



(19) 대한민국특허청(KR)

(12) 등록특허공보(B1)

(45) 공고일자 2018년04월26일

(11) 등록번호 10-1837759

(24) 등록일자 2018년03월06일

- | | |
|---|--|
| <p>(51) 국제특허분류(Int. Cl.)
 <i>C07D 417/12</i> (2006.01) <i>A61K 31/4184</i> (2006.01)
 <i>A61K 31/427</i> (2006.01) <i>A61K 31/428</i> (2006.01)
 <i>C07D 413/14</i> (2006.01) <i>C07D 471/04</i> (2006.01)</p> <p>(21) 출원번호 10-2012-7023193</p> <p>(22) 출원일자(국제) 2011년02월10일
 심사청구일자 2016년01월28일</p> <p>(85) 번역문제출일자 2012년09월05일</p> <p>(65) 공개번호 10-2015-0074221</p> <p>(43) 공개일자 2015년07월02일</p> <p>(86) 국제출원번호 PCT/US2011/024311</p> <p>(87) 국제공개번호 WO 2011/103018
 국제공개일자 2011년08월25일</p> <p>(30) 우선권주장
 47/2011 2011년02월03일 요르단(JO)
 61/305,724 2010년02월18일 미국(US)</p> <p>(56) 선행기술조사문헌
 W02008153701 A1
 US20110201604 A1
 US20070219235 A1
 US6358978 B1</p> | <p>(73) 특허권자
 브이티브이 테라퓨틱스 엘엘씨
 미국 노스캐롤라이나 27265 하이 포인트 멘덴홀
 오크스 파크웨이 4170</p> <p>(72) 발명자
 브자리 아드난 엠. 엠.
 미국 노스캐롤라이나 27310 오크 리지 애쉬튼 파
 크 드라이브 6421
 폴리세티 드하마 라오
 미국 노스캐롤라이나 27265 하이 포인트 디어필드
 스트리트 3741
 (뒷면에 계속)</p> <p>(74) 대리인
 특허법인와이에스장</p> |
|---|--|

전체 청구항 수 : 총 29 항

심사관 : 광희찬

(54) 발명의 명칭 치환된 융합 이미다졸 유도체, 약학적 조성물, 및 그것의 사용 방법

(57) 요약

치환된 융합 이미다졸 유도체, 그것의 제조 방법, 치환된 융합 이미다졸 유도체를 포함하는 약학적 조성물, 및 염증을 치료하는 단계에서의 사용 방법이 제공된다. 치환된 융합 이미다졸 유도체는 헵옥시게나제의 활성 또는 양, 혹은 활성 및 양 둘 다를 조절할 수 있다.

(72) 발명자

카시스 자리르 나빌

미국 노스캐롤라이나 27235 콜팩스 발라드 팜 코트
8300

코스투라 매튜 제이.

미국 노스캐롤라이나 27278 힐스버러 뉴 호프 스포
링스 드라이브 4201

구젤 무스타파

미국 노스캐롤라이나 27282 제임스타운 건스미스
코트 4058

애틀스 오티스 클린턴

미국 노스캐롤라이나 27127 윈스턴-세일럼 알렉산
더 프레스톤 레인 249

앤드류 로버트 칼

미국 노스캐롤라이나 27282 제임스타운 모리스 팜
드라이브 3312

빅토리 사무엘

미국 노스캐롤라이나 27310 오크 리지 엘크톤 درا
이브 5820

굽타 수파르나

미국 노스캐롤라이나 27455 그린스보로 브란트 포
레스트 코트 2518

명세서

청구범위

청구항 1

- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;
- 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드;
- 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드;
- 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;
- 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;
- 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드;
- 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에탄술폰닐-에틸)-아미드;

- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메탄술폰닐-프로필)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드;
- 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;
- 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드;
- 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-모르폴린-4-일-3-옥소-프로필)-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸카바모일메틸-아미드;
- 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피롤

리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드; 및

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

로 구성된 군으로부터 선택되는 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 2

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로

필)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;

6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;

1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;

1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드; 및

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드

로 구성된 군으로부터 선택되는 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 3

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-모르폴린-4-일-3-옥소

-프로필)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드; 및

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

로 구성된 군으로부터 선택되는 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 4

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드;

틸)-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
메틸카바모일메틸-아미드;

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-
에틸)-아미드; 및

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-디메틸카바모일-
에틸)-아미드

로 구성된 군으로부터 선택되는 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 5

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에탄술폰닐-에틸)-
아미드; 및

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메탄술폰닐-프로
필)-아미드

로 구성된 군으로부터 선택되는 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 6

제 1항에 있어서, 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복
시산 디메틸카바모일메틸-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 7

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-
메톡시-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 8

제 1항에 있어서, 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복
시산 (2-메톡시-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 9

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-
히드록시-에톡시)-에틸]-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 10

제 1항에 있어서, 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복
시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 11

제 1항에 있어서, 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복
시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 12

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸
카바모일메틸-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 13

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-

에톡시-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 14

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 15

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 16

제 1항에 있어서, 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 17

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드; 또는

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에틸]-아미드;

또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 18

제 1항에 있어서,

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드; 또는

1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드;

또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 19

삭제

청구항 20

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 21

제 1항에 있어서, 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 22

제 1항에 있어서, 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 23

제 1항에 있어서, 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-

에톡시)-에틸]-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 24

제 1항에 있어서, 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 25

제 1항에 있어서, 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

청구항 26

제 1항 내지 제 25항 중 어느 한 항의 화합물 및 약학적으로 허용가능한 담체 또는 희석제를 포함하는, 심혈관 질환; 당뇨병 및 당뇨병병증; 뇌신경 퇴행성 질환; 천식; 만성 폐쇄성 폐질환; 경피증; 피부염; 건선; 시력 감퇴; 백내장; 가벼운 망막병증; 미숙아의 망막병증; 및 암으로 구성된 군으로부터 선택된 질환, 장애 또는 상태를 치료하기 위한 약학적 조성물.

