.80 g)과 실시예 1의 공정 1과 동일한 방법으로 합성한 2-시클로프로필카르보닐-3-디메틸아미노아크릴산 tert-부틸(3.71 g)을 에탄올(50 ml)에 용해하고, 트리에틸아민(4.32 ml)을 첨가하여 1 시간 동안 환류 교반하였다. 냉장한 후, 감압 농축하여 잔사에 물을 첨가하고, 아세트산에틸로 3회 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카 겔 크로마토그래피(n-헥산:아세트산에틸=5:1)로 정제하여, 황색액체의 표기 화합물(4.80 g)을 얻었다.

공정 4

1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥산)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르복실산의 제조

[2959] 이전 공정에서 얻어진 1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥산)-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르복실산 tert-부

틸(4.80 g)의 클로로포름(14 mL) 용액에 트리플루오로아세트산(14 mL)을 첨가하고, 40 °C로 가온하여 1.5 시간 동안 교반하였다. 방냉한 후 감압 농축하고, 틀루엔을 첨가하여 공비하고, 잔사에 아세트산에틸을 첨가하여 정석하였다. 또한, 감압 농축한 후 잔사에 n-헥산을 첨가하고, 여과 취출하며, 건조하여 백색 분말의 표기 화합물(3.09 g)을 얻었다.

[2960] 공정 5

[2961] 1-{5-시클로프로필-1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥실)-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2962] 이전 공정에서 제조한 1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥산)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르복실산(1.50 g), (S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘(1.16 g)을 N,N-디메틸포름아미드(15 mL)에 용해하고, 1-히드록시벤조트리아졸(825 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(1.03 g), 4-디메틸아미노페리딘(658 mg)을 첨가하여, 실온에서 14 시간 동안 교반하였다. 반응액에 아세트산에틸을 첨가하고, 수세를 2회 행하였다. 유기층을 1 N 염산, 물, 포화 탄산수소나트륨수, 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=20:1)로 정제하여, 다갈색 부정형의 표기 화합물(2.34 g)을 얻었다.

[2963] 공정 6

[2964] 1-[1-(trans-4-카르복시시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2965] 이전 공정에서 제조한 1-{5-시클로프로필-1-(trans-4-에톡시카르보닐시클로헥실)-1H-피라졸-4-카르보닐}-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(2.34 g)을 테트라히드로푸란(12 mL), 메탄올(6 mL)에 용해하고, 여기에 수산화리튬 1수화물(973 mg)을 물(12 mL)에 용해한 수용액을 첨가하여, 45 °C에서 1 시간 동안 교반하였다. 감압 농축하여 얻어진 잔사에 물을 첨가하고, 디에틸에테르로 2회 세정하며, 수증을 2 N 염산으로 산성으로 한 후, 아세트산에틸로 3회 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 아세트산에틸, n-헥산을 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 유백색 고체의 표기 화합물(2.13 g)을 얻었다.

[2966] 공정 7

[2967] 1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2968] 이전 공정에서 제조한 1-[1-(trans-4-카르복시시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(300 mg)을 N,N-디메틸포름아미드(3.5 mL)에 용해하고, 1-히드록시벤조트리아졸(106 mg), 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)-카르보디이미드 염산염(133 mg), 염화암모늄(80 mg), 트리에틸아민(0.105 mL)을 첨가하여, 실온에서 15 시간 동안 교반하였다. 반응액에 아세트산에틸을 첨가하고, 물, 1 N 염산, 물, 포화탄산수소나트륨수, 물, 포화 식염수로 순으로 세정한 후, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 고체 잔사에 디에틸에테르를 첨가하여 10분간 교반한 후, 여과 취출하고, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(171 mg)을 얻었다.

[2969] 실시예 131

[2970] 1-[5-시클로프로필-1-(trans-4-우레이도시클로헥실)-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘의 제조

[2971] 실시예 130의 공정 6에서 제조한 1-[1-(trans-4-카르복시시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-[(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)]피롤리딘(200 mg)에 틀루엔(3.0 mL)을 첨가하고, 아르곤 분위기하에 트리에틸아민(76 μ L), 디페닐포스폰산아지드(118 μ L)를 첨가하여, 2 시간 동안 가열 환류하였다. 방냉한 후, 이 틀루엔 용액을 빙냉하여 28 % 암모니아수(10 mL)와 아세트산에틸(4 mL)의 용액에 적하하고, 동일한 온도에서 30분간 교반하였다. 반응액에 물을 첨가하고, 클로로포름으로 3회 추출하였다. 유기층을 물, 포화 식염수로 세정한 후, 황산나트륨 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 실리카겔 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=10:1)로 정제하고, 얻어진 고체 잔사에 디에틸에테르를 첨가하여 10분간 교반한 후, 여과 취출하고, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(135 mg)을 얻었다.

- [2972] 실시예 132
- [2973] 1-{5-시클로프로필-1-[trans-4-(1H-테트라졸-5-일)시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조
- [2974] 공정 1
- [2975] 1-[1-(trans-4-시아노시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조
- [2976] 실시예 130의 공정 7에서 제조한 1-[1-(trans-4-카르바모일시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘(514 mg)을 테트라히드로푸란(6 mL)에 용해하고, 피리딘(180 μL), 트리플루오로메탄술폰산 무수물(220 μL)을 첨가하여, 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 추가로 피리딘(180 μL), 트리플루오로메탄술폰산 무수물(220 μL)을 첨가하고, 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 감압 농축한 후, 1N 황산수소칼륨 수용액을 첨가하여 아세트산에틸로 추출하였다. 아세트산에틸층을 물로 세정한 후, 황산마그네슘 무수물로 건조하여 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=15:1)로 정제하여, 박황색 부정형의 표기 화합물(207 mg)을 얻었다.
- [2977] 공정 2
- [2978] 1-{5-시클로프로필-1-[trans-4-(1H-테트라졸-5-일)시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르보닐}-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조
- [2979] 이전 공정에서 제조한 1-[1-(trans-4-시아노시클로헥실)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-(S)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘(207 mg)을 1,4-디옥산(2.5 mL)에 용해하고, 아지드트리부틸주석(188 mg)을 첨가하여 밤새 가열 환류하였다. 아지드트리부틸주석(94 mg)을 추가로 첨가하고, 4시간 동안 가열 환류하였다. 감압 농축한 후, 1N 염산을 첨가하고, 클로로포름으로 2회 추출하였다. 클로로포름층을 황산마그네슘 무수물로 건조하고, 감압 농축하였다. 얻어진 잔사를 크로마토그래피(클로로포름:메탄올=25:2)로 정제하고, 감압 농축하였다. 얻어진 잔사에 디이소프로필에테르를 첨가하고, 석출된 고체를 여과 취출하며, 건조하여 백색 부정형 고체의 표기 화합물(122 mg)을 얻었다.
- [2980] 실시예 133
- [2981] 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(4-트리플루오로메틸페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘의 제조
- [2982] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2983] 실시예 134
- [2984] 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메톡시시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조
- [2985] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2986] 실시예 135
- [2987] 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-페닐-3-트리플루오로메틸-파롤리딘의 제조
- [2988] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2989] 실시예 136
- [2990] 3-(2-클로로페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,4-디플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}파롤리딘의 제조
- [2991] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2992] 실시예 137
- [2993] 3-(2-클로로파리딘-3-일)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}파롤리딘의 제조

- [2994] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2995] 실시예 138
- [2996] 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-5-(2,2,3,3-테트라메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [2997] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [2998] 실시예 139
- [2999] 1-{5-시클로헥실-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3000] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3001] 실시예 140
- [3002] 1-5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메톡시페닐)페롤리딘의 제조
- [3003] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3004] 실시예 141
- [3005] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-트리플루오로메틸페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3006] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3007] 실시예 142
- [3008] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[(S)-1-카르복시-2-메틸-프로필]메틸카르바모일}페페리딘-4-일)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3009] 실시예 12와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3010] 실시예 143
- [3011] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-메톡시-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3012] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3013] 실시예 144
- [3014] 1-{1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)페페리딘-4-일]-5-(1-히드록시메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3015] 실시예 3과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3016] 실시예 145
- [3017] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(티아졸-2-일카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3018] 실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3019] 실시예 146
- [3020] 1-{1-[1-(이소 프로포시카르바모일)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3021] 실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3022] 실시예 147

- [3023] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-플루오로벤질카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3025] 실시예 148
- [3026] 1-{1-[1-(2,3-디히드로인돌-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3028] 실시예 149
- [3029] 1-{1-[1-(2,3-디히드로[1,4]옥사진-4-카르보닐)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3031] 실시예 150
- [3032] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2,6-디클로로페리딘-3-일카르바모일)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3034] 실시예 151
- [3035] 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(2,3,4,5-테트라히드로벤조[b]아제핀-1-카르보닐)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3037] 실시예 152
- [3038] 4-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘-1-카르보닐]피라졸-1-일}페페리딘-1-일)벤조산 에틸의 제조
실시예 114와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3040] 실시예 153
- [3041] 1-[1-(1-벤질옥시카르보닐-페페리딘-4-일)-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 1의 공정 4와 동일한 방법으로, 표기 화합물을 얻었다.
- [3043] 실시예 154
- [3044] 1-{1-[1-(3-카르복시-3-메틸-부티릴)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
실시예 65와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3046] 실시예 155
- [3047] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-페녹시아세틸)페페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3049] 실시예 156
- [3050] 1-{1-[1-(3-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.

- [3052] 실시예 157
- [3053] 1-{1-[1-(2-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3054] 실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3055] 실시예 158
- [3056] 1-[5-시클로프로필-1-(1-옥살릴페페리진-4-일)-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3057] 실시예 65와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3058] 실시예 159
- [3059] 1-{1-[1-(4-클로로벤조일)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3060] 실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3061] 실시예 160
- [3062] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[2-(4-플루오로페닐)아세틸]페페리딘-4-일}-1H-페라졸-4-카르보닐)-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3063] 실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3064] 실시예 161
- [3065] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-트리플루오로메틸벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3066] 실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3067] 실시예 162
- [3068] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(3-메톡시벤조일)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3069] 실시예 64와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3070] 실시예 163
- [3071] 1-{1-[1-(4-플루오로벤질)페페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘 염산염의 제조
- [3072] 실시예 94와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3073] 실시예 164
- [3074] 1-[1-(1-벤젠술포닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐]-3-(페리딘-3-일)페롤리딘의 제조
- [3075] 실시예 108과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3076] 실시예 165
- [3077] 1-{1-[1-(4-카르바모일페닐)페페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조
- [3078] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3079] 실시예 166
- [3080] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-히드록시메틸페닐)페페리딘-4-일]-1H-페라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)페롤리딘의 제조

- [3081] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3082] 실시예 167
- [3083] 1-{1-[1-(5-카르바모일-피리딘-2-일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3084] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3085] 실시예 168
- [3086] 1-{1-[1-(4-아미노페닐)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3087] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3088] 실시예 169
- [3089] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(2-옥소옥사졸리딘-3-일)페닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3090] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3091] 실시예 170
- [3092] 1-(5-시클로프로필-1-{1-[4-(3-메톡시우레이도)페닐]피페리딘-4-일}-1H-피라졸-4-카르보닐)-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3093] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3094] 실시예 171
- [3095] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(4-메탄술포닐아미노페닐)피페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3096] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3097] 실시예 172
- [3098] 1-[1-(1-에톡시카르바모일피페리딘-4-일)-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3099] 실시예 10과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3100] 실시예 173
- [3101] 1-[1-(5-클로로피리딘-2-일)아제티딘-3-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐]-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3102] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3103] 실시예 174
- [3104] 1-{1-[1-(5-클로로-피리딘-2-일)피페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-메톡시메틸-3-페닐피롤리딘의 제조
- [3105] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3106] 실시예 175
- [3107] 1-{1-[1-(5-시아노-피리딘-2-일)피페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)피롤리딘의 제조
- [3108] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3109] 실시예 176

- [3110] 3-(2-아세톡시에틸)-3-(4-플루오로페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3111] 실시예 177
- [3112] 3-(3S*,4R*)-3-메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보닐}-4-페닐파롤리딘 염산염의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3113] 실시예 178
- [3114] 6-(4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일)나코틴 산메틸의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3115] 실시예 179
- [3116] 2-{1-[5-(1-메틸시클로프로필)-1-(1-파리미딘-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]파롤리딘-3-일}벤조 산메틸의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3117] 실시예 180
- [3118] 3-(2-히드록시메틸페닐)-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보 니}파롤리딘 염산염의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3119] 실시예 181
- [3120] 1-[5-시클로프로필-1-(1-파리딘-2-일-파페리딘-4-일)-1H-파라졸-4-카르보닐]-3-히드록시-3-(파리딘-3-일)파롤 리딘의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3121] 실시예 182
- [3122] 1-{1-[1-(4-아세틸아미노페닐)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-파라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페 닐)파롤리딘의 제조
실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3123] 실시예 183
- [3124] 4-{4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘-1-카르보닐]파라졸-1-일}파페리딘-1-일}-3-플루 오로벤조산나트륨의 제조
실시예 114와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3125] 실시예 184
- [3126] 3-(2-시아노페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보 니}파롤리딘의 제조
실시예 114와 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3127] 실시예 185
- [3128] 3-히드록시메틸-1-{1-[1-(4-메톡시파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-5-(1-메틸시클로프로필)-1H-파라졸-4-카르보 니}-3-페닐파롤리딘 염산염의 제조
실시예 121과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3129] 실시예 186
- [3130] 3-(2-시아노페닐)-1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-파라졸-4-카르보 니}파롤리딘의 제조
실시예 127과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.

- [3139] 실시예 186
- [3140] 3-(3,5-디플루오로페닐)-3-히드록시메틸-1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[1-(파리미딘-2-일)파페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}파롤리딘 염산염의 제조
- [3141] 실시예 127과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3142] 실시예 187
- [3143] 1-{1-[1-(3-클로로-파리딘-2-일)파페리딘-4-일]-5-시클로프로필-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(파리딘-3-일)파롤리딘의 제조
- [3144] 실시예 113과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3145] 실시예 188
- [3146] 1-{5-시클로프로필-1-[1-(2-플루오로페닐카르바모일)파페리딘-4-일]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(티아졸-2-일)파롤리딘의 제조
- [3147] 실시예 121과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3148] 실시예 189
- [3149] (S)-2-[(trans-4-{5-시클로프로필-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)-파롤리딘-1-카르보닐]-피라졸-1-일}-시클로헥산카르보닐)-메틸-아미노]-3-메틸부티르산의 제조
- [3150] 실시예 130과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3151] 실시예 190
- [3152] 1-{5-(1-메틸시클로프로필)-1-[trans-4-(2-플루오로페닐카르바모일)시클로헥실]-1H-피라졸-4-카르보닐}-3-(2-트리플루오로메틸페닐)파롤리딘의 제조
- [3153] 실시예 130과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3154] 실시예 191
- [3155] cis-4-{5-(1-메틸시클로프로필)-4-[3-(2-트리플루오로메틸페닐)-파롤리딘-1-카르보닐]-피라졸-1-일}-시클로헥산카르복실산의 제조
- [3156] 실시예 130과 동일한 방법으로, 대응하는 원료 화합물로부터 표기 화합물을 얻었다.
- [3157] 각 실시예의 화합물의 화학식 및 물성값을 이하의 표 1-1 내지 표 1-48에 나타낸다.