청구항 27

제 26항에 있어서, 심혈관질환은 동맥경화증 및 고혈압으로부터 선택되고; 당뇨병 및 당뇨병병증은 사구체신염이고; 뇌신경 퇴행성 질환은 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증으로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 약학적 조성물.

청구항 28

제 26항에 있어서, 약학적 조성물은 Nrf2 활성제, 항산화제, 해독제 및 소염제로 구성된 군으로부터 선택된 의학적으로 효과적인 활성 성분을 더 포함하는 것을 특징으로 하는 약학적 조성물.

청구항 29

(i) 심혈관질환; (ii) 당뇨병 및 당뇨병병증; (iii) 뇌신경 퇴행성 질환; (iv) 천식; (v) 만성 폐쇄성 폐질환; (vi) 피부병; (vii) 눈병; 및 (viii) 암으로 구성된 군으로부터 선택된 질환, 장애 또는 상태를 치료하는 데 약제로서 사용하기 위한 제 1항 내지 제 25항 중 어느 한 항의 화합물.

청구항 30

제 29항에 있어서, 심혈관질환은 동맥경화증 및 고혈압으로부터 선택되고; 당뇨병 및 당뇨병병증은 사구체신염이고; 뇌신경 퇴행성 질환은 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증으로부터 선택되고; 그리고, 눈병은 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증 및 미숙아의 망막병증으로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 화합물.

발명의 설명

기술 분야

[0001] 관련 출원의 상호 참조

[0002] 본 출원은 2010년 2월 18일에 제출된 미국 가 특허출원 제61/305,724호의 우선권을 주장하며, 이것은 그 전체가 참고자료로 본원에 포함된다.

[0003] 기술 분야

[0004] 본 발명은 염증 반응의 조절에 유용할 수 있는 치환된 융합 이미다졸 유도체를 제공한다. 게다가, 본 발명은 포유동물 대상에서 헵옥시게나제의 활성 또는 양, 혹은 활성 및 양 둘 다를 조절하기 위한 화합물, 약학적 조성물과 그것의 사용 방법을 제공한다.

배경 기술

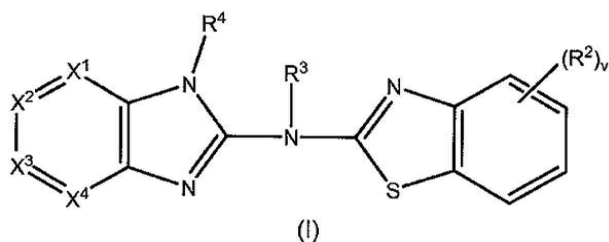
- [0005] 활성산소종(ROS)에 의해 야기된 산화적 스트레스로 인한 세포 손상은, 다양한 만성 질환, 예를 들어, 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증 및 고혈압; 당뇨병 및 당뇨합병증, 예를 들어 사구체신염; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병), 및 다발성 경화증; 천식, 만성 폐쇄성 폐질환, 피부병, 눈병, 및 암의 발병 또는 진행에 수반되는 것으로 증명되었다. 산화적 스트레스로부터 보호력을 높이는 것은 이들 질환을 예방하고, 이들 진행을 지연시키고, 이들 발병을 지연시키는 것 중 하나 이상에 유용할 수 있다. 게다가, 질환의 이러한 다양한 집합과 관련된 다양한 병인학을 가지고, 산화적 스트레스를 완화시키는 일반적인 전략이 이로울 것이다.
- [0006] 세포의 기초 생화학은 ROS, 예를 들어 과산화물 음이온, 히드록실 음이온, 산화질소, 과산화아질산염, 및 과산화수소를 생성한다. 모든 이들 생성물은 중요한 세포 신호 요구를 제공하고, 뿐만 아니라, 과잉 생성된 또는 미확인으로 남은 경우 해로운 효과를 갖는다. 많은 질환 상태는 다양한 조직 내에 보여진 만성 병리생리적 변화의 설정과 관련된 ROS의 지속된 수준을 유도한다. 그것들 자신의 및 안의 이들 합병증은 질환 이병률 및 사망률의 주된 요인일 수 있다.
- [0007] 정상 생리적 상태 하에서, ROS의 생성은, ROS로 인한 손상을 반응하고 제한하고 수리하는 세포 경로의 잘 정의되고 보존된 집합에 의해 균형이 잡혀진다. 단계 II 시스템으로 불려지는, 유전자의 이 적응 집합은 ROS를 직접적으로 분해(예를 들어, 과산화물 제거 효소 및 카탈라제)하고, 그뿐만 아니라 글루타티온 및 빌리루빈을 포함하는 세포의 내인성 항산화 분자의 수준을 증가시키는 효소를 코드화한다. 알려진 단계 II 효소의 예는 글루타티온 S-전달효소(GST), NAD(P)H: 퀸산화환원효소 1(NQO1), 글루타밀-시스테인일연결효소(GCL), 헴옥시게나제 1(HMOX1), 및 티오레독신환원효소 1(TXNRD1)을 포함한다. 항산화반응요소(ARE)로 불려진 공통 서열은 이들 단계 II 효소 각 유전자의 촉진제에 존재하고, 그것의 발현은 전사 인자 Nrf2(NF-E2 관련 인자 2)에 의해 유도된다.
- [0008] 단계 II 효소 시스템 중에서, HMOX1은 중심 성분이라고 알려졌다. HMOX1의 역할은 헴(heme)을 이화하는 2단계 공정의 제 1 단계로서, 헴을 빌리루빈, 일산화탄소, 및 유리철로 대사시키는 것이다. 제 1, 및 속도제한반응은 HMOX1에 의한 헴으로부터의 빌리베르딘 및 일산화탄소의 생성이다. 제 2 단계는 빌리베르딘 환원효소에 의한 빌리베르딘으로부터의 빌리루빈의 생성이다. 빌리루빈 및 일산화탄소 둘 다 ROS를 제거하고, 강한 항산화 및 항염증 활성을 갖는 것으로 나타났다. HMOX1의 생성을 유도하는 물질은 당뇨병, 심혈관질환, 고혈압, 및 폐기능의 모델에서 이로운 활성을 갖는것으로 나타났다.
- [0009] HMOX1은 사람의 간, 신장, 비장, 및 피부에서 발견되고, 특정 세포 타입, 특히 섬유아세포 및 대식세포에도 편재되었다. HMOX1은 1개의 구성 성분과 다른 2개의 유도 성분인 적어도 3개의 이소형으로 존재한다. 헴, 중금속 이온(예를 들어, 주석, 금, 백금, 및 수은), 전이금속 이온(예를 들어, 철, 코발트, 크롬, 및 니켈), 및 친전자체(예를 들어, 술포라판 및 커큐민과 같은 자연 생성물)는 모두 HMOX1의 생성을 유도할 수 있다. HMOX1의 유도 및 다른 단계 II 유전자는 중금속, 헴, 및 친전자체에 반응성인 수많은 전사 인자에 의해 조절된다. 전사 인자 Nrf2, Bach1, 및 Maf는 이 공정에서 특히 중요하다. 게다가, 단계 II 유전자 유도를 조절하는데 중요한 보조 인자 및 조절 분자가 존재한다. 이들은 Keap1(유비퀴틴화를 위해 Nrf2를 겨냥하는 연결자 분자), 및 2개의 미토콘드리아 단백질, DJ-1 및 프락타신(FXN)(친전자체의 존재 하에서 Nrf2 활성화를 증가시키도록 제공됨)을 포함한다. HMOX1은 또한 자극, 예를 들어 열충격, 산화적 스트레스 및 시토카인, 예를 들어 인터류킨-1(IL-1), 종양괴사 인자 및 IL-6에 대해 일반화된 스트레스 반응의 부분으로서 유도된다. 스트레스 반응이 불활성화로부터 취약한 세포 효소의 보호를 가져온다는 점에서, 스트레스 반응은 이로운 것처럼 보여진다.

발명의 내용

해결하려는 과제

과제의 해결 수단

- [0010] 본 발명은 본원에 기술된 식(I)의 치환된 융합 이미다졸 유도체 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 제공한다:



[0011]

[0012]

다른 양태에서, 본 발명은 산화적 스트레스 및/또는 염증을 감소시킬 수 있는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 양태에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 및 그것의 약학적으로 허용가능한 염의 제조 방법을 제공한다. 다른 양태에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 포함하는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 양태에서, 본 발명은 대상에게 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다.

[0013]

식(I)의 화합물 및 그것의 약학적으로 허용가능한 염은 HMOX1의 생성을 유도하는 및/또는 그것의 활성을 증가시키는 물질로서 유용하고, 따라서 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증 및 고혈압; 당뇨병 및 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병), 및 다발성 경화증; 천식; 만성 폐쇄성 폐질환; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 미숙아의 망막병증; 및 암을 포함하나 이에 제한되지 않는 적어도 부분적으로 산화적 스트레스와 관련된 다양한 만성 질환을 치료하는데 유용할 수 있다.

발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0014]

하기 정의는 한정된 용어를 명백히 하도록 의도된다. 본원에 사용된 특정 용어가 구체적으로 정의되지 않은 경우, 용어가 불명확한 것으로서 생각되어선 안된다. 오히려, 이러한 정의되어지지 않은 용어는 본 발명과 관련된 당업자에게 그것들의 평범한 보통의 의미에 따라 이해되는 것으로 생각해야 한다.

[0015]

본원에 사용된 용어 "알킬"은, 본원에 더 기술되는 바와 같이, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있는 1 내지 10개의 탄소 원자를 갖는 곧은 또는 분기쇄 포화 탄화수소를 의미한다. 본원에 사용된 "알킬"의 예는 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 이소부틸, n-부틸, sec-부틸, tert-부틸, 이소펜틸, n-펜틸, 네오펀틸, n-헥실, 및 2-에틸헥실을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0016]

알킬기의 탄소 원자 수는 x 내지 y개의 탄소 원자를 함유하는 본원에 정의된 알킬기를 의미하는 문구 " C_{x-y} 알킬"에 의해 나타낸다. 따라서, C_{1-6} 알킬은 1 내지 6개의 탄소 원자를 갖는 알킬쇄를 나타내고, 예를 들어, 메틸, 에틸, n-프로필, 이소프로필, 이소부틸, n-부틸, sec-부틸, tert-부틸, 이소펜틸, n-펜틸, 네오펀틸, 및 n-헥실을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0017]