표 1-1

실시 예 번호	화학식	NMR
1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.63-0.77 (2H, m), 0.97-1.11 (2H, m), 1.70-1.82 (1H, m), 1.96-2.67 (8H, m), 2.83-2.97 (2H, m), 3.33-3.53 (3H, m), 3.55-4.17 (3H, m), 4.50-4.64 (1H, m), 7.23-7.32 (1H, m), 7.48-7.64 (2H, m), 8.46-8.61 (2H, m)
2		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.94-1.07 (2H, m), 1.86-2.36 (8H, m), 3.00-3.21 (2H, m), 3.30-3.93 (6H, m), 4.69-4.88 (1H, m), 7.44-7.64 (2H, m), 7.66-7.78 (3H, m), 8.83 (1H, brs), 9.22 (1H, brs)
3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.83 (2H, m), 0.99-1.15 (2H, m), 1.73-1.84 (1H, m), 1.90-2.50 (6H, m), 3.02-3.20 (2H, m), 3.36-3.55 (1.5H, m), 3.56-3.80 (2H, m), 3.83-3.99 (1H, m), 4.06-4.17 (0.5H, m), 4.18-4.36 (2H, m), 4.54-4.71 (1H, m), 6.71 (1H, brs), 6.93-7.00 (1H, m), 7.02-7.14 (2H, m), 7.24-7.32 (1H, m), 7.50-7.62 (2H, m), 8.02-8.09 (1H, m), 8.47-8.59 (2H, m)
4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.84 (2H, m), 1.03-1.14 (2H, m), 1.54-2.47 (7H, m), 2.94-3.14 (2H, m), 3.40-4.20 (7H, m), 4.47-4.67 (2H, m), 7.32-7.72 (6H, m)

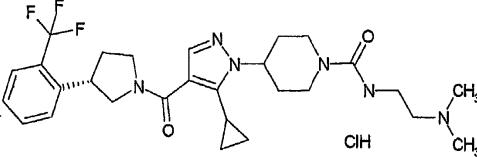
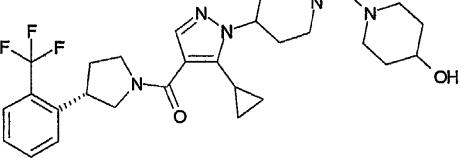
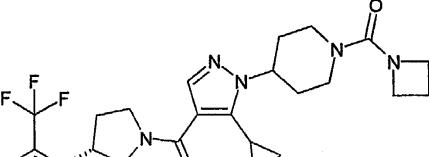
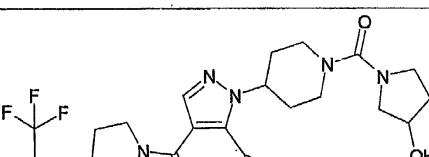
표 1-2

실험 번호	화학식	NMR
5		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.75 (2H, m), 0.92-1.07 (2H, m), 1.81-2.36 (6H, m), 3.04-3.23 (2H, m), 3.44-3.93 (6H, m), 4.10-4.27 (2H, m), 4.65-4.83 (1H, m), 6.98-7.07 (1H, m), 7.39-7.61 (3H, m), 7.63-7.79 (3H, m), 7.92-8.02 (1H, m), 8.37-8.40 (1H, m), 11.0-11.2 (1H, m), 13.6 (1H, brs)
6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.85 (2H, m), 1.01-1.14 (2H, m), 1.70-2.44 (7H, m), 2.72-2.86 (1H, m), 2.97-3.13 (2H, m), 3.41-4.09 (5H, m), 4.20-4.35 (2H, m), 4.51-4.75 (3H, m), 6.97-7.04 (1H, m), 7.11-7.19 (1H, m), 7.28-7.60 (5H, m), 7.64-7.72 (1H, m), 7.92-7.98 (1H, m), 8.13-8.23 (1H, m)
7		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.94 (6H, m), 0.98-1.17 (2H, m), 1.64-1.86 (3H, m), 1.93-2.23 (3H, m), 2.24-2.48 (1H, m), 2.79-2.99 (2H, m), 3.32-4.22 (9H, m), 4.38-4.63 (1H, m), 5.64-5.87 (1H, m), 7.29-7.60 (4H, m), 7.60-7.71 (1H, m)
8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.82 (2H, m), 0.99-1.12 (2H, m), 1.20-1.34 (1H, m), 1.67-1.88 (4H, m), 1.95-2.21 (3H, m), 2.23-2.46 (1H, m), 2.82-3.02 (2H, m), 3.28-3.48 (3H, m), 3.52-3.99 (5H, m), 3.99-4.22 (2H, m), 4.41-4.63 (1H, m), 5.16-5.33 (1H, m), 7.28-7.71 (5H, m)

표 1-3

실시 예 번호	화학식	NMR
9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.87 (2H, m), 0.98-1.17 (2H, m), 1.31 (3H, s), 1.32 (3H, s), 1.66-2.25 (6H, m), 2.26-2.47 (1H, m), 2.83-3.02 (2H, m), 3.39-4.20 (9H, m), 4.43-4.64 (1H, m), 4.67-4.84 (1H, m), 5.00-5.46 (1H, brs), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.60 (3H, m), 7.61-7.72 (1H, m)
10		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.82 (2H, m), 1.00-1.11 (2H, m), 1.70-1.83 (1H, m), 1.83-1.95 (3H, m), 1.99 (3H, br s), 2.04-2.22 (3H, m), 2.27-2.43 (1H, m), 2.86-3.01 (2H, m), 3.33-3.43 (4H, m), 3.54-4.18 (6H, m), 4.44-4.63 (1H, m), 5.42-5.53 (1H, m), 6.33-6.41 (1H, m), 7.32-7.71 (5H, m)
11		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.74 (2H, m), 0.91-1.05 (2H, m), 1.78-2.34 (7H, m), 2.78-2.99 (5H, m), 3.22-3.94 (6H, m), 4.06-4.21 (2H, m), 4.54-4.72 (1H, m), 6.46-6.95 (1H, m), 7.42-7.77 (5H, m), 7.88-8.03 (3H, m)
12		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.86 (2H, m), 1.01-1.16 (2H, m), 1.71-1.86 (1H, m), 1.89-2.46 (6H, m), 2.91-3.15 (6H, m), 3.40-4.14 (11H, m), 4.47-4.67 (1H, m), 7.32-7.73 (5H, m)

표 1-4

실시예 번호	화학식	NMR
1 3		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.68-0.86 (2H, m), 1.00-1.15 (2H, m), 1.58-2.49 (15H, m), 2.84-3.03 (2H, m), 3.20-3.38 (2H, m), 3.41-4.25 (7H, m), 4.44-4.65 (1H, m), 5.13-5.29 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)
1 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.82 (2H, m), 1.03-1.12 (2H, m), 1.46-1.60 (3H, m), 1.72-1.97 (5H, m), 2.00-2.44 (4H, m), 2.80-3.07 (4H, m), 3.42-4.10 (10H, m), 4.43-4.61 (1H, m), 7.32-7.71 (5H, m)
1 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.83 (2H, m), 1.02-1.14 (2H, m), 1.71-2.45 (9H, m), 2.81-2.96 (2H, m), 3.42-4.22 (11H, m), 4.45-4.63 (1H, m), 7.32-7.72 (5H, m)
1 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.85 (2H, m), 0.99-1.17 (2H, m), 1.71-2.45 (10H, m), 2.79-3.00 (2H, m), 3.27-4.11 (11H, m), 4.39-4.63 (2H, m), 7.32-7.73 (5H, m)

[3161]

표 1-5

설시 예 번호	화학식	NMR
1 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.75 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.32-1.47 (1H, m), 1.63-1.98 (6H, m), 2.02-2.39 (2H, m), 2.78-3.00 (4H, m), 3.02-3.16 (2H, m), 3.38-3.54 (4H, m), 3.54-3.78 (3H, m), 3.80-4.55 (8H, m), 4.55-4.72 (1H, m), 7.01-7.20 (1H, brs), 7.41-7.60 (2H, m), 7.65-7.78 (3H, m), 9.99-10.16 (1H, brs)
1 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.86 (2H, m), 1.01-1.15 (2H, m), 1.71-2.45 (11H, m), 2.83-3.01 (2H, m), 3.33-3.51 (4H, m), 3.57-4.11 (7H, m), 4.45-4.62 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)
1 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.86 (2H, m), 1.02-1.15 (2H, m), 1.70-2.46 (9H, m), 2.83-3.01 (2H, m), 3.41-4.12 (11H, m), 4.46-4.65 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)
2 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.84 (2H, m), 1.00-1.16 (2H, m), 1.71-2.26 (6H, m), 2.27-2.45 (1H, m), 2.50-2.59 (1H, m), 2.81-3.00 (2H, m), 3.42-4.12 (9H, m), 4.46-4.68 (2H, m), 7.31-7.72 (5H, m)

표 1-6

실시예 번호	화학식	NMR
2 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.84 (2H, m), 0.99-1.15 (2H, m), 1.71-2.44 (10H, m), 2.78-2.99 (2H, m), 3.26-4.12 (11H, m), 4.42-4.62 (2H, m), 7.31-7.72 (5H, m)
2 2		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.85 (2H, m), 0.99-1.16 (2H, m), 1.68-2.47 (10H, m), 2.76-2.99 (2H, m), 3.27-4.11 (11H, m), 4.41-4.62 (2H, m), 7.32-7.73 (5H, m)
2 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.81 (2H, m), 1.05-1.15 (2H, m), 1.71-2.45 (7H, m), 1.94-2.44 (6H, m), 2.85-3.05 (2H, m), 3.35-4.20 (9H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 4.65-4.75 (1H, m), 7.30-8.30 (5H, m)
2 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.83 (2H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.15-1.32 (3H, m), 1.35-1.46 (1H, m), 1.63-2.45 (9H, m), 2.73-2.98 (4H, m), 3.40-4.12 (11H, m), 4.42-4.63 (1H, m), 7.29-7.74 (5H, m)

[3163]

표 1-7

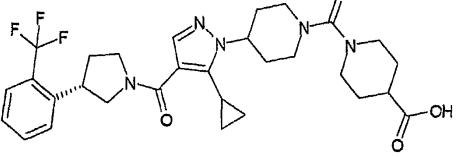
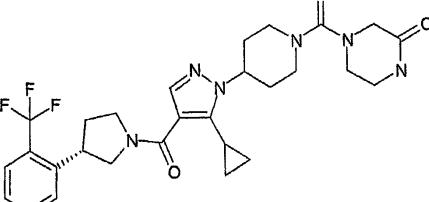
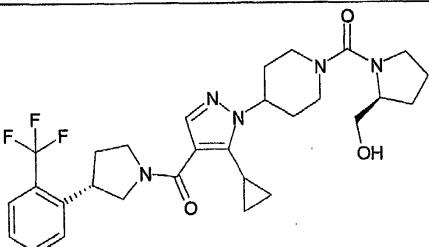
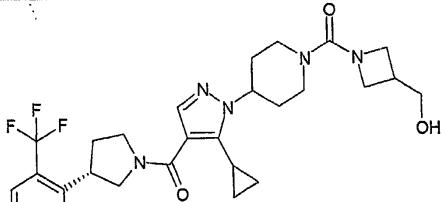
설시 예 번호	화학식	NMR
25		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.74 (2H, m), 0.91-1.06 (2H, m), 1.42-1.63 (2H, m), 1.72-2.46 (10H, m), 2.75-3.03 (4H, m), 3.43-3.96 (9H, m), 4.48-4.72 (1H, m), 7.38-7.83 (5H, m), 12.1-12.4 (1H, m)
26		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.85 (2H, m), 0.97-1.17 (2H, m), 1.68-2.46 (7H, m), 2.84-3.08 (2H, m), 3.36-4.13 (13H, m), 4.44-4.67 (1H, m), 6.54-6.71 (1H, m), 7.30-7.73 (5H, m)
27		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.84 (2H, m), 1.00-1.15 (2H, m), 1.43-1.59 (1H, m), 1.61-2.45 (10H, m), 2.78-3.01 (2H, m), 3.32-4.10 (11H, m), 4.18-4.31 (1H, m), 4.45-4.63 (1H, m), 7.31-7.72 (5H, m)
28		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.83 (2H, m), 0.96-1.16 (2H, m), 1.70-2.29 (6H, m), 2.29-2.39 (1H, m), 2.67-2.69 (1H, m), 2.82-2.97 (2H, m), 3.38-4.18 (13H, m), 4.41-4.65 (1H, m), 7.30-7.74 (5H, m)

표 1-8

설정 예 번호	화학식	NMR
29		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.73 (2H, m), 0.94-1.06 (2H, m), 1.79-2.34 (7H, m), 2.74-2.82 (3H, m), 2.89-3.93 (17H, m), 4.55-4.74 (1H, m), 7.42-7.80 (5H, m), 10.4-10.6 (1H, m)
30		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.22-1.35 (6H, m), 1.77-2.46 (7H, m), 2.85-3.11 (5H, m), 3.21-3.96 (13H, m), 4.52-4.74 (1H, m), 7.42-7.82 (5H, m), 10.3-10.5 (1H, m)
31		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.85 (2H, m), 1.02-1.16 (2H, m), 1.71-2.47 (10H, m), 2.87-3.03 (2H, m), 3.20-4.15 (15H, m), 4.45-4.66 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)
32		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-0.84 (2H, m), 0.97-1.15 (2H, m), 1.37-1.55 (1H, m), 1.55-1.96 (6H, m), 1.99-2.46 (5H, m), 2.77-3.03 (1H, m), 3.15-4.12 (12H, m), 4.38-4.65 (1H, m), 7.30-7.74 (5H, m)

[3165]

표 1-9

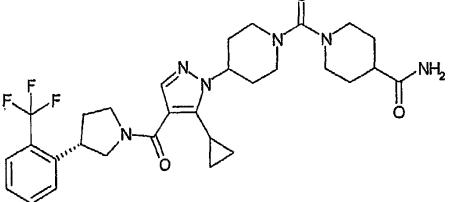
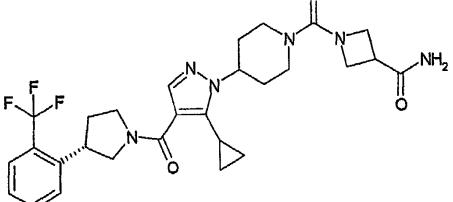
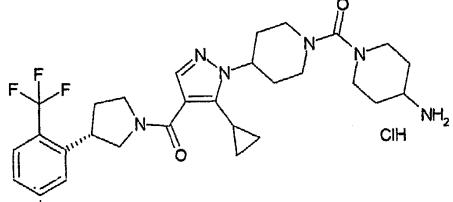
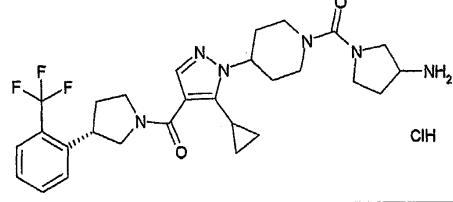
실시예 번호	화학식	NMR
3 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.85 (2H, m), 1.01-1.14 (2H, m), 1.62-1.99 (7H, m), 1.99-2.47 (5H, m), 2.74-3.00 (4H, m), 3.41-3.53 (0.6H, m), 3.56-4.11 (8.4H, m), 4.43-4.61 (1H, m), 5.44 (1H, brs), 5.56 (1H, brs), 7.32-7.38 (1H, m), 7.39-7.60 (3H, m), 7.62-7.71 (1H, m)
3 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.83 (2H, m), 0.99-1.15 (2H, m), 1.67-1.98 (3H, m), 1.98-2.24 (3H, m), 2.25-2.44 (1H, m), 2.78-3.00 (2H, m), 3.20-3.39 (1H, m), 3.40-3.53 (0.5H, m), 3.53-4.09 (6.5H, m), 4.10-4.25 (4H, m), 4.40-4.66 (1H, m), 5.59 (1H, brs), 5.77 (1H, brs), 7.31-7.39 (1H, m), 7.40-7.60 (3H, m), 7.62-7.71 (1H, m)
3 5		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.72 (2H, m), 0.94-1.06 (2H, m), 1.39-1.56 (2H, m), 1.78-2.01 (6H, m), 2.05-2.34 (2H, m), 2.72-3.01 (4H, m), 3.24-3.27 (1H, m), 3.43-4.01 (9H, m), 4.53-4.70 (1H, m), 7.43-7.60 (2H, m), 7.66-7.77 (3H, m), 8.33 (3H, brs)
3 6		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.55-0.73 (2H, m), 0.89-1.08 (2H, m), 1.69-2.38 (10H, m), 2.77-3.02 (2H, m), 3.12-4.15 (11H, m), 4.52-4.73 (1H, m), 7.41-7.77 (3H, m), 8.18-8.40 (3H, m), 8.42-8.61 (1H, m), 9.36-9.63 (1H, m)