본원에 사용된, 용어 "알킬렌"은, 본원에 더 기술되는 바와 같이, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있는 1 내지 10개의 탄소 원자를 갖는, 곧은 또는 분기쇄 2가 포화 탄화수소 라디칼을 의미한다. 본원에 사용된 "알킬렌"의 예는 메틸렌, 에틸렌, n-프로필렌, 1-메틸에틸렌, 2-메틸에틸렌, 디메틸메틸렌, n-부틸렌, 1-메틸-n-프로필렌, 및 2-메틸-n-프로필렌을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0018]

알킬렌기에서의 탄소 원자의 수는, 본원에 정의된 x 내지 y개의 탄소 원자를 함유하는 알킬렌기를 의미하는 문구 " C_{x-y} 알킬렌"에 의해 나타낸다. 유사한 용어는 다른 용어 및 범위로도 적용될 것이다. 따라서, C_{1-4} 알킬렌은 1 내지 4개의 탄소 원자를 갖는 알킬렌쇄를 나타내고, 예를 들어, 메틸렌, 에틸렌, n-프로필렌, 1-메틸에틸렌, 2-메틸에틸렌, 디메틸메틸렌, n-부틸렌, 1-메틸-n-프로필렌, 및 2-메틸-n-프로필렌을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0019]

본원에 사용된, 용어 "시클로알킬"은 본원에 더 기술된, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있는 포화된, 3 내지 10 멤버의, 환식 탄화수소 고리를 의미한다. 이러한 "시클로알킬"기는 1환, 2환, 또는 3환이다. 본원에 사용된 "시클로알킬"기의 예는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로헵틸, 노보닐, 및 아다만틸을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0020]

시클로알킬기의 탄소 원자의 수는 본원에 정의된 x 내지 y개의 탄소 원자를 함유하는 시클로알킬기를 의미하는 문구 " C_{x-y} 시클로알킬"에 의해 나타날 것이다. 유사한 용어는 다른 용어 및 범위로도 적용될 것이다. 따라서, C_3 -

¹⁰시클로알킬은 상기 기술된 3 내지 10개의 탄소를 갖는 시클로알킬기를 나타내고, 예를 들어, 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로헵틸, 노보닐, 및 아다만틸을 포함하나 이에 제한되지 않는다.

[0021] 본원에 사용된, 용어 "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"은, 하나 이상의 헤테로원자를 함유하는 선택적으로 치환된 단일- 또는 다환 포화 고리 시스템을 의미한다. 이러한 "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"기는 본원에 더 기술된, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있다. 본원에 사용된, 용어 "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"은 하나 이상의 방향족고리를 함유하는 고리 시스템을 포함하지 않는다. 헤테로원자의 예는 N-산화물, 황산화물, 및 황이산화물을 포함하는 질소, 산소, 또는 황 원자를 포함한다. 전형적으로, 고리는 3 내지 12 멤버이다. 이들 고리는 하나 이상의 다른 헤테로환 고리(들) 또는 시클로알킬 고리(들)에 선택적으로 융합될 수 있다. 본원에 사용된 "헤테로환"기의 예는, 테트라히드로푸란, 테트라히드로피란, 1,4-디옥산, 1,3-디옥산, 피페리딘, 피롤리딘, 모르폴린, 테트라히드로티오피란, 및 테트라히드로티오펜을 포함하나 이에 제한되지 않으며, 부작은 화학적으로 가능한 한, 상기 고리 상에 어떤 지점에서든 발생할 수 있다. 따라서, 예를 들어, "모르폴린"은 모르폴린-2-일, 모르폴린-3-일, 및 모르폴린-4-일을 의미한다.

[0022] 본원에 사용된, "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"은 가능한 치환기로서 열거될 때, "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"기는 탄소 원자 또는 어떤 헤테로원자를 통해 그 지점에서의 부작이 화학적으로 가능한 정도로 부착될 수 있다. 예를 들어, "헤테로사이클일"은 피롤리딘-1-일, 피롤리딘-2-일, 및 피롤리딘-3-일을 포함할 것이다. "헤테로사이클" 또는 "헤테로사이클일"기가 고리에서 질소 원자를 함유할 때, 질소 원자를 통한 부작은 고리 이름과 함께 "-이노(-ino)" 접미사를 사용함으로써 다르게 나타낼 수 있다. 예를 들어, 피롤리디노는 피롤리딘-1-일을 의미한다.

[0023] 본원에 사용된 용어 "할로젠"은 불소, 염소, 브롬, 또는 요오드를 의미한다.

[0024] 본원에 사용된, 용어 "옥소"는 $>C=O$ 치환기를 의미한다. 옥소 치환기가, 옥소-치환 시클로알킬기(예를 들어, 3-옥소-시클로부틸)와 같은 것으로, 다른 것으로 포화된 기 상에 발생할 때, 치환된 기는 여전히 포화된 기인 것을 의도한다.

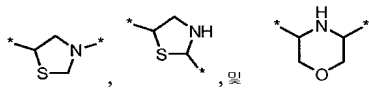
[0025] 본원에 사용된 용어 "할로알킬"은, 본원에 정의된, 적어도 하나의 할로젠으로 치환된 알킬기를 의미한다. 본원에 사용된, 분기된 또는 곧은쇄 "할로알킬"기의 예는 하나 이상의 할로젠, 예를 들어, 플루오로, 클로로, 브로모, 및 요오도로 독립적으로 치환된 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, n-부틸, 및 t-부틸을 포함하나 이에 제한되지 않는다. 용어 "할로알킬"은 $-CF_3$, $-CH_2-CF_3$, 및 $-CF_2Cl$ 과 같은 기를 포함한다고 해석되어야 한다.

[0026] 본원에 사용된, 용어 "아릴"은 본원에 더 기술된, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있는 6 내지 10 멤버의 환식, 방향족 탄화수소를 의미한다. 본원에 사용된 "아릴"기의 예는 페닐 및 나프틸을 포함하나 이에 제한되지 않는다. 본원에 사용된, 용어 "아릴"은 또한 페닐 또는 나프틸기가 1 내지 3개의 비방향족, 포화 또는 불포화, 탄소환 고리로 선택적으로 융합된 고리 시스템을 포함한다. 예를 들어, "아릴"은 방향족 또는 비방향족 고리(들)에 부착가능한 인텐과 같은 고리 시스템을 포함할 것이다.

[0027] 본원에 사용된, 용어 "헤테로아릴"은 적어도 하나의 방향족고리를 포함하고, 또한 하나 이상의 헤테로원자를 포함하는 5 내지 14 멤버의 선택적으로 치환된 단일- 또는 다환 고리 시스템을 의미한다. 이러한 "헤테로아릴"기는 본원에 더 기술된, 가능한 복수 치환으로 선택적으로 치환될 수 있다. 적어도 하나의 방향족고리 및 적어도 하나의 비방향족고리를 포함하는 다환 "헤테로아릴"기에서, 방향족고리(들)는 헤테로원자를 함유할 필요가 없다. 따라서, 예를 들어, 본원에 사용된, "헤테로아릴"은 인돌린일을 포함할 것이다. 게다가, 부착점은 그것을 함유하는 고리가 방향족인지 또는 헤테로원자를 포함하는 지를 고려하지 않은 고리 시스템 내의 어떤 고리일 수 있다. 따라서, 예를 들어, 본원에 사용된, "헤테로아릴"은 인돌린-1-일, 인돌린-3-일, 및 인돌린-5-일을 포함할 것이다. 헤테로원자의 예는 가능한 곳에, N-산화물, 황산화물, 및 황이산화물을 포함하는 질소, 산소, 또는 황 원자를 포함한다. 본원에 사용된 "헤테로아릴"기의 예는, 푸릴, 티오펜일, 피롤일, 옥사졸일, 티아졸일, 이미다졸일, 이소옥사졸일, 이소티아졸일, 1,2,4-트리아졸일, 피라졸일, 피리딘일, 피리다진일, 피리미딘일, 인돌일, 이소인돌일, 벤조[b]티오펜일, 벤즈이미다졸일, 벤조티아졸일, 프테리딘일, 및 페나진일을 포함하나 이에 제한되지 않으며, 부작은 화학적으로 가능한 한, 상기 고리 상에 어떤 지점에서 발생할 수 있다. 따라서, 예를 들어, "티아졸일"은 티아졸-2-일, 티아졸-4-일, 및 티아졸-5-일을 의미한다.

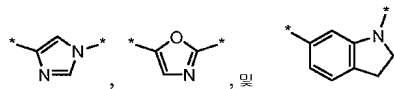
[0028] 본원에 사용된, "헤테로아릴"이 가능한 치환기로서 열거될 때, "헤테로아릴"기는 탄소 원자 또는 어떤 헤테로원자를 통해 그 지점에서의 부작이 화학적으로 가능한 정도로 부착될 수 있다.

[0029] 본원에 사용된, 용어 "헤테로사이클일렌"은 선택적으로 치환된 2가 헤테로사이클일기(상기 정의됨)를 의미한다. 부착점은 부착이 화학적으로 가능한 한 동일한 고리 원자 또는 다른 고리 원자에 있을 수 있다. 2개의 부착점은 부착이 화학적으로 가능한 한, 각각 독립적으로 탄소 원자 또는 헤테로원자에 있을 수 있다. 예는



을 포함하나 이에 제한되지 않고, 여기서 별표는 부착점을 나타낸다.

[0030] 본원에 사용된, 용어 "헤테로아릴렌"은 선택적으로 치환된 2가 헤테로아릴기(상기 정의됨)를 의미한다. 부착점은 부착이 화학적으로 가능한 한 동일한 고리 원자 또는 다른 고리 원자에 있을 수 있다. 2개의 부착점은 부착이 화학적으로 가능한 한, 각각 독립적으로 탄소 원자 또는 헤테로원자에 있을 수 있다. 예는



을 포함하나 이에 제한되지 않고, 여기서 별표는 부착점을 나타낸다.

[0031] 다양한 다른 화학 용어 또는 약어는 당업자에게 그것들의 표준 의미를 갖는다. 예를 들어: "히드록실"은 -OH를 의미하고; "메톡시"는 -OCH₃를 의미하고; "시아노"는 -CN을 의미하고; "아미노"는 -NH₂를 의미하고; "메틸아미노"는 -NHCH₃를 의미하고; "술폰닐"은 -SO₂-를 의미하고; "카보닐"은 -C(O)-를 의미하고; "카르복시" 또는 "카르복실"은 -CO₂H를 의미하는, 등이 있다. 게다가, 이름이, 예를 들어 "메틸아미노카보닐-메틸"로 복수 부분을 열거할 때, 먼저-열거된 부분은 뒤에-열거된 부분보다 부착점으로부터 더 멀다. 따라서, "메틸아미노카보닐메틸"과 같은 용어는 -CH₂-C(O)-NH-CH₃를 의미한다.