표 1-10

설시 예 번호	화학식	NMR
3 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.73 (2H, m), 0.92-1.04 (2H, m), 1.55-1.70 (2H, m), 1.74-1.98 (7H, m), 2.02-2.36 (2H, m), 2.73-3.02 (4H, m), 3.19-3.33 (2H, m), 3.45-4.32 (8H, m), 4.53-4.72 (1H, m), 6.44-6.62 (1H, m), 7.42-7.79 (5H, m), 8.62 (1H, br s), 8.72 (1H, br s)
3 8		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.74 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.47-1.63 (2H, m), 1.78-2.56 (8H, m), 2.62-3.03 (4H, m), 2.77 (6H, s), 3.24-3.94 (10H, m), 4.54-4.70 (1H, m), 7.42-7.62 (2H, m), 7.63-7.79 (3H, m), 10.2-10.4 (1H, m)
3 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.84 (2H, m), 1.02-1.14 (2H, m), 1.31-1.46 (2H, m), 1.71-2.45 (9H, m), 1.97 (3H, s), 2.81-3.00 (4H, m), 3.42-4.10 (10H, m), 4.44-4.61 (1H, m), 5.29-5.43 (1H, m), 7.33-7.72 (5H, m)
4 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.83 (2H, m), 1.00-1.13 (2H, m), 1.68-2.46 (13H, m), 2.81-3.00 (2H, m), 3.28-4.10 (10H, m), 4.36-4.63 (2H, m), 5.61-5.72 (1H, m), 7.31-7.70 (5H, m)

표 1-11

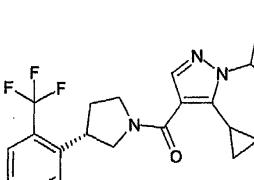
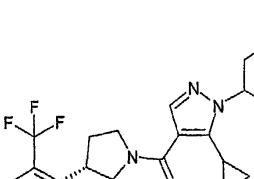
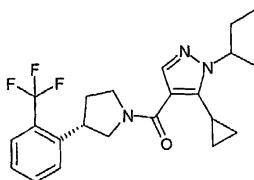
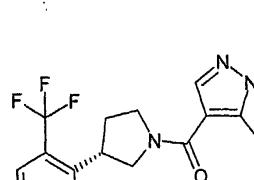
실시 예 번호	화학식	NMR
4 1		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.71 (2H, m), 0.92-1.03 (2H, m), 1.76-2.36 (8H, m), 2.70-2.80 (6H, brs), 2.81-3.03 (2H, m), 3.24-3.92 (13H, m), 4.52-4.71 (1H, m), 7.41-7.77 (5H, m), 10.76-10.91 (1H, brs)
4 2		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.74 (2H, m), 0.92-1.05 (2H, m), 1.60-2.00 (9H, m), 2.03-2.38 (2H, m), 2.65-3.93 (15H, m), 4.04-4.24 (2H, m), 4.51-4.73 (1H, m), 6.28-6.65 (1H, m), 7.41-7.81 (5H, m), 9.88 (1H, brs)
4 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.83 (2H, m), 1.02-1.15 (2H, m), 1.22-1.38 (2H, m), 1.70-2.26 (11H, m), 2.28-2.46 (1H, m), 2.67-2.79 (1H, m), 2.86-3.04 (2H, m), 3.10-3.24 (1H, m), 3.40-4.21 (9H, m), 4.32-4.45 (1H, m), 4.47-4.64 (2H, m), 7.32-7.72 (5H, m)
4 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.85 (2H, m), 1.02-1.18 (2H, m), 1.70-2.57 (11H, m), 2.91-3.08 (2H, m), 3.38-4.13 (11H, m), 4.74-4.66 (1H, m), 7.32-7.76 (5H, m)

표 1-12

설시예 번호	화학식	NMR
4 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.85 (2H, m), 0.96-1.17 (2H, m), 1.65-1.95 (3H, m), 1.96-2.22 (3H, m), 1.99 (3H, s), 2.25-2.48 (1H, m), 2.81-3.02 (2H, m), 3.38-3.5 (0.6H, m), 3.54-4.14 (8.4H, m), 4.19-4.37 (2H, m), 4.43-4.72 (2H, m), 6.24-6.40 (1H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.62-7.70 (1H, m)
4 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.88 (2H, m), 1.02-1.17 (2H, m), 1.71-1.87 (1H, m), 1.88-2.45 (6H, m), 2.48-2.60 (2H, m), 2.90-3.06 (2H, m), 3.43-4.11 (11H, m), 4.49-4.66 (1H, m), 7.33-7.72 (5H, m)
4 7		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.81 (2H, m), 1.01-1.12 (2H, m), 1.71-1.82 (1H, m), 1.83-1.96 (3H, m), 1.99-2.25 (3H, m), 2.26-2.43 (1H, m), 2.93-3.08 (2H, m), 3.41-4.00 (6H, m), 4.00-4.20 (2H, m), 4.49-4.64 (1H, m), 4.85-4.97 (1H, m), 7.30-7.70 (5H, m)
4 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.86 (2H, m), 1.01-1.17 (2H, m), 1.71-2.45 (7H, m), 2.86-3.06 (2H, m), 3.42-4.12 (11H, m), 4.49-4.67 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)

표 1-13

설시 예 번호	화학식	NMR
4 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.83 (2H, m), 0.92-1.02 (6H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.22-1.33 (2H, m), 1.71-1.98 (4H, m), 1.99-2.45 (4H, m), 2.88-3.08 (2H, m), 3.14-3.28 (1H, brs), 3.38-4.24 (8H, m), 4.47-4.73 (2H, m), 7.32-7.72 (5H, m)
5 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.63-0.81 (2H, m), 0.96-1.13 (2H, m), 1.60-1.81 (3H, m), 1.90-2.21 (3H, m), 2.26-2.46 (1H, m), 2.72-2.98 (4H, m), 3.38-4.13 (9H, m), 4.37-4.59 (1H, m), 4.94-5.04 (1H, m), 7.16-7.73 (10H, m)
5 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.82 (2H, m), 1.00-1.12 (2H, m), 1.69-1.85 (3H, m), 1.96-2.22 (3H, m), 2.25-2.45 (1H, m), 2.84-3.01 (2H, m), 3.39-3.50 (2H, m), 3.54-4.27 (7H, m), 4.41-4.61 (1H, m), 4.93-5.04 (1H, m), 5.38-5.55 (1H, m), 7.23-7.73 (10H, m)
5 2		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.79 (2H, m), 0.89-0.99 (6H, m), 1.02-1.12 (2H, m), 1.31-1.43 (2H, m), 1.60-1.85 (4H, m), 2.00-2.20 (3H, m), 2.25-2.45 (1H, m), 2.81-3.00 (2H, m), 3.39-4.21 (10H, m), 4.42-4.60 (1H, m), 4.79-4.92 (1H, m), 7.30-7.73 (5H, m)

표 1-14

실시예 번호	화학식	NMR
5 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.83 (2H, m), 1.00-1.14 (2H, m), 1.67-1.90 (3H, m), 1.98-2.27 (3H, m), 2.27-2.24 (1H, m), 2.98-3.14 (2H, m), 3.42-4.11 (5H, m), 4.22-4.40 (2H, m), 4.50-4.66 (1H, m), 6.78-6.88 (1H, m), 6.98-7.13 (3H, m), 7.14-7.21 (1H, m), 7.34-7.61 (4H, m), 7.64-7.73 (1H, m), 8.24-9.36 (1H, m)
5 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.85 (2H, m), 0.97-1.16 (2H, m), 1.51-2.46 (15H, m), 2.84-3.07 (2H, m), 3.42-4.19 (9H, m), 4.47-4.64 (1H, m), 4.65-4.75 (1H, m), 5.14-5.24 (1H, m), 7.31-7.73 (5H, m)
5 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.85 (2H, m), 0.95-1.18 (2H, m), 1.36-2.25 (7H, m), 2.25-2.44 (1H, m), 2.76-3.05 (2H, m), 3.38-3.47 (0.5H, m), 3.52-3.91 (3.5H, m), 3.95-4.31 (3H, m), 4.34-4.60 (1H, m), 7.29-7.73 (8H, m), 8.00-8.13 (2H, m)
5 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.63-0.83 (2H, m), 0.98-1.16 (2H, m), 1.65-1.91 (3H, m), 1.92-2.23 (3H, m), 2.24-2.50 (1H, m), 2.80-3.05 (2H, m), 3.16-3.34 (3H, m), 3.39-3.51 (0.6H, m), 3.52-4.13 (5.4H, m), 4.19-4.43 (2H, m), 4.44-4.64 (1H, m), 7.30-7.39 (1H, m), 7.41-7.60 (3H, m), 7.61-7.70 (1H, m)

[3171]

표 1-15

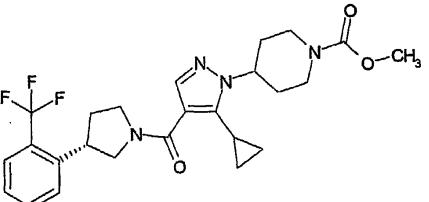
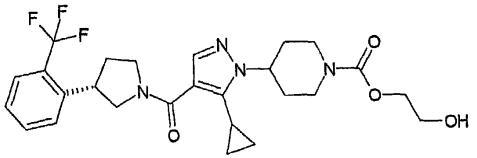
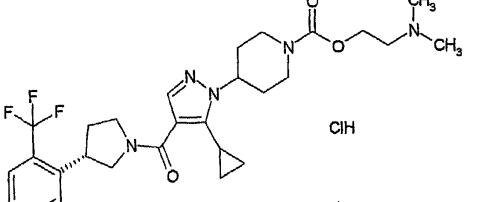
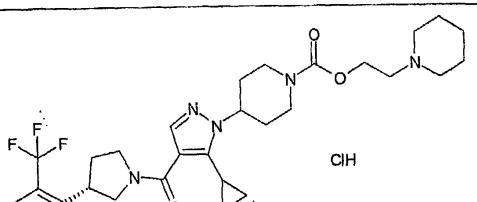
실시예 번호	화학식	NMR
5 7		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.83 (2H, m), 0.98-1.15 (2H, m), 1.65-1.94 (3H, m), 1.94-2.25 (3H, m), 2.25-2.45 (1H, m), 2.77-3.05 (2H, m), 3.43-4.07 (8H, m), 4.11-4.45 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 7.30-7.72 (5H, m)
5 8		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.67-0.84 (2H, m), 1.03-1.15 (2H, m), 1.69-2.59 (8H, m), 2.86-3.11 (2H, m), 3.38-4.13 (7H, m), 4.19-4.44 (4H, m), 4.48-4.66 (1H, m), 7.30-7.74 (5H, m)
5 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.87 (2H, m), 0.99-1.18 (2H, m), 1.72-1.86 (1H, m), 1.87-1.99 (2H, m), 2.06-2.47 (4H, m), 2.63-3.23 (10H, m), 3.26-3.42 (2H, m), 3.43-4.13 (3H, m), 4.20-4.75 (5H, m), 7.33-7.39 (1H, m), 7.40-7.63 (3H, m), 7.64-7.69 (1H, m), 12.69 (1H, brs)
6 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.72-0.83 (2H, m), 1.07-1.23 (2H, m), 1.35-1.56 (1H, m), 1.79-2.00 (4H, m), 2.06-2.45 (6H, m), 2.68-3.20 (4H, m), 3.27-3.41 (2H, m), 3.43-4.08 (8H, m), 4.22-4.48 (2H, m), 4.58-4.82 (3H, m), 7.34-7.40 (1H, m), 7.44-7.50 (1H, m), 7.53-7.60 (1H, m), 7.65-7.72 (2H, m), 12.22 (1H, brs)

표 1-16

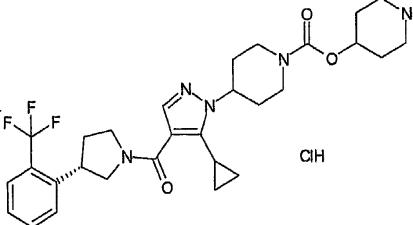
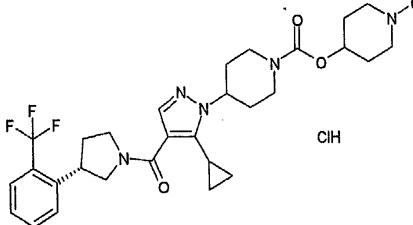
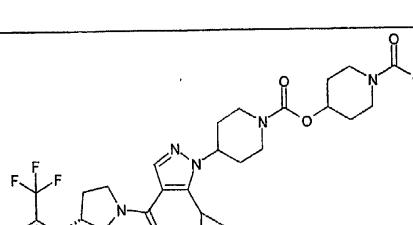
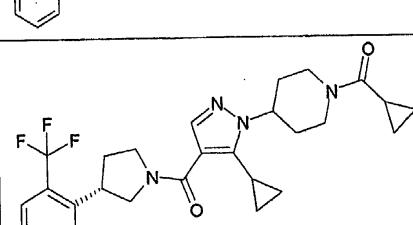
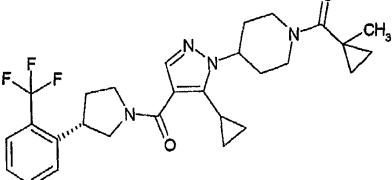
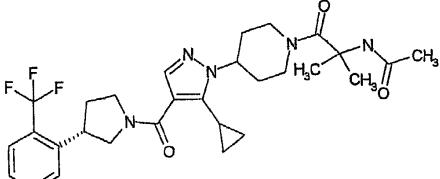
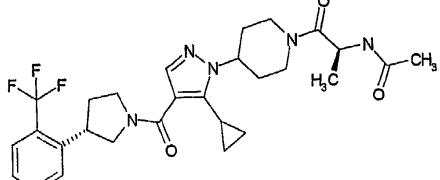
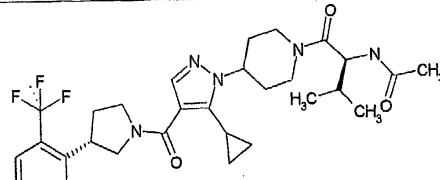
실시 예 번호	화학식	NMR
6 1	 ClH	¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.88 (2H, m), 1.03-1.21 (2H, m), 1.79-2.01 (3H, m), 2.01-2.32 (7H, m), 2.33-2.45 (1H, m), 2.81-3.12 (2H, m), 3.11-4.14 (9H, m), 4.15-4.49 (2H, m), 4.54-4.75 (1H, m), 4.92-5.09 (1H, m), 7.33-7.41 (1H, m), 7.44-7.61 (2H, m), 7.63-7.75 (2H, m), 9.45-9.81 (2H, m)
6 2	 ClH	¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.87 (2H, m), 1.04-1.21 (2H, m), 1.78-2.01 (3H, m), 2.03-2.49 (7H, m), 2.50-2.68 (1H, m), 2.72-3.14 (7H, m), 3.23-4.07 (7H, m), 4.17-4.44 (2H, m), 4.57-4.75 (1H, m), 4.76-4.89 (0.5H, m), 5.01-5.09 (0.5H, m), 7.33-7.41 (1H, m), 7.43-7.52 (1H, m), 7.52-7.61 (1H, m), 7.62-7.73 (2H, m), 12.38-12.70 (1H, m)
6 3	 ClH	¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.85 (2H, m), 0.99-1.16 (2H, m), 1.57-2.25 (13H, m), 2.26-2.46 (1H, m), 2.79-3.11 (2H, m), 3.27-3.54 (2.6H, m), 3.55-4.12 (6.4H, m), 4.14-4.66 (3H, m), 4.85-5.00 (1H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.62-7.71 (1H, m)
6 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.87 (4H, m), 0.91-1.18 (4H, m), 1.70-1.86 (2H, m), 1.88-2.48 (6H, m), 2.65-2.89 (1H, m), 3.13-3.39 (1H, m), 3.41-4.13 (5H, m), 4.27-4.89 (3H, m), 7.31-7.76 (5H, m)

표 1-17

실시예 번호	화학식	NMR
6 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.87 (2H, m), 1.01-1.16 (2H, m), 1.69-1.86 (1H, m), 1.90-2.49 (6H, m), 2.85-3.02 (1H, m), 3.07-3.26 (1H, m), 3.40-4.12 (7H, m), 4.16-4.29 (2H, m), 4.54-4.82 (2H, m), 7.31-7.77 (5H, m)
6 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.63-0.83 (2H, m), 0.98-1.10 (2H, m), 1.12-1.23 (2H, m), 1.38-1.51 (2H, m), 1.66-2.22 (6H, m), 2.27-2.45 (1H, m), 2.73-3.03 (2H, m), 3.37-4.11 (5H, m), 4.15-4.95 (3H, m), 6.94-7.73 (9H, m)
6 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.74 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.15-1.20 (1H, m), 1.75-2.36 (4H, m), 2.78-2.87 (6H, brs), 3.14-3.36 (1H, m), 3.40-3.92 (9H, m), 4.22-4.56 (3H, m), 4.64-4.86 (1H, m), 7.40-7.62 (2H, m), 7.64-7.77 (3H, m), 9.61-9.74 (1H, brs)
6 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.72-0.84 (2H, m), 1.04-1.16 (2H, m), 1.72-1.86 (1H, m), 1.90-2.28 (8H, m), 2.28-2.45 (1H, m), 2.81-2.96 (1H, m), 3.15-3.29 (1H, m), 3.42-3.51 (0.5H, m), 3.58-4.21 (7.5H, m), 4.58-4.79 (2H, m), 6.58-6.67 (1H, br s), 7.33-7.42 (1H, m), 7.42-7.62 (3H, m), 7.63-7.72 (1H, m)

표 1-18

실시예 번호	화학식	NMR
6 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.54-0.67 (2H, m), 0.71-0.86 (2H, m), 0.92-1.02 (2H, m), 1.04-1.14 (2H, m), 1.28-1.40 (3H, m), 1.72-1.86 (1H, m), 1.89-2.24 (5H, m), 2.27-2.46 (1H, m), 2.86-3.13 (2H, m), 3.41-4.12 (5H, m), 4.51-4.71 (3H, m), 7.32-7.75 (5H, m)
7 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.82 (2H, m), 1.01-1.12 (2H, m), 1.60-1.71 (7H, m), 1.71-2.45 (10H, m), 2.93-3.12 (1H, m), 3.37-4.10 (6H, m), 4.47-4.70 (2H, m), 6.70-6.79 (1H, brs), 7.28-7.71 (5H, m)
7 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.84 (2H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.29-1.41 (4H, m), 1.71-1.84 (1H, m), 1.89-2.45 (7H, m), 2.76-2.96 (2H, m), 3.16-3.34 (2H, m), 3.39-4.15 (5H, m), 4.56-4.79 (2H, m), 4.85-4.99 (1H, m), 6.55-6.67 (1H, m), 7.31-7.70 (5H, m)
7 2		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.83 (2H, m), 0.84-1.03 (6H, m), 1.03-1.14 (2H, m), 1.22-1.34 (2H, m), 1.71-2.44 (9H, m), 2.76-2.92 (1H, m), 3.17-4.79 (9H, m), 4.84-4.95 (1H, m), 6.19-6.30 (1H, m), 7.31-7.71 (5H, m)

[3175]

표 1-19

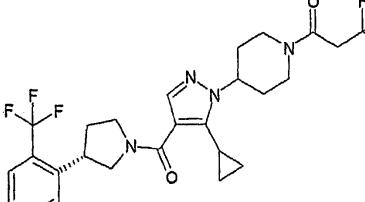
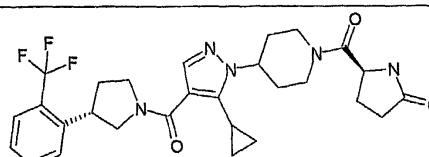
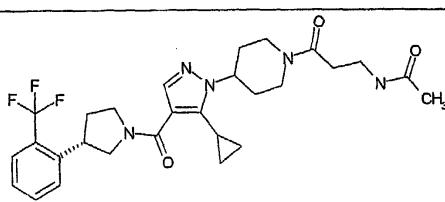
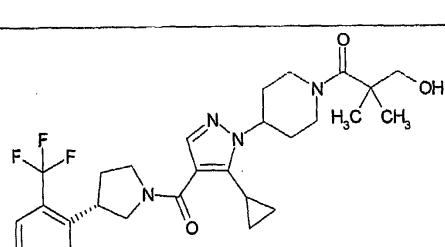
실시예 번호	화학식	NMR
7 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.86 (2H, m), 0.99-1.18 (2H, m), 1.69-1.85 (1H, m), 1.89-2.45 (6H, m), 2.78-2.94 (1H, m), 3.19-3.39 (3H, m), 3.41-3.50 (0.6H, m), 3.56-4.10 (5.4H, m), 4.56-4.83 (2H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.62-7.71 (1H, m)
7 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.85 (2H, m), 1.03-1.15 (2H, m), 1.69-1.86 (1H, m), 1.91-2.61 (9H, m), 2.76-2.95 (1H, m), 3.18-4.11 (8H, m), 4.44-4.83 (3H, m), 5.76-5.93 (1H, m), 7.32-7.75 (5H, m)
7 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.82 (2H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.69-1.84 (1H, m), 1.85-2.01 (6H, m), 2.02-2.23 (2H, m), 2.26-2.46 (1H, m), 2.47-2.60 (2H, m), 2.71-2.84 (1H, m), 3.11-3.26 (1H, m), 3.41-4.10 (8H, m), 4.54-4.68 (1H, m), 4.69-4.82 (1H, m), 6.32-6.40 (1H, brs), 7.31-7.70 (5H, m)
7 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.87 (2H, m), 1.02-1.18 (2H, m), 1.31 (3H, s), 1.33 (3H, s), 1.72-1.88 (1H, m), 1.90-2.48 (6H, m), 2.88-3.10 (2H, m), 3.42-4.15 (8H, m), 4.47-4.75 (3H, m), 7.32-7.74 (5H, m)

표 1-20

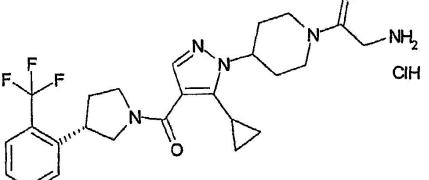
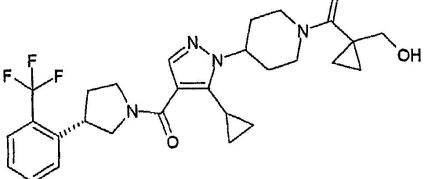
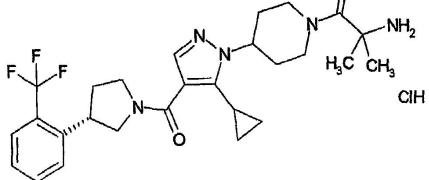
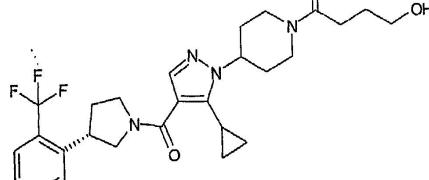
실시예 번호	화학식	NMR
7 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.74 (2H, m), 0.93-1.05 (2H, m), 1.21-1.32 (1H, m), 1.72-2.34 (5H, m), 2.79-2.98 (1H, m), 3.13-3.34 (1H, m), 3.39-4.36 (9H, m), 4.38-4.55 (1H, m), 4.63-4.84 (1H, m), 7.40-7.60 (2H, m), 7.63-7.74 (3H, m), 8.80-8.18 (3H, brs)
7 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.89 (4H, m), 0.97-1.16 (4H, m), 1.71-1.86 (1H, m), 1.88-2.24 (6H, m), 2.27-2.46 (1H, m), 2.90-3.11 (2H, m), 3.41-4.11 (7H, m), 4.54-4.74 (3H, m), 7.33-7.74 (5H, m)
7 9		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.74 (2H, m), 0.94-1.03 (2H, m), 1.50-1.65 (7H, m), 1.74-2.38 (5H, m), 2.99-3.28 (2H, m), 3.37-3.90 (5H, m), 3.94-4.65 (3H, m), 4.67-4.89 (1H, m), 7.40-7.78 (5H, m), 8.12-8.32 (3H, brs)
8 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.83 (2H, m), 1.02-1.14 (2H, m), 1.70-1.85 (1H, m), 1.85-2.46 (8H, m), 2.49-2.60 (2H, m), 2.69-2.85 (2H, m), 3.13-3.29 (1H, m), 3.41-3.50 (0.5H, m), 3.55-4.14 (7.5H, m), 4.53-4.70 (1H, m), 4.71-4.85 (1H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.40-7.61 (3H, m), 7.62-7.73 (1H, m)

표 1-21

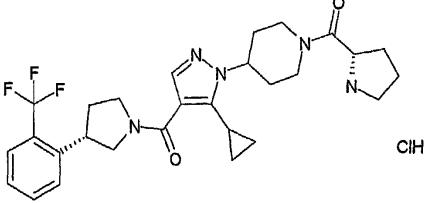
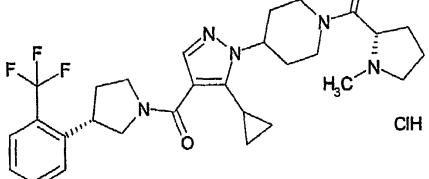
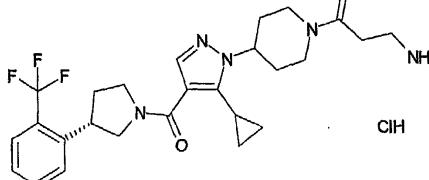
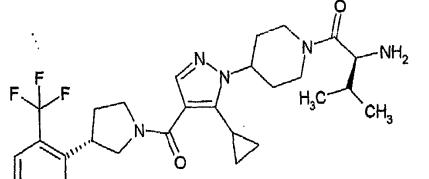
설정에 번호	화학식	NMR
8 1		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.74 (2H, m), 0.93-1.10 (2H, m), 1.70-2.48 (12H, m), 2.83-3.03 (1H, m), 3.11-4.08 (9H, m), 4.41-4.85 (2H, m), 7.42-7.53 (2H, m), 7.65-7.78 (3H, m), 9.91-10.05 (1H, brs), 10.12-10.24 (1H, brs)
8 2		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.75 (2H, m), 0.92-1.03 (2H, m), 1.74-2.17 (11H, m), 2.18-2.35 (1H, m), 2.73-2.87 (3H, m), 2.88-3.90 (10H, m), 4.43-4.56 (1H, m), 4.60-4.85 (1H, m), 7.41-7.76 (5H, m), 9.53-9.70 (1H, brs)
8 3		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.72 (2H, m), 0.93-1.04 (2H, m), 1.69-2.02 (5H, m), 2.03-2.16 (1H, m), 2.17-2.34 (1H, m), 2.64-2.87 (3H, m), 2.91-3.07 (2H, m), 3.16-3.32 (1H, m), 3.42-3.78 (6H, m), 3.80-3.99 (1H, m), 4.44-4.58 (1H, m), 7.42-7.94 (8H, m)
8 4		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.73 (2H, m), 0.87-1.10 (8H, m), 1.73-2.17 (8H, m), 2.18-2.34 (1H, m), 2.81-2.98 (1H, m), 3.21-3.37 (1H, m), 3.40-3.92 (4H, m), 4.04-4.19 (1H, m), 4.23-4.41 (1H, m), 4.46-4.61 (1H, m), 4.66-4.85 (1H, m), 7.43-7.61 (2H, m), 7.64-7.77 (3H, m), 8.07-8.24 (3H, m)

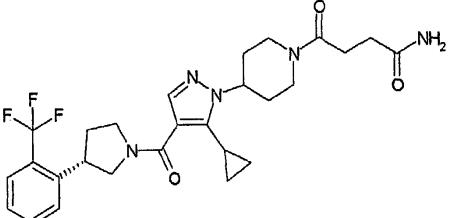
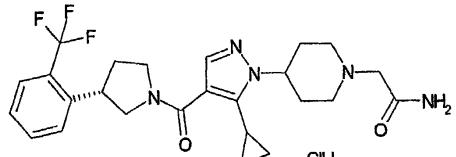
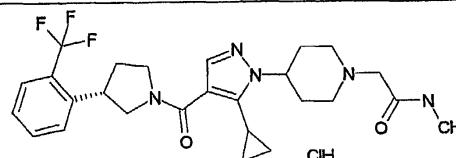
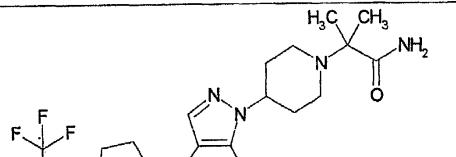
표 1-22