[0032] 본원에 사용된, 용어 "치환된"은 지정 치환기 또는 치환기들을 갖는 지정된 부분의 하나 이상 수소의 치환을 의미하고, 달리 언급되지 않은 한, 치환의 복수 정도가 가능하고, 치환이 안정한 또는 화학적으로 가능한 화합물을 가져오도록 제공된다. 안정한 화합물 또는 화학적으로 가능한 화합물은, 약 -80 °C 내지 약 +40 °C의 온도에서 보관될 때, 수분 또는 다른 화학적 반응 조건의 부재 하에서, 적어도 1주일 동안, 화학 구조가 실질적으로 변화되지 않거나, 또는 환자에게 치료적 또는 예방 투여에 유용하도록 충분히 길게 그것의 완전한 상태를 유지하는 화합물이다. 본원에 사용된, 문구 "하나 이상으로 치환된..." 또는 "한번 이상으로 치환된..."은 안정성 및 화학 가능성의 상기 조건이 충족되는 조건 하에서 이용가능한 결합 지점의 수에 기초한 1 내지 최대수의 가능한 치환기와 동등한 수많은 치환기를 의미한다.

[0033] 본원에 사용된, 다양한 관능기는 하이픈 또는 대쉬(-) 혹은 별표(*)를 갖는 관능기에서 부착점을 갖는 것으로 이해될 것이다. 즉, -CH₂CH₂CH₃의 경우에서, 부착점은 가장 왼쪽에서의 CH₂기라고 이해될 것이다. 기가 별표 또는 대쉬 없이 열거된 경우, 부착점은 열거된 기의 평범하고 보통의 의미에 의해 나타낸다.

[0034] 어떤 변수가 어떤 하나의 구성요소(예를 들어, R^d), 또는 복수 구성요소에서 한번 이상 발생할 때, 각 발생에서 그것의 정의는 모든 발생에서 그것의 정의에 독립적이다.

[0035] 본원에 사용된, 복수-원자 2가 종들은 왼쪽에서 오른쪽으로 읽혀진다. 예를 들어, 명세서 또는 청구범위가 A-D-E를 열거하고, D가 -OC(O)-로서 정의된 경우, D를 갖는 결과되는 기는 A-C(O)O-E가 아닌, A-OC(O)-E이다.

[0036] 본원에 사용된, 용어 "선택적으로"는 후속으로 기술된 사건(들)이 일어나거나 일어나지 않는 것을 의미한다.

[0037] 본원에 사용된, "투여한다" 또는 "투여"는 화합물 또는 조성물을 대상에게 도입하는 것과 같이 도입하는 것을 의미한다. 용어는 전달의 어떤 특정 방식에 제한되지 않고, 예를 들어, 정맥 내 전달, 경피 전달, 구강 전달, 비강 전달, 및 직장 전달을 포함할 수 있다. 더욱이, 전달 방식에 따라, 투여는 예를 들어, 의료 전문가(예를 들어, 내과 의사, 간호사, 등), 약사, 또는 대상(즉, 자가-투여)을 포함하는 다양한 개체에 의해 수행될 수 있다.

[0038] 본원에 사용된, "치료한다" 또는 "치료"는, 질환 또는 상태 및 그것의 특징 증상의 성격에 따라, 질환 또는 상태의 진행을 지연시키고, 질환 또는 상태를 조절하고, 질환 또는 상태의 발병을 지연시키고, 질환 또는 상태의 하나 이상의 증상 특징을 개선하고, 혹은 질환 또는 상태 또는 그것의 특징 증상의 재발을 지연시키는 것들 중, 하나 이상을 의미할 수 있다.

[0039] 본원에 사용된, "대상"은 사람과 같은 어떤 포유동물을 의미하나 이에 제한되지 않는다. 한 구체예에서, 대상은 사람이다. 다른 구체예에서, 대상은 질환 또는 상태의 증상 특징을 하나 이상 나타내는 사람이다. 용어 "대상"

은 어떤 병원, 클리닉, 또는 연구시설(예를 들어, 입원환자, 연구참가자, 등으로서)에 대하여 어떤 특정 상태를 갖는 한 사람을 요구하지 않는다.

[0040] 본원에 사용된, 용어 "화합물"은 유리산, 유리염기, 및 그것의 어떤 염을 포함한다. 따라서, "구체에 1의 화합물" 또는 "청구항 1의 화합물"과 같은 문구는 각각 구체에 1 또는 청구항 1에 의해 망라된 어떤 유리산, 유리염기, 및 그것의 어떤 염을 의미한다.

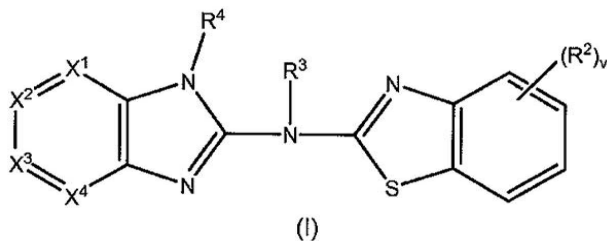
[0041] 본원에 사용된, 용어 "약학적 조성물"은 포유동물 숙주에게 예를 들어, 구강으로, 국부적으로, 비경구적으로, 흡입분무에 의해, 또는 직장으로, 종래의 비독성 담체, 희석제, 보조제, 부형제, 등을 함유하는 단위 투여량 제형으로 투여될 수 있는 조성물을 표시하도록 사용된다. 용어 "비경구적"은 피하 주사를 포함한다.

[0042] 본원에 사용된, "치환된 융합 이미다졸 유도체"는 하기 기술된 식(I)에 의해 망라된 화합물을 의미한다.