실시 예 번호	화학식	NMR
8 5		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.74 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.72-2.35 (8H, m), 2.53-2.62 (3H, m), 2.80-2.98 (1H, m), 3.18-3.34 (1H, m), 3.42-3.90 (5H, m), 3.98-4.23 (2H, m), 4.40-4.54 (1H, m), 4.66-4.82 (1H, m), 7.42-7.78 (5H, m), 8.77-9.02 (2H, m)
8 6		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.72 (2H, m), 0.93-1.02 (2H, m), 1.67-1.84 (6H, m), 1.85-2.00 (4H, m), 2.03-2.17 (1H, m), 2.18-2.33 (1H, m), 2.65-2.81 (1H, m), 2.84-3.08 (3H, m), 3.16-3.32 (4H, m), 3.52-3.90 (3H, m), 4.05-4.19 (1H, m), 4.44-4.57 (1H, m), 4.63-4.79 (1H, m), 7.40-7.75 (5H, m), 8.62-8.78 (1H, m), 9.04-9.16 (1H, m)
8 7		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.84 (2H, m), 1.03-1.12 (2H, m), 1.14-1.22 (7H, m), 1.66-2.24 (6H, m), 2.27-2.54 (2H, m), 2.79-2.96 (1H, m), 3.13-3.27 (1H, m), 3.39-3.50 (1H, m), 3.55-4.18 (6H, m), 4.53-4.79 (2H, m), 6.58-6.61 (1H, m), 7.31-7.71 (5H, m)
8 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.83 (4H, m), 0.92-1.01 (2H, m), 1.01-1.13 (2H, m), 1.45-1.54 (1H, m), 1.68-2.44 (8H, m), 2.80-2.95 (1H, m), 3.12-3.29 (1H, m), 3.41-3.50 (1H, m), 3.57-4.22 (6H, m), 4.56-4.79 (2H, m), 6.68-6.76 (1H, m), 7.31-7.70 (5H, m)

표 1-23

설시 예 번호	화학식	NMR
8 9		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.82 (2H, m), 1.03-1.14 (2H, m), 1.70-1.84 (1H, m), 1.85-2.25 (12H, m), 2.25-2.42 (1H, m), 2.75-2.95 (1H, m), 3.18-4.21 (9H, m), 4.54-4.78 (2H, m), 4.87-4.97 (1H, m), 7.32-7.71 (5H, m)
9 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.85 (2H, m), 1.02-1.16 (2H, m), 1.70-1.88 (1H, m), 1.89-2.45 (6H, m), 2.83-2.96 (1H, m), 2.96-3.03 (3H, m), 3.16-3.31 (1H, m), 3.41-3.50 (0.8H, m), 3.56-4.12 (7.4H, m), 4.57-4.77 (2H, m), 5.35-5.44 (1H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.62-7.71 (1H, m)
9 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.81 (2H, m), 1.04-1.12 (2H, m), 1.62-2.44 (11H, m), 2.09 (3H, brs), 2.66-2.82 (3H, m), 3.05-3.17 (1H, m), 3.18-3.31 (1H, m), 3.39-3.50 (1H, m), 3.55-3.99 (5H, m), 4.00-4.15 (1H, m), 4.51-4.70 (2H, m), 4.71-4.84 (1H, m), 7.31-7.70 (5H, m)
9 2		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.72 (2H, m), 0.93-1.05 (2H, m), 1.67-2.02 (11H, m), 2.04-2.16 (1H, m), 2.18-2.34 (1H, m), 2.66-2.75 (3H, brs), 2.86-3.01 (2H, m), 3.09-3.32 (1H, m), 3.36-3.91 (6H, m), 3.99-4.16 (1H, m), 4.44-4.58 (2H, m), 4.63-4.80 (1H, m), 7.43-7.76 (5H, m), 10.21-10.33 (1H, m)

표 1-24

실시예 번호	화학식	NMR
9 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.84 (2H, m), 1.03-1.12 (2H, m), 1.14-1.22 (7H, m), 1.66-2.24 (6H, m), 2.27-2.54 (2H, m), 2.79-2.96 (1H, m), 3.13-3.27 (1H, m), 3.39-3.50 (1H, m), 3.55-4.18 (6H, m), 4.53-4.79 (2H, m), 6.58-6.61 (1H, m), 7.31-7.71 (5H, m)
9 4		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.57-0.73 (2H, m), 0.90-1.05 (2H, m), 1.82-2.53 (8H, m), 3.23-3.79 (6H, m), 3.81-4.24 (4H, m), 4.63-4.97 (1H, m), 7.39-7.77 (6H, m), 7.98-8.17 (1H, m), 9.99-10.27 (1H, m)
9 5		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.91-1.07 (2H, m), 1.82-2.46 (8H, m), 2.64-2.78 (3H, m), 3.21-3.99 (10H, m), 4.61-4.82 (1H, m), 7.41-7.79 (5H, m), 8.48-8.69 (1H, m), 9.99-10.24 (1H, m)
9 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.82 (2H, m), 1.02-1.18 (2H, m), 1.69 (6H, s), 1.70-1.84 (1H, m), 2.05-2.23 (3H, m), 2.29-2.46 (1H, m), 3.03-4.07 (11H, m), 5.02 (1H, brs), 5.74 (1H, brs), 7.34-7.41 (1H, m), 7.44-7.50 (1H, m), 7.51-7.60 (2H, m), 7.65-7.70 (1H, m), 9.13 (1H, brs), 11.80 (1H, brs)

[3181]

표 1-25

실시예 번호	화학식	NMR
9 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.77 (2H, m), 0.90-1.06 (2H, m), 1.83-1.98 (1H, m), 2.04-2.74 (6H, m), 3.07-3.96 (13H, m), 4.64-4.97 (1H, m), 7.20-7.85 (7H, m), 10.09-10.49 (1H, m)
9 8		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.30-0.49 (2H, m), 0.56-0.76 (4H, m), 0.88-1.05 (2H, m), 1.07-1.22 (1H, m), 1.81-1.98 (1H, m), 1.99-2.38 (6H, m), 2.88-3.04 (2H, m), 3.09-3.26 (2H, m), 3.41-3.95 (7H, m), 4.58-4.86 (1H, m), 7.34-7.85 (5H, m), 10.17-10.53 (1H, m)
9 9		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.74 (2H, m), 0.75-0.85 (2H, m), 0.93-1.04 (2H, m), 1.12-1.23 (2H, m), 1.86-2.54 (7H, m), 2.71-2.82 (1H, m), 3.28-3.92 (9H, m), 4.66-4.83 (1H, m), 7.42-7.77 (5H, m), 10.60-10.79 (1H, m)
100		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.57-0.75 (2H, m), 0.91-1.05 (2H, m), 1.82-2.53 (7H, m), 2.85-3.01 (6H, m), 3.18-4.44 (11H, m), 4.62-4.83 (1H, m), 7.41-7.78 (5H, m), 9.66-9.97 (1H, br)

표 1-26

실시예 번호	화학식	NMR
101		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.91-1.06 (2H, m), 1.84-2.00 (1H, m), 2.03-2.45 (6H, m), 3.15-3.95 (9H, m), 4.06-4.23 (2H, m), 4.63-4.83 (1H, m), 7.41-7.80 (5H, m)
102		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.91-1.06 (2H, m), 1.46-1.62 (4H, m), 1.84-2.60 (7H, m), 3.23-3.94 (7H, m), 4.16-4.32 (1H, m), 4.51-5.06 (2H, m), 7.40-7.79 (6H, m), 10.11-10.42 (1H, brs)
103		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.73 (2H, m), 0.92-1.04 (2H, m), 1.43-1.54 (3H, m), 2.00-2.58 (8H, m), 3.14-4.17 (9H, m), 4.68-4.85 (1H, m), 7.42-7.79 (6H, m), 8.08-8.20 (1H, m), 10.09 (1H, brs)
104		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.61-0.75 (2H, m), 0.94-1.06 (2H, m), 1.22-1.38 (6H, m), 1.82-2.62 (7H, m), 3.13-3.96 (11H, m), 4.69-4.95 (1H, m), 7.38-7.82 (6H, m), 9.23-9.88 (1H, m)

표 1-27

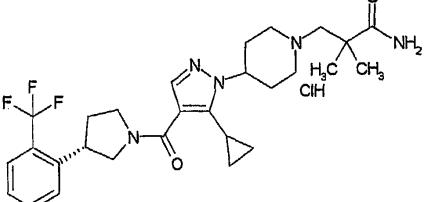
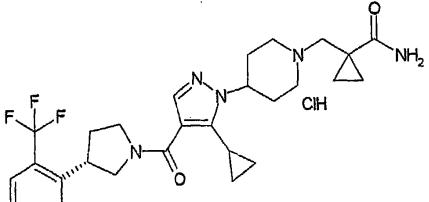
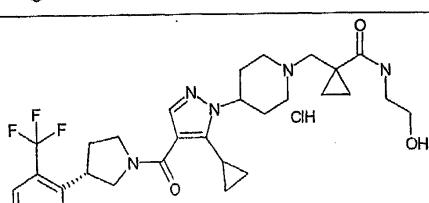
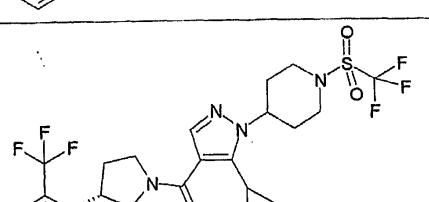
실시 예 번호	화학식	NMR
105		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.75 (2H, m), 0.93-1.06 (2H, m), 1.22-1.38 (6H, m), 1.63-1.98 (1H, m), 1.99-2.62 (6H, m), 3.14-3.94 (11H, m), 4.69-4.93 (1H, m), 7.27-7.80 (7H, m), 9.05-9.52 (1H, m)
106		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.56-0.77 (2H, m), 0.91-1.07 (2H, m), 1.15-1.39 (4H, m), 1.82-2.62 (7H, m), 3.13-4.03 (11H, m), 4.63-4.97 (1H, m), 7.06-7.32 (2H, m), 7.40-7.81 (5H, m), 9.76-10.08 (1H, m)
107		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.61-0.74 (2H, m), 0.93-1.04 (2H, m), 1.13-1.21 (2H, m), 1.25-1.34 (2H, m), 1.85-1.98 (1H, m), 2.01-2.54 (6H, m), 3.08-3.92 (16H, m), 4.64-4.84 (1H, m), 7.43-7.78 (6H, m), 9.57-9.92 (1H, m)
108		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.82 (2H, m), 1.01-1.14 (2H, m), 1.66-1.83 (1H, m), 1.94-2.44 (6H, m), 3.18-3.49 (2H, m), 3.54-4.20 (7H, m), 4.53-4.70 (1H, m), 7.28-7.72 (5H, m)

표 1-28

설시예 번호	화학식	NMR
109		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.83 (2H, m), 0.99-1.11 (2H, m), 1.68-1.83 (1H, m), 1.91-2.45 (6H, m), 3.04-3.20 (2H, m), 3.38-4.11 (9H, m), 4.47-4.66 (1H, m), 7.72-8.35 (5H, m)
110		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.88 (2H, m), 0.98-1.21 (2H, m), 1.66-1.88 (1H, m), 1.89-2.54 (9H, m), 2.94-3.17 (1H, m), 3.26-3.53 (1.5H, m), 3.54-4.21 (5.5H, m), 4.58-4.93 (2H, m), 7.29-7.75 (5H, m)
111		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-0.83 (2H, m), 0.97-1.17 (2H, m), 1.63-1.95 (3H, m), 1.96-2.24 (3H, m), 2.25-2.47 (1H, m), 2.97-3.19 (5H, m), 3.40-3.49 (0.5H, m), 3.55-4.26 (6.5H, m), 4.46-4.69 (1H, m), 5.54-5.76 (1H, m), 7.30-7.60 (4H, m), 7.61-7.73 (1H, m)
112		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.60-0.81 (2H, m), 0.98-1.16 (2H, m), 1.62-1.82 (3H, m), 1.93-2.25 (3H, m), 2.26-2.47 (1H, m), 2.90-3.08 (2H, m), 3.35-3.50 (0.5H, m), 3.53-4.09 (4.5H, m), 4.17-4.34 (2H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 5.94-6.14 (2H, m), 7.29-7.61 (4H, m), 7.62-7.74 (1H, m)

[3185]

표 1-29

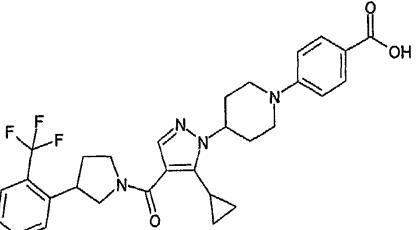
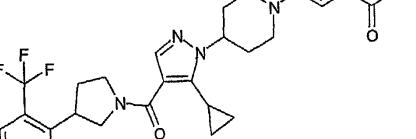
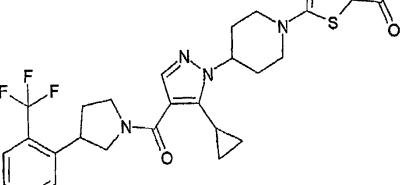
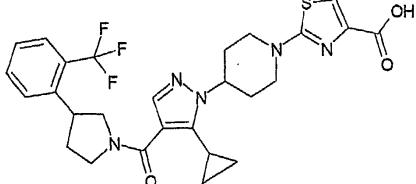
실시 예 번호	화학식	NMR
113		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.87 (2H, m), 1.03-1.18 (2H, m), 1.71-2.47 (7H, m), 3.00-3.18 (2H, m), 3.42-4.17 (7H, m), 4.56-4.75 (1H, m), 6.85-6.97 (2H, m), 7.32-7.71 (5H, m), 7.92-8.00 (2H, m)
114		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.87 (2H, m), 1.02-1.19 (2H, m), 1.74-2.50 (7H, m), 2.81-3.19 (2H, m), 3.44-4.14 (7H, m), 4.48-4.80 (1H, m), 7.07-7.85 (9H, m)
115		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.77 (2H, m), 0.92-1.08 (2H, m), 1.87-2.36 (7H, m), 3.08-3.94 (9H, m), 4.60-4.81 (1H, m), 6.16-6.29 (1H, m), 7.38-7.80 (6H, m), 12.25 (1H, bs)
116		¹ H-NMR (300MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.62-0.73 (2H, m), 0.96-1.04 (2H, m), 1.87-2.33 (7H, m), 3.18-3.32 (3H, m), 3.44-3.91 (4H, m), 3.97-4.10 (2H, m), 4.66-4.80 (1H, m), 7.41-7.60 (2H, m), 7.63-7.78 (4H, m), 12.6 (1H, brs)

표 1-30

실시예 번호	화학식	NMR
117		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.59-0.77 (2H, m), 0.93-1.08 (2H, m), 1.88-2.39 (10H, m), 3.21-4.12 (11H, m), 4.64-4.84 (1H, m), 7.41-7.80 (5H, m)
118		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.75 (2H, m), 0.89-1.09 (6H, m), 1.86-2.36 (8H, m), 3.11-4.11 (11H, m), 4.61-4.82 (1H, m), 7.41-7.80 (5H, m)
119		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.76 (2H, m), 0.92-1.08 (2H, m), 1.88-2.38 (6H, m), 3.15-4.15 (10H, m), 4.42-4.53 (2H, m), 4.63-4.82 (1H, m), 7.39-7.79 (6H, m)
120		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.77 (2H, m), 0.92-1.06 (2H, m), 1.85-2.41 (7H, m), 3.11-4.10 (9H, m), 4.31-5.07 (2H, m), 7.41-7.79 (5H, m), 13.3-13.5 (1H, m)

[3187]

표 1-31

실시 예 번호	화학식	NMR
1 2 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.72-0.87 (2H, m), 1.05-1.15 (2H, m), 1.49-2.48 (7H, m), 3.05-3.22 (2H, m), 3.40-4.14 (5H, m), 4.20-4.36 (2H, m), 4.52-4.73 (1H, m), 6.60-6.71 (1H, m), 6.94-7.16 (3H, m), 7.33-7.72 (5H, m), 8.04-8.14 (1H, m)
1 2 2		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.57-0.66 (2H, m), 0.66-0.84 (4H, m), 1.01-1.13 (2H, m), 1.32-1.45 (3H, m), 1.55-2.48 (7H, m), 2.81-3.00 (2H, m), 3.41-4.15 (5H, m), 4.44-4.63 (2H, m), 4.85-4.96 (1H, m), 7.33-7.71 (6H, m)
1 2 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.82 (2H, m), 1.02-1.13 (2H, m), 1.13-1.22 (6H, m), 1.55-2.47 (8H, m), 2.84-3.01 (2H, m), 3.41-4.34 (9H, m), 4.45-4.63 (1H, m), 7.30-7.71 (6H, m)
1 2 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.72-0.87 (2H, m), 1.04-1.17 (2H, m), 1.53-2.46 (7H, m), 3.05-3.21 (2H, m), 3.42-4.11 (5H, m), 4.20-4.35 (2H, m), 4.55-4.71 (1H, m), 6.62-6.70 (1H, m), 6.93-7.16 (3H, m), 7.33-7.72 (5H, m), 8.04-8.14 (1H, m)

[3188]

표 1-32

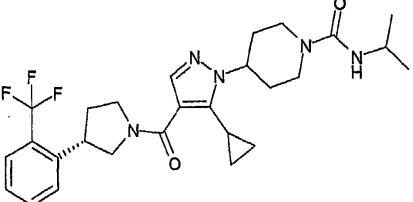
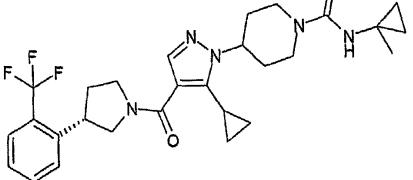
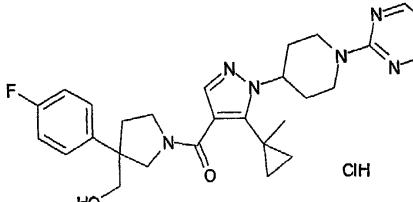
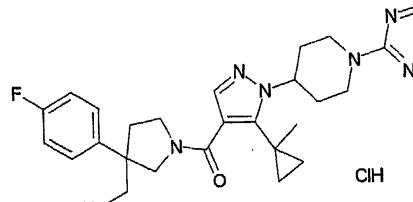
실시예 번호	화학식	NMR
1 2 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.84 (2H, m), 1.03-1.13 (2H, m), 1.13-1.21 (6H, m), 1.55-2.47 (8H, m), 2.84-3.01 (2H, m), 3.41-4.31 (9H, m), 4.45-4.63 (1H, m), 7.33-7.72 (6H, m)
1 2 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.58-0.66 (2H, m), 0.66-0.83 (4H, m), 1.02-1.11 (2H, m), 1.36-1.43 (3H, m), 1.53-2.46 (7H, m), 2.83-2.99 (2H, m), 3.41-4.15 (5H, m), 4.45-4.61 (2H, m), 4.85-4.92 (1H, m), 7.32-7.72 (6H, m)
1 2 7		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.56-0.86 (4H, m), 1.32-1.43 (3H, m), 1.85-2.12 (6H, m), 2.28-2.39 (1H, m), 3.09-3.26 (2H, m), 3.31-4.94 (6H, m), 4.74-4.91 (3H, m), 6.30 (1H, bs), 6.69-6.75 (1H, m), 7.07-7.37 (4H, m), 7.53-7.62 (1H, m), 8.40-8.50 (2H, m)
1 2 8		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.56-0.88 (4H, m), 1.32-1.48 (3H, m), 1.85-2.12 (6H, m), 2.28-2.39 (1H, m), 3.09-3.24 (2H, m), 3.30-4.95 (6H, m), 4.73-4.93 (3H, m), 5.81 (1H, bs), 6.64-6.73 (1H, m), 7.06-7.40 (4H, m), 7.50-7.67 (1H, m), 8.39-8.49 (2H, m)

표 1-33

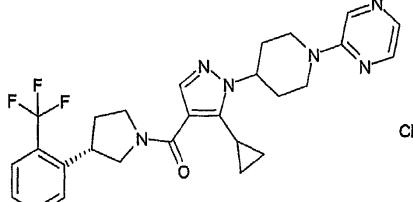
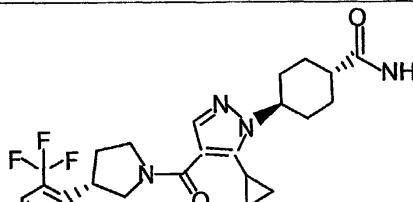
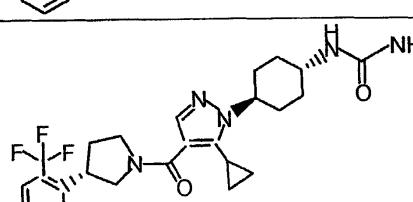
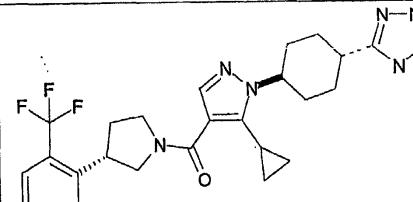
설시 예 번호	화학식	NMR
1 2 9	 ClH	¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.66-0.69 (2H, m), 0.99-1.01 (2H, m), 1.91-2.33 (7H, m), 3.11-3.14 (2H, m), 3.46-3.89 (5H, m), 4.49-4.52 (2H, m), 4.75-4.77 (1H, m), 7.48-7.74 (6H, m), 7.85-7.90 (1H, m), 8.17 (1H, brs), 8.43-8.45 (1H, m)
1 3 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.79 (2H, m), 0.94-1.10 (2H, m), 1.63-2.44 (12H, m), 3.38-4.10 (5H, m), 4.32-4.51 (1H, m), 5.33 (1H, br), 5.51 (1H, br), 7.27-7.70 (5H, m)
1 3 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-0.82 (2H, m), 0.95-1.10 (2H, m), 1.23-1.39 (2H, m), 1.65-2.45 (8H, m), 3.40-4.10 (6H, m), 4.26-4.60 (4H, m), 7.27-7.71 (6H, m)
1 3 2		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.79 (2H, m), 0.84-0.92 (2H, m), 1.06-1.15 (2H, m), 1.22-1.35 (3H, m), 1.73-2.49 (8H, m), 3.05-3.19 (1H, m), 3.39-3.55 (1H, m), 3.61-4.17 (3H, m), 4.46-4.61 (1H, m), 7.33-7.71 (5H, m)

표 1-34

실시예 번호	화학식	NMR
1 3 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.95 (4H, m), 1.38-1.47 (3H, m), 1.61-1.88 (2H, m), 1.99-2.29 (3H, m), 2.34-2.50 (1H, m), 2.94-3.12 (2H, m), 3.36-4.18 (5H, m), 4.25-4.40 (2H, m), 4.54-4.72 (1H, m), 6.99-7.33 (2H, m), 7.44-7.65 (6H, m), 8.44-8.61 (2H, m)
1 3 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.89-1.05 (2H, m), 1.22-1.34 (2H, m), 1.94-2.44 (6H, m), 3.05-3.21 (2H, m), 3.28-3.39 (3H, m), 3.42-4.11 (5H, m), 4.20-4.35 (2H, m), 4.77-4.93 (1H, m), 6.62-6.71 (1H, m), 6.93-7.18 (3H, m), 7.32-7.72 (5H, m), 8.05-8.14 (1H, m)
1 3 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.57-0.95 (4H, m), 1.34-1.54 (3H, m), 1.83-2.08 (2H, m), 2.18-2.41 (2H, m), 2.45-2.61 (1H, m), 2.73-2.92 (1H, m), 3.02-3.24 (2H, m), 3.51-4.86 (7H, m), 6.60-6.78 (1H, m), 6.93-7.18 (3H, m), 7.20-7.46 (5H, m), 7.46-7.57 (1H, m), 8.01-8.15 (1H, m)
1 3 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.81 (2H, m), 1.00-1.14 (2H, m), 1.71-1.85 (1H, m), 1.93-2.43 (6H, m), 3.05-3.19 (2H, m), 3.40-4.10 (5H, m), 4.20-4.33 (2H, m), 4.55-4.69 (1H, m), 6.48-6.57 (1H, m), 6.81-6.92 (2H, m), 7.17-7.45 (4H, m), 7.50-7.60 (1H, m), 7.94-8.03 (1H, m)

표 1-35

실시예 번호	화학식	NMR
1 3 7		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.83 (2H, m), 1.01-1.14 (2H, m), 1.75-1.86 (1H, m), 1.94-2.36 (6H, m), 2.37-2.49 (1H, m), 3.07-3.20 (2H, m), 3.40-4.14 (4H, m), 4.22-4.34 (2H, m), 4.57-4.71 (1H, m), 6.61-6.70 (1H, m), 6.93-7.03 (1H, m), 7.03-7.17 (3H, m), 7.51-7.70 (2H, m), 8.02-8.15 (1H, m), 8.28-8.37 (1H, brs)
1 3 8		¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 0.94 (6H, s), 1.33 (6H, s), 2.03-2.11 (4H, m), 2.36-2.39 (2H, m), 3.07-3.09 (2H, m), 3.37-3.76 (4H, m), 3.89-3.96 (1H, m), 4.28-4.32 (4H, m), 6.65 (1H, s), 7.01-7.08 (3H, m), 7.24-7.32 (1H, m), 7.53-7.63 (2H, m), 8.07-8.09 (1H, m), 8.53-8.57 (2H, m)
1 3 9		¹ H-NMR (300MHz, CDCl ₃) δ: 1.25-1.48 (3H, m), 1.69-2.48 (13H, m), 2.85-3.19 (3H, m), 3.33-4.41 (8H, m), 6.59-6.69 (1H, m), 6.89-7.14 (3H, m), 7.23-7.36 (1H, m), 7.43-7.68 (2H, m), 8.05 (1H, t, J = 8.1 Hz), 8.44-8.59 (2H, m)
1 4 0		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.83 (2H, m), 1.01-1.15 (2H, m), 1.72-1.86 (1H, m), 1.92-2.43 (6H, m), 3.03-3.20 (2H, m), 3.36-4.11 (5H, m), 4.20-4.34 (2H, m), 4.55-4.71 (1H, m), 6.66 (1H, br s), 6.93-7.16 (3H, m), 7.20-7.42 (4H, m), 7.48-7.63 (1H, m), 8.03-8.14 (1H, m)

표 1-36

실시예 번호	화학식	NMR
1 4 1		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.66-0.80 (2H, m), 1.00-1.12 (2H, m), 1.58-1.82 (3H, m), 1.97-2.23 (3H, m), 2.27-2.47 (1H, m), 2.90-3.06 (2H, m), 3.40-4.11 (5H, m), 4.24-4.41 (2H, m), 4.46-4.62 (1H, m), 7.32-7.73 (10H, m)
1 4 2		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.57-0.74 (2H, m), 0.81-1.03 (8H, m), 1.79-2.36 (8H, m), 2.82-2.90 (8H, m), 3.44-3.92 (9H, m), 4.50-4.70 (1H, s), 7.42-7.53 (2H, m), 7.55-7.61 (1H, m), 7.66-7.78 (2H, m)
1 4 3		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-0.84 (2H, m), 0.91-1.17 (2H, m), 1.67-1.88 (1H, m), 1.91-2.08 (2H, m), 2.14-2.42 (2.5H, m), 2.43-2.56 (0.5H, m), 2.57-2.72 (1H, m), 2.88-3.21 (5H, m), 3.45-3.61 (0.6H, m), 3.64-3.91 (2H, m), 3.98-4.13 (1H, m), 4.19-4.36 (2.4H, m), 4.53-4.72 (1H, m), 6.63-6.79 (1H, m), 6.89-7.18 (3H, m), 7.40-7.64 (4H, m), 7.75-7.93 (1H, m), 8.00-8.13 (1H, m)
1 4 4		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.97 (2H, m), 0.97-1.35 (2H, m), 1.85-2.54 (6H, m), 2.87-3.21 (2H, m), 3.21-4.14 (7H, m), 4.16-4.46 (2H, m), 4.51-4.79 (1H, m), 5.98-6.35 (1H, m), 6.56-6.78 (1H, m), 6.85-7.20 (3H, m), 7.20-7.79 (5H, m), 7.95-8.16 (1H, m)

표 1-37

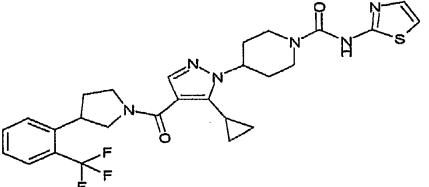
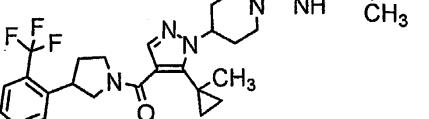
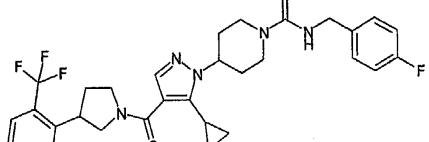
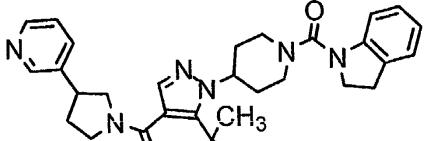
설시예 번호	화학식	NMR
1 4 5		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.84 (2H, m), 1.01-1.16 (2H, m), 1.68-1.85 (1H, m), 1.88-2.46 (6H, m), 3.02-3.19 (2H, m), 3.40-4.11 (5H, m), 4.24-4.41 (2H, m), 4.53-4.71 (1H, m), 6.82-6.91 (1H, m), 7.30-7.72 (7H, m)
1 4 6		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.99 (4H, m), 1.15-1.31 (6H, m), 1.35-1.52 (3H, m), 1.73-1.98 (2H, m), 1.98-2.47 (4H, m), 2.86-3.08 (2H, m), 3.42-4.11 (6H, m), 4.12-4.31 (2H, m), 4.53-4.72 (1H, m), 7.08-7.21 (1H, m), 7.30-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.61-7.74 (1H, m)
1 4 7		¹ H-NMR (300MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.81 (2H, m), 0.96-1.13 (2H, m), 1.55-1.93 (3H, m), 1.95-2.44 (4H, m), 2.84-3.02 (2H, m), 3.36-4.22 (7H, m), 4.30-4.41 (2H, m), 4.43-4.62 (1H, m), 4.83-4.99 (1H, m), 6.91-7.05 (2H, m), 7.17-7.71 (7H, m)
1 4 8		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.73-0.84 (2H, m), 0.85-0.96 (2H, m), 1.45 (3H, s), 1.84-1.97 (2H, m), 2.01-2.20 (1H, m), 2.26-2.49 (3H, m), 2.97-3.12 (4H, m), 3.37-4.19 (9H, m), 4.61-4.75 (1H, m), 6.86-6.95 (1H, m), 7.08-7.22 (3H, m), 7.25-7.33 (1H, m), 7.48-7.65 (2H, m), 8.46-8.63 (2H, m)