[0043] 본 발명의 양태는 치환된 융합 이미다졸 유도체, 치환된 융합 이미다졸 유도체를 포함하는 약학적 조성물, 치환된 융합 이미다졸 유도체를 만드는 방법, 치환된 융합 이미다졸 유도체를 포함하는 약학적 조성물을 만드는 방법, 및 그것의 사용 방법을 포함한다.

[0044] 제 1 양태에서, 본 발명은 HMOX1의 생성을 유도하는 치환된 융합 이미다졸 유도체를 제공하고, 따라서 적어도 부분으로 산화적 스트레스와 관련된 다양한 질환을 치료하는데 유용할 수 있다.

[0045] 제 1 구체에(즉, 구체에 1)에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 제공한다:



[0046]

[0047] 여기서

[0048] X^1, X^2, X^3 , 및 X^4 중 하나는 $\text{C}(\text{L-G})$ 이고, X^1, X^2, X^3 , 및 X^4 의 남은 멤버는 독립적으로 N 또는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이고;

[0049] G는 수소, $-\text{C}_{1-8}$ 알킬, $-\text{C}_{3-10}$ 시클로알킬, $-\text{C}_{1-6}$ 알킬렌- $-\text{C}_{3-10}$ 시클로알킬, 헤테로사이클일, $-\text{C}_{1-6}$ 알킬렌- $-\text{C}_{3-10}$ 헤테로사이클일, 페닐, 헤테로아릴, 또는 NR^hR^k 이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은 G는 $-\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Y}^3)\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{Y}^3)\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{Y}^3)(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{Y}^3)(\text{CH}_3)_2$, 또는 $\text{C}(\text{Y}^3)$ 이고, 여기서 Y^3 는 시클로프로필, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OH}$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{F}$, $-\text{SCH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $-\text{SCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NH-CH}_3$, $-\text{NH-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, 테트라히드로피란-4-일, 테트라히드로푸란-2-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-4-일, 피페리딘-1-일, 4-히드록시-피페리딘-1-일, 3-히드록시-피페리딘-1-일, $-\text{NH-C}(\text{O})-\text{CH}_3$, $-\text{NH-C}(\text{O})-\text{CH}_2\text{CH}_3$, 테트라히드로푸란-2-일-메틸옥시, 또는 $-\text{C}(\text{O})-\text{Y}^4$ 이고, 여기서 Y^4 는 $-\text{OH}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{NH}_2$, $-\text{NH-CH}_3$, $-\text{NH-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, 모르폴린-4-일, 4-메틸-피페라진-1-일, 피롤리딘-1-일, 또는 피페라진-1-일이고;

[0050] L은 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$, $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{C}(\text{O})-$, R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로아릴렌, 또는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로사이클일렌이고; 혹은 $-\text{L-G}$ 기는 -시아노이고;

[0051] R^1 은 수소, R^a , 페닐, 또는 헤테로아릴이고, 여기서 페닐 및 헤테로아릴기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;

- [0052] R^2 는 R^b 이고;
- [0053] R^3 는 수소, $-C_{1-6}$ 알킬, 또는 $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 및 시클로알킬기는 R^z 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0054] R^4 는 $-C_{1-6}$ 알킬 또는 $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 및 시클로알킬기는 R^y 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0055] R^6 는 수소, $-C_{1-6}$ 알킬, $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 및 시클로알킬기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0056] R^a 는
- [0057] a) -할로겐,
- [0058] b) $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0059] c) $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0060] d) -헤테로사이클일,
- [0061] e) -시아노,
- [0062] f) $-CF_3$,
- [0063] g) $-OCF_3$,
- [0064] h) $-O-R^d$,
- [0065] i) $-S(O)_w-R^d$,
- [0066] j) $-S(O)_2O-R^d$,
- [0067] k) $-NR^dR^e$,
- [0068] l) $-C(O)-R^d$,
- [0069] m) $-C(O)-O-R^d$,
- [0070] n) $-OC(O)-R^d$,
- [0071] o) $-C(O)NR^dR^e$,
- [0072] p) $-C(O)$ -헤테로사이클일,
- [0073] q) $-NR^dC(O)R^e$,
- [0074] r) $-OC(O)NR^dR^e$,
- [0075] s) $-NR^dC(O)OR^d$, 또는
- [0076] t) $-NR^dC(O)NR^dR^e$ 이고,
- [0077] 여기서 알킬, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^y 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;

- [0078] R^b 는
- [0079] a) -할로젠,
- [0080] b) $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0081] c) $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0082] d) -헤테로사이클일,
- [0083] e) -페닐,
- [0084] f) -헤테로아릴,
- [0085] g) -시아노,
- [0086] h) $-CF_3$,
- [0087] i) $-OCF_3$,
- [0088] j) $-O-R^f$,
- [0089] k) $-S(O)_w-R^f$,
- [0090] l) $-S(O)_2O-R^f$,
- [0091] m) $-NR^fR^g$,
- [0092] n) $-C(O)-R^f$,
- [0093] o) $-C(O)-O-R^f$,
- [0094] p) $-OC(O)-R^f$,
- [0095] q) $-C(O)NR^fR^g$,
- [0096] r) $-C(O)$ -헤테로사이클일,
- [0097] s) $-NR^fC(O)R^g$,
- [0098] t) $-OC(O)NR^fR^g$,
- [0099] u) $-NR^fC(O)OR^f$, 또는
- [0100] v) $-NR^fC(O)NR^fR^g$ 이고,
- [0101] 여기서 알킬, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^z 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0102] R^c 는
- [0103] a) -할로젠,
- [0104] b) $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0105] c) $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0106] d) -헤테로사이클일,