표 1-38

실시예 번호	화학식	NMR
149		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.82 (2H, m), 0.82-0.96 (2H, m), 1.42 (3H, s), 1.79-1.97 (2H, m), 1.98-2.19 (4H, m), 2.93-3.08 (2H, m), 3.33-3.82 (5.5H, m), 3.84-4.01 (1H, m), 4.04-4.23 (2.5H, m), 4.26-4.40 (2H, m), 4.55-4.73 (1H, m), 6.81-6.97 (3H, m), 7.11-7.22 (1H, m), 7.23-7.35 (1H, m), 7.46-7.67 (2H, m), 8.44-8.62 (2H, m)
150		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.85 (2H, m), 1.02-1.18 (2H, m), 1.72-1.87 (1H, m), 1.94-2.46 (6H, m), 3.08-3.26 (2H, m), 3.41-4.11 (5H, m), 4.18-4.33 (2H, m), 4.57-4.75 (1H, m), 6.97-7.07 (1H, m), 7.23-7.61 (5H, m), 7.64-7.72 (1H, m), 8.53-8.60 (1H, m)
151		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.89 (4H, m), 1.36 (3H, s), 1.55-1.83 (6H, m), 1.89-2.17 (3H, m), 2.32-2.47 (1H, m), 2.59-2.82 (4H, m), 3.33-4.18 (9H, m), 4.38-4.52 (1H, m), 7.03-7.14 (2H, m), 7.16-7.32 (3H, m), 7.43-7.64 (2H, m), 8.44-8.61 (2H, m)
152		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.85 (2H, m), 1.03-1.16 (2H, m), 1.33-1.42 (3H, m), 1.73-1.88 (1H, m), 1.93-2.22 (3H, m), 2.25-2.45 (3H, m), 2.96-3.13 (2H, m), 3.41-4.11 (7H, m), 4.28-4.39 (2H, m), 4.52-4.71 (1H, m), 6.85-6.96 (2H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.63-7.71 (1H, m), 7.89-7.99 (2H, m)

[3195]

표 1-39

설시 예 번호	화학식	NMR
153		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.79 (2H, m), 1.00-1.09 (2H, m), 1.70-1.97 (3H, m), 2.00-2.26 (3H, m), 2.31-2.47 (1H, m), 2.86-3.05 (2H, m), 3.35-3.53 (1.5H, m), 3.56-3.77 (2H, m), 3.84-3.94 (1H, m), 4.08-4.16 (0.5H, m), 4.25-4.61 (3H, m), 5.14 (2H, s), 7.23-7.40 (8H, m), 7.49-7.61 (2H, m), 8.47-8.57 (2H, m)
154		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.86 (2H, m), 0.98-1.18 (2H, m), 1.23-1.41 (6H, m), 1.67-1.86 (1H, m), 1.87-2.47 (6H, m), 2.52-2.88 (3H, m), 3.06-3.32 (1H, m), 3.35-4.15 (6H, m), 4.49-4.85 (2H, m), 7.28-7.73 (5H, m)
155		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-0.83 (2H, m), 0.97-1.14 (2H, m), 1.66-2.50 (8H, m), 2.78-2.95 (1H, m), 3.16-3.34 (1H, m), 3.37-3.54 (1H, m), 3.57-3.79 (2H, m), 3.83-3.97 (1H, m), 4.09-4.29 (1H, m), 4.54-4.80 (4H, m), 6.89-7.04 (3H, m), 7.21-7.38 (3H, m), 7.48-7.68 (2H, m), 8.42-8.70 (2H, m)
156		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.82 (2H, m), 1.00-1.13 (2H, m), 1.67-2.30 (9H, m), 2.32-2.51 (1H, m), 2.72-3.34 (2H, m), 3.36-4.03 (4H, m), 4.56-4.99 (1H, m), 7.20-7.46 (5H, m), 7.49-7.65 (2H, m), 8.42-8.62 (2H, m)

표 1-40

실시 예 번호	화학식	NMR
157		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.85 (2H, m), 0.98-1.13 (2H, m), 1.57-1.92 (3H, m), 1.96-2.50 (5H, m), 2.90-3.54 (3H, m), 3.56-3.81 (3H, m), 3.83-3.98 (1H, m), 4.53-4.73 (1H, m), 4.85-5.04 (1H, m), 7.21-7.47 (5H, m), 7.49-7.65 (2H, m), 8.45-8.62 (2H, m)
158		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.62-1.19 (4H, m), 1.62-2.53 (7H, m), 2.70-2.92 (1H, m), 3.08-3.29 (1H, m), 3.33-4.21 (6H, m), 4.51-4.75 (2H, m), 7.31-7.62 (4H, m), 7.63-7.73 (1H, m)
159		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.82 (2H, m), 0.98-1.12 (2H, m), 1.65-2.32 (9H, m), 2.34-2.50 (1H, m), 3.08 (2H, brs), 3.34-4.00 (4H, m), 4.56-4.95 (1H, m), 7.23-7.32 (1H, m), 7.35-7.44 (4H, m), 7.48-7.65 (2H, m), 8.45-8.61 (2H, m)
160		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.59-0.83 (2H, m), 0.95-1.14 (2H, m), 1.62-2.20 (6H, m), 2.30-2.50 (1H, m), 2.69-2.91 (1H, m), 3.06-3.27 (1H, m), 3.33-4.20 (6H, m), 3.73 (2H, s), 4.50-4.66 (1H, m), 4.71-4.85 (1H, m), 6.93-7.10 (2H, m), 7.15-7.34 (3H, m), 7.45-7.64 (2H, m), 8.41-8.62 (2H, m)

표 1-41

실시예 번호	화학식	NMR
161		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.65-0.81 (2H, m), 0.99-1.13 (2H, m), 1.72-2.50 (9H, m), 2.85-3.33 (2H, m), 3.35-3.78 (3H, m), 3.81-4.96 (3H, m), 7.22-7.33 (1H, m), 7.47-7.77 (6H, m), 8.44-8.63 (2H, m)
162		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.64-0.82 (2H, m), 1.00-1.12 (2H, m), 1.71-2.32 (8H, m), 2.33-2.51 (1H, m), 2.85-3.28 (2H, m), 3.32-4.05 (5H, m), 3.83 (3H, s), 4.57-4.99 (1H, m), 6.90-7.04 (3H, m), 7.24-7.38 (2H, m), 7.50-7.69 (2H, m), 8.53 (2H, brs)
163		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.68-0.86 (4H, m), 1.29-1.38 (3H, m), 1.99-2.17 (2H, m), 2.18-2.66 (5H, m), 3.14-3.32 (2H, m), 3.39-4.50 (8H, m), 4.68-4.83 (1H, m), 7.30-7.40 (2H, m), 7.43-7.53 (1H, m), 7.60-7.82 (6H, m), 10.55-10.76 (1H, m)
164		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.59-0.74 (2H, m), 0.93-1.04 (2H, m), 1.61-1.73 (1H, m), 1.88-2.16 (3H, m), 2.25-2.59 (5H, m), 3.34-3.76 (3.5H, m), 3.83-4.01 (3H, m), 4.08-4.15 (0.5H, m), 4.27-4.39 (1H, m), 7.23-7.31 (1H, m), 7.49-7.67 (5H, m), 7.79-7.84 (2H, m), 8.46-8.58 (2H, m)

표 1-42

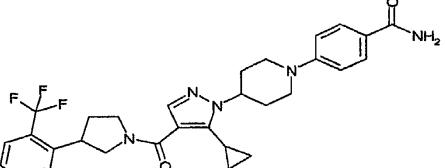
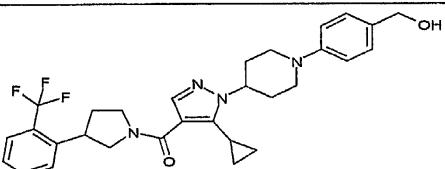
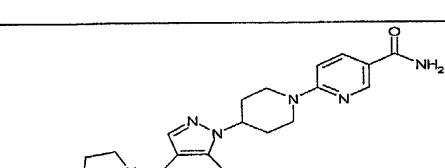
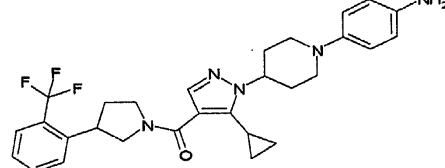
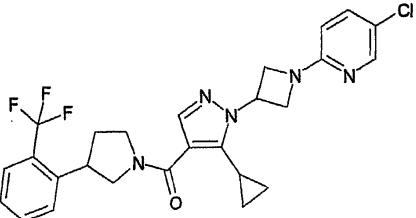
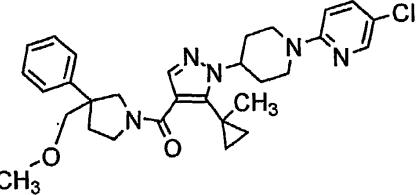
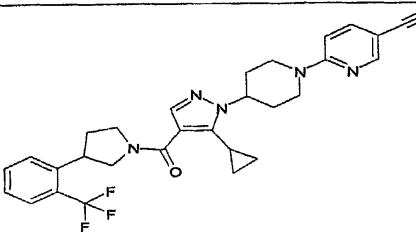
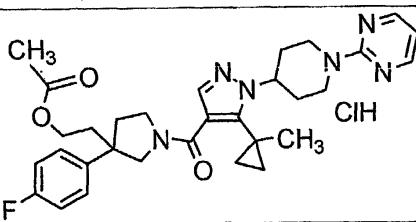
실시예 번호	화학식	NMR
165		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.86 (2H, m), 1.00-1.19 (2H, m), 1.73-1.88 (1H, m), 1.92-2.21 (3H, m), 2.24-2.47 (3H, m), 2.92-3.12 (2H, m), 3.40-4.12 (7H, m), 4.51-4.69 (1H, m), 5.74 (2H, br s), 6.87-6.99 (2H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.41-7.61 (3H, m), 7.63-7.78 (3H, m)
166		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.85 (2H, m), 1.01-1.16 (2H, m), 1.51-1.67 (1H, m), 1.75-1.89 (1H, m), 1.91-2.23 (3H, m), 2.26-2.49 (3H, m), 2.83-3.00 (2H, m), 3.40-4.12 (7H, m), 4.44-4.68 (3H, m), 6.88-7.04 (2H, m), 7.23-7.31 (2H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.62 (3H, m), 7.63-7.72 (1H, m)
167		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.73-0.89 (2H, m), 1.06-1.12 (2H, m), 1.76-1.88 (1H, m), 1.94-2.08 (2H, m), 2.11-2.44 (5H, m), 3.05-3.19 (2H, m), 3.42-3.51 (0.5H, m), 3.59-4.10 (3.5H, m), 4.56-4.78 (3H, m), 5.40-5.94 (2H, brs), 6.67-6.74 (1H, m), 7.12-7.22 (1H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.41-7.60 (2H, m), 7.64-7.73 (1H, m), 7.91-7.99 (1H, m), 8.56-8.63 (1H, m)
168		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.85 (2H, m), 1.02-1.14 (2H, m), 1.73-1.88 (1H, m), 1.90-2.22 (3H, m), 2.27-2.51 (3H, m), 2.71-2.88 (2H, m), 3.35-4.11 (9H, m), 4.38-4.56 (1H, m), 6.60-6.71 (2H, m), 6.78-6.91 (2H, m), 7.31-7.40 (1H, m), 7.41-7.62 (3H, m), 7.63-7.71 (1H, m)

표 1-43

설정 예 번호	화학식	NMR
169		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.71-0.88 (2H, m), 1.02-1.16 (2H, m), 1.73-1.88 (1H, m), 1.91-2.19 (3H, m), 2.27-2.50 (3H, m), 2.81-3.00 (2H, m), 3.40-4.17 (9H, m), 4.39-4.63 (3H, m), 6.92-7.04 (2H, m), 7.31-7.72 (7H, m)
170		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.86 (2H, m), 1.01-1.16 (2H, m), 1.72-1.88 (1H, m), 1.91-2.23 (3H, m), 2.26-2.51 (3H, m), 2.76-2.98 (2H, m), 3.42-4.11 (10H, m), 4.42-4.62 (1H, m), 6.89-7.00 (2H, m), 7.16 (1H, s), 7.31-7.73 (8H, m)
171		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.86 (2H, m), 1.00-1.16 (2H, m), 1.72-1.88 (1H, m), 1.92-2.23 (3H, m), 2.26-2.48 (3H, m), 2.84-3.02 (5H, m), 3.38-4.12 (7H, m), 4.45-4.65 (1H, m), 6.25-6.38 (1H, m), 6.88-6.99 (2H, m), 7.11-7.22 (2H, m), 7.32-7.40 (1H, m), 7.41-7.62 (3H, m), 7.63-7.71 (1H, m)
172		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-1.01 (4H, m), 1.16-1.35 (3H, m), 1.35-1.53 (3H, m), 1.71-1.97 (2H, m), 1.97-2.49 (4H, m), 2.86-3.09 (2H, m), 3.41-4.31 (9H, m), 4.53-4.75 (1H, m), 7.17-7.30 (1H, m), 7.30-7.40 (1H, m), 7.41-7.60 (3H, m), 7.61-7.74 (1H, m)

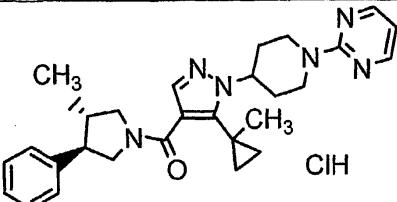
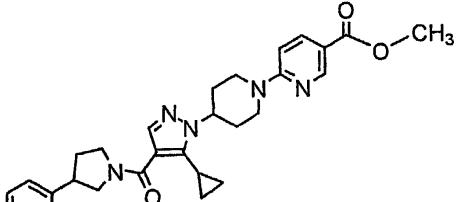
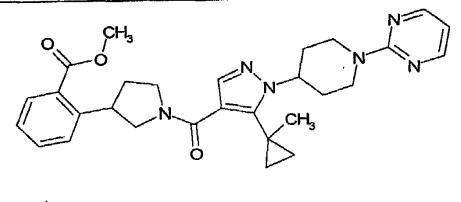
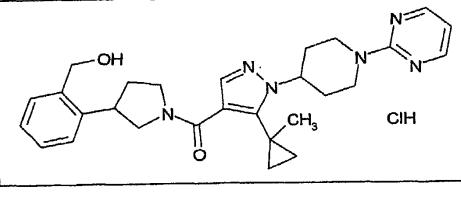
[3200]

표 1-44

설시 예 번호	화학식	NMR
173		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.61-0.87 (2H, m), 1.00-1.19 (2H, m), 1.57-1.87 (1H, m), 1.93-2.25 (1H, m), 2.25-2.48 (1H, m), 3.31-4.15 (5H, m), 4.35-4.59 (4H, m), 5.44-5.66 (1H, m), 6.26-6.40 (1H, m), 7.30-7.76 (6H, m), 8.02-8.17 (1H, m)
174		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.69-0.93 (4H, m), 1.41-1.52 (3H, m), 1.83-2.01 (2H, m), 2.13-2.51 (4H, m), 2.97-3.11 (2H, m), 3.16-4.12 (9H, m), 4.41-4.54 (2H, m), 4.65-4.78 (1H, m), 6.62-6.71 (1H, m), 7.12-7.55 (7H, m), 8.10-8.16 (1H, m)
175		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.72-0.85 (2H, m), 1.04-1.16 (2H, m), 1.73-1.88 (1H, m), 1.94-2.09 (2H, m), 2.10-2.45 (5H, m), 3.07-3.22 (2H, m), 3.42-3.51 (0.5H, m), 3.57-4.10 (3.5H, m), 4.52-4.80 (3H, m), 6.62-6.71 (1H, m), 7.32-7.41 (1H, m), 7.41-7.72 (5H, m), 8.38-8.45 (1H, m)
176		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.46-0.86 (4H, m), 1.07-1.24 (2H, m), 1.27-1.41 (3H, m), 1.73-2.07 (7H, m), 2.15-2.30 (2H, m), 3.06-4.08 (8H, m), 4.72-4.88 (3H, m), 6.66-6.74 (1H, m), 7.08-7.61 (5H, m), 8.38-8.48 (2H, m)

[3201]

표 1-45

실시예 번호	화학식	NMR
177		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.70-0.97 (7H, m), 1.35-1.42 (3H, m), 1.86-2.03 (4H, m), 2.25-2.46 (1H, m), 2.84-2.95 (1H, m), 3.07-3.24 (3H, m), 3.39-3.57 (1H, m), 3.67-3.77 (1H, m), 3.81-3.94 (1H, m), 4.75-4.88 (3H, m), 6.64-6.72 (1H, m), 7.20-7.41 (5H, m), 7.53-7.61 (1H, m), 8.39-8.44 (2H, m)
178		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.74-0.86 (2H, m), 1.05-1.15 (2H, m), 1.76-1.88 (1H, m), 1.93-2.09 (3H, m), 2.11-2.46 (4H, m), 3.04-3.19 (2H, m), 3.43-3.51 (0.5H, m), 3.59-4.09 (3.5H, m), 3.84-3.91 (3H, s), 4.58-4.78 (3H, m), 6.61-6.71 (1H, m), 7.32-7.61 (3.5H, m), 7.63-7.71 (1H, m), 7.98-8.08 (1.5H, m), 8.77-8.83 (1H, m)
179		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.77-0.98 (4H, m), 1.44-1.53 (3H, m), 1.86-2.46 (6H, m), 2.99-3.15 (2H, m), 3.45-4.06 (7H, m), 4.18-4.41 (1H, m), 4.68-4.85 (1H, m), 4.94-5.09 (2H, m), 6.48-6.55 (1H, m), 7.26-7.56 (4H, m), 7.82-7.92 (1H, m), 8.31-8.37 (2H, m)
180		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.67-0.91 (4H, m), 1.29-1.44 (3H, m), 1.74-2.34 (7H, m), 3.02-4.18 (7H, m), 4.47-4.69 (2H, m), 4.77-4.91 (3H, m), 6.60-6.71 (1H, m), 7.14-7.69 (5H, m), 8.34-8.46 (2H, m)

[3202]

표 1-46

설시예 번호	화학식	NMR
181		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.77 (2H, m), 0.99-1.15 (2H, m), 1.75-1.89 (1H, m), 1.92-2.05 (2H, m), 2.18-2.53 (4H, m), 2.96-3.09 (2H, m), 3.68-3.85 (2H, m), 3.87-4.04 (2H, m), 4.44-4.56 (2H, m), 4.58-4.72 (1H, m), 6.58-6.67 (1H, m), 6.68-6.76 (1H, m), 7.29-7.39 (1H, m), 7.45-7.53 (2H, m), 7.75-7.88 (1H, m), 8.17-8.23 (1H, m), 8.54-8.62 (1H, m), 8.69-8.83 (1H, m)
182		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.83 (2H, m), 1.01-1.15 (2H, m), 1.69-1.88 (1H, m), 1.90-2.21 (6H, m), 2.26-2.50 (3H, m), 2.77-3.00 (2H, m), 3.41-4.11 (7H, m), 4.40-4.62 (1H, m), 6.85-6.97 (2H, m), 7.31-7.71 (7H, m)
183		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.60-0.75 (2H, m), 0.94-1.06 (2H, m), 1.88-2.34 (7H, m), 2.79-2.98 (2H, m), 3.44-3.93 (7H, m), 4.50-4.68 (1H, m), 6.89-7.03 (1H, m), 7.43-7.80 (7H, m)
184		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.70-0.86 (2H, m), 1.05-1.16 (2H, m), 1.77-1.88 (1H, m), 1.94-2.53 (6H, m), 3.06-3.22 (2H, m), 3.45-4.16 (5H, m), 4.21-4.35 (2H, m), 4.57-4.73 (1H, m), 6.67 (1H, s), 6.95-7.17 (3H, m), 7.35-7.73 (5H, m), 8.05-8.13 (1H, m)

표 1-47

실시 예 번호	화학식	NMR
185		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.58-0.88 (4H, m), 1.29-1.44 (3H, m), 1.94-2.21 (5H, m), 2.28-2.41 (1H, m), 3.27-3.93 (8H, m), 3.95-4.05 (3H, m), 4.58-4.97 (3H, m), 5.42-6.26 (1H, m), 6.37-6.50 (1H, m), 7.14-7.41 (5H, m), 7.53-7.68 (1H, m), 8.11-8.23 (1H, m)
186		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.55-0.85 (4H, m), 1.32-1.41 (3H, m), 1.84-2.40 (7H, m), 3.06-3.23 (2H, m), 3.29-3.90 (5H, m), 4.72-4.88 (3H, m), 4.89-5.35 (2H, m), 6.66-6.72 (1H, m), 6.91-7.64 (4H, m), 8.39-8.44 (2H, m)
187		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.68-0.85 (2H, m), 1.01-1.13 (2H, m), 1.57-1.88 (2H, m), 1.93-2.20 (1H, m), 2.33-2.56 (3H, m), 2.94-3.07 (2H, m), 3.35-3.82 (4H, m), 3.86-4.21 (4H, m), 4.52-4.66 (1H, m), 6.82-6.88 (1H, m), 7.24-32 (3H, m), 7.55-7.64 (3H, m), 8.15-8.22 (1H, m), 8.47-8.61 (1H, m)
188		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.67-0.78 (2H, m), 0.96-1.11 (2H, m), 1.71-1.85 (1H, m), 1.92-2.09 (3H, m), 2.16-2.57 (4H, m), 3.04-3.21 (2H, m), 3.55-4.00 (4H, m), 4.19-4.34 (2H, m), 4.54-4.68 (1H, m), 6.61-6.70 (1H, m), 6.91-7.15 (3H, m), 7.23-7.31 (1H, m), 7.51-7.58 (1H, m), 7.67-7.76 (1H, m), 8.03-8.12 (1H, m)

[3204]

표 1-48

실시예 번호	화학식	NMR
189		¹ H-NMR (400MHz, DMSO-D ₆) δ: 0.53-0.69 (2H, m), 0.71-0.88 (2H, m), 0.91-1.11 (6H, m), 1.43-2.39 (10H, m), 2.62-2.82 (2H, m), 2.92-3.06 (3H, m), 3.42-3.92 (6H, m), 4.10-4.74 (2H, m), 7.39-7.59 (2H, m), 7.63-7.81 (2H, m)
190		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.73-0.97 (4H, m), 1.36-1.51 (3H, m), 1.77-1.95 (2H, m), 1.97-2.26 (7H, m), 2.29-2.49 (2H, m), 3.47-4.11 (5H, m), 4.46-4.64 (1H, m), 7.00-7.20 (3H, m), 7.32-7.72 (6H, m), 8.29-8.42 (1H, m)
191		¹ H-NMR (400MHz, CDCl ₃) δ: 0.73-0.97 (4H, m), 1.38-1.49 (3H, m), 1.60-1.76 (1H, m), 1.77-1.90 (2H, m), 1.93-2.18 (2H, m), 2.19-2.56 (5H, m), 2.70-2.81 (1H, m), 3.47-4.09 (5H, m), 4.42-4.61 (1H, m), 7.31-7.72 (5H, m)

[3205]

[3206] 이어서, 본 발명을 이하의 제제예에 의해 구체적으로 설명한다. 그러나, 본 발명은 이를 제제예에 의해 한정되지 않는다.

[3207] 제제예 1(캡슐의 제조)

[3208] 1) 실시예 1의 화합물 30 mg

[3209] 2) 미분말 셀룰로오스 10 mg

[3210] 3) 젖당 19 mg

[3211] 4) 스테아르산마그네슘 1 mg

[3212] 1), 2), 3) 및 4)를 혼합하여, 젤라틴 캡슐에 충전한다.

[3213] 제제예 2(정제의 제조)

[3214] 1) 실시예 1의 화합물 30 g

[3215] 2) 젖당 50 g

[3216] 3) 옥수수 전분 15 g

[3217] 4) 카르복시메틸셀룰로오스칼슘 44 g

[3218] 5) 스테아르산마그네슘 1 g

[3219] 1), 2), 3)의 전량 및 30 g의 4)를 물로 연합(練合)하고, 진공 건조한 후, 정립을 행한다. 이 정립 분말에 14 g의 4) 및 1 g의 5)를 혼합하고, 타정기에 의해 타정한다. 이와 같이 하여, 1정당 실시예 1의 화합물 30 mg을 함유하는 정제1000정을 얻는다.

[3220] 실시예 2 내지 191의 화합물에 대해서도, 상기 제제예 1 또는 제제예 2와 동일하게 하여 캡슐 또는 정제를 제조할 수 있다.

[3221] 시험예 1: 시험관 내에서의 HSD-1(히드록시스테로이드 데히드로게나제 1) 활성 저해 작용

[3222] HSD-1 활성 저해 작용은, 바큐로 바이러스의 시스템을 사용하여 발현시킨 인간 HSD-1(이하 재조합 HSD-1)을 효

소원으로서 코르티손으로부터 코르티솔로의 변환 억제 작용을 SPA(섬광 근접 분석법) 시스템으로 정량함으로써 행하였다. 반응은 96 웰 플레이트(96 웰 옵티-플레이츠(Opti-plates)TM-96(패커드(Packard))에 최종적으로 이하의 농도가 되도록 시약을 첨가하고, 100 μl 의 용량으로 실온에서 90 내지 120분간 행하였다. 반응액은, 5-100 ng/웰 재조합 HSD-1, 500 μM NADPH, 10 nM ^3H 코르티손(아메리칸 라디오라벨드 케미칼스(American Radiolabeled Chemicals Inc.), 50 Ci/mmol)을 0.1 % BSA(시그마(Sigma)) 함유 PBS에 용해시킨 것을 사용하고, 피검 물질은 2 μl 의 화합물 용액(DMSO에 용해시킨 것)을 사용하였다. 반응 후, 0.2 μg 의 항코르티솔 마우스 모노 클로날 항체(이스트 코스트 바이올로직스(East Coast Biologics)), 500 μg 항마우스 항체 결합 PVT SPA 비드(아머샴 바이오사이언스(Amersham Biosciences)), 133 μM 의 카르베녹솔론(시그마)을 포함하는 PBS(0.1 % BSA(시그마) 함유) 50 μl 를 반응액에 첨가함으로써, 반응을 종료시켰다. 반응 종료 후 실온에서 2시간 이상 배양하고, 탑카운트(패커드)로 방사 활성을 측정하였다. 컨트롤은, 피검 물질 대신에 2 μl 의 DMSO를 첨가한 웰의 값(0 % 저해), 포지티브 컨트롤은, 피검 물질 대신에 최종 농도 100 μM 에서 카르베녹솔론을 첨가한 웰의 값(100 % 저해)을 이용하였다. 피검 물질의 저해율(%)은, ((컨트롤의 값-피검 물질의 값)/(컨트롤값-포지티브 컨트롤값)) $\times 100$ (%)에 의해 산출하였다. IC₅₀값은, 50 % 저해를 사이에 두는 2점의 저해값으로부터 산출하였다. 얻어진 결과를 이하의 표 2-1 내지 표 2-3에 나타낸다.

표 2-1

실시 예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))	실시 예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))
2	++	4 1	++
3	++	4 2	++
4	++	4 3	++
6	++	4 4	++
7	++	4 5	++
8	++	4 7	++
9	++	4 8	++
10	++	4 9	++
11	++	5 0	++
12	++	5 1	++
13	++	5 2	++
14	++	5 3	++
15	++	5 4	++
16	++	5 5	++
17	++	5 6	++
18	++	5 7	++
19	++	5 8	++
20	++	5 9	++
21	++	6 0	++
22	++	6 1	++
23	++	6 3	++
24	++	6 4	++
25	++	6 5	++
26	++	6 6	++
27	++	6 7	++
28	++	6 8	++
29	++	6 9	++
30	++	7 1	++
31	++	7 2	++
32	++	7 3	++
33	++	7 4	++
34	++	7 5	++
35	++	7 6	++
36	++	7 7	++
37	++	7 8	++
39	++	7 9	++
40	++	8 0	++

표 2-2

설시예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))	설시예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))
8 3	++	1 3 0	++
8 4	++	1 3 1	++
8 5	++	1 3 2	++
8 7	++	1 3 3	++
8 8	++	1 3 4	++
8 9	++	1 3 5	++
9 0	++	1 3 6	++
9 1	++	1 3 7	++
9 3	++	1 3 8	++
9 4	++	1 3 9	++
9 5	++	1 4 0	++
9 6	++	1 4 1	++
9 7	++	1 4 2	++
9 9	++	1 4 5	++
1 0 0	++	1 4 6	++
1 0 3	++	1 4 7	++
1 0 5	++	1 4 8	++
1 0 6	++	1 4 9	++
1 0 7	++	1 5 0	++
1 0 8	++	1 5 1	++
1 0 9	++	1 5 4	++
1 1 0	++	1 5 5	++
1 1 1	++	1 5 6	++
1 1 2	++	1 5 7	++
1 1 3	++	1 5 8	++
1 1 4	++	1 6 5	++
1 1 5	++	1 6 6	++
1 1 6	++	1 6 7	++
1 1 7	++	1 6 8	++
1 1 8	++	1 6 9	++
1 1 9	++	1 7 0	++
1 2 0	++	1 7 1	++
1 2 4	++	1 7 2	++
1 2 5	++	1 7 3	++
1 2 6	++	1 7 4	++
1 2 8	++	1 7 5	++
1 2 9	++	1 7 6	++

[3224]

표 2-3

설시예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))	설시예 번호	h H S D 1 (I C ₅₀ (nM))
1 7 7	++	1 8 5	++
1 7 8	++	1 8 6	++
1 7 9	++	1 8 7	++
1 8 0	++	1 8 9	++
1 8 2	++	1 9 0	++
1 8 3	++	1 9 1	++
1 8 4	++		

[3225]

[3226] 또한, 표에서 ++는, IC₅₀값이 30 nM 이하인 것을 나타낸다.

산업상 이용 가능성

[3227]

본 발명의 복소환 화합물은 우수한 HSD1 저해 작용을 갖고, 당뇨병, 인슐린 저항성, 당뇨병 합병증, 비만, 고지혈증, 고혈압, 지방간 등의 대사성 질환 등의 예방제 또는 치료제 등으로서 유용하다.

[3228]

본 출원은, 일본에서 출원된 일본 특원 제2005-168901, 일본 특원 제2006-027097 및 일본 특원 제2006-138252, 및 미국에서 출원된 60/692,039 및 60/772,734을 기초로 하고 있고, 이들의 내용은 본 명세서에 전부 포함된다.