- [0107] e) -시아노,
- [0108] f) $-\text{CF}_3$,
- [0109] g) $-\text{OCF}_3$,
- [0110] h) $-\text{O}-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0111] i) $-\text{S}(\text{O})_{\text{w}}-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0112] j) $-\text{S}(\text{O})_2\text{O}-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0113] k) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0114] l) $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0115] m) $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0116] n) $-\text{OC}(\text{O})-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0117] o) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0118] p) $-\text{C}(\text{O})$ -헤테로사이클일,
- [0119] q) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{k}}$,
- [0120] r) $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0121] s) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{k}}$,
- [0122] t) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0123] u) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{S}(\text{O})_{\text{w}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0124] v) -페닐,
- [0125] w) -헤테로아릴, 또는
- [0126] x) $-\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{알킬렌})-\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{알킬렌})-\text{N}(\text{R}^{\text{h}})\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{\text{k}}$ 이고,
- [0127] 여기서 알킬렌, 알킬, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^{x} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0128] R^{d} 및 R^{e} 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, 또는 C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬 및 시클로알킬기는 R^{y} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^{d} 및 R^{e} 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 및 아제파노로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^{y} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0129] R^{f} 및 R^{g} 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, C_{3-10} 시클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴이고,
- [0130] 여기서 알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^{z} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^{f} 및 R^{g} 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피

라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 및 아제파노로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^z 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;

- [0131] R^h 및 R^k 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, C_{3-10} 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 또는 헤테로아릴이고, 여기서 알킬, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^h 및 R^k 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 및 아제파노로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0132] R^y 는
- [0133] a) -할로젠,
- [0134] b) $-NH_2$,
- [0135] c) -시아노,
- [0136] d) -카르복시,
- [0137] e) -히드록시,
- [0138] f) -티올,
- [0139] g) $-CF_3$,
- [0140] h) $-OCF_3$,
- [0141] i) $-C(O)-NH_2$,
- [0142] j) $-S(O)_2-NH_2$,
- [0143] k) 옥소,
- [0144] l) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0145] m) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, -헤테로사이클일,
- [0146] n) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0147] o) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-O-C_{1-6}$ 알킬,
- [0148] p) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-O-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0149] q) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-NH-C_{1-6}$ 알킬,
- [0150] r) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}$ 알킬, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, 및 $-N(C_{1-6}알킬)_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환

기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$,

[0151] s) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C(O)-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0152] t) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C(O)-O-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0153] u) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-S-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0154] v) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-S(O)_2-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0155] w) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C(O)-NH-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0156] x) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C(O)-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$,

[0157] y) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-S(O)_2-NH-C_{1-6}\text{알킬}$,

[0158] z) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-S(O)_2-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$,

[0159] aa) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-NH-C(O)-C_{1-6}\text{알킬}$, 또는

[0160] bb) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-NH-S(O)_2-C_{1-6}\text{알킬}$ 이고;

[0161] R^x 는

[0162] a) $-R^y$

[0163] b) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-페닐$,

[0164] c) 할로젠, $-OH$, $-O-C_{1-6}\text{알킬}$, $-NH_2$, $-NH-C_{1-6}\text{알킬}$, 및 $-N(C_{1-6}\text{알킬})_2$ 로 구성된 군으로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-헤테로아릴$,

[0165] d) $-O-페닐$,

[0166] e) $-O-헤테로아릴$,


[0167] f) $-C(O)-페닐$,

[0168] g) $-C(O)-헤테로아릴$,

[0169] h) $-C(O)-O-페닐$, 또는

[0170] i) $-C(O)-O-헤테로아릴$ 이고;

[0171] R^z 는

- [0172] a) $-R^v$
- [0173] b) -페닐,
- [0174] c) -헤테로아릴;
- [0175] d) -O-페닐,
- [0176] e) -O-헤테로아릴,
- [0177] f) $-C(O)$ -페닐,
- [0178] g) $-C(O)$ -헤테로아릴,
- [0179] h) $-C(O)$ -O-페닐, 또는
- [0180] i) $-C(O)$ -O-헤테로아릴이고;
- [0181] v는 0 내지 4의 정수이고,
- [0182] w는 0 내지 2의 정수이다.
- [0183] 구체예 2: 구체예 1에 따른 화합물로서, 여기서
- [0184] G는 수소, $-C_{1-8}$ 알킬, $-C_{3-10}$ 시클로알킬, $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 헤테로아릴, 또는 NR^hR^k 이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은 G는 $-CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2CH_2Y^3$, $-CH(CH_3)CH_2Y^3$, $-CH_2CH(Y^3)CH_3$, $-CH(Y^3)CH_3$, $-CH_2C(Y^3)(CH_3)_2$, $-C(Y^3)(CH_3)_2$, 또는 이고, 여기서 Y^3 은 -시클로프로필, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-O(CH_2)_2-OH$, $-O(CH_2)_2-F$, $-SCH_3$, $-S(O)_2-CH_3$, $-SCH_2CH_3$, $-S(O)_2CH_2CH_3$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, 테트라히드로피란-4-일, 테트라히드로푸란-2-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-4-일, 피페리딘-1-일, 4-히드록시-피페리딘-1-일, 3-히드록시-피페리딘-1-일, $-NH-C(O)-CH_3$, $-NH-C(O)-CH_2CH_3$, 테트라히드로푸란-2-일-메틸옥시, 또는 $-C(O)-Y^4$ 이고, 여기서 Y^4 는 $-OH$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-OC(CH_3)_3$, $-NH_2$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, $-N(CH_2CH_3)_2$, 모르폴린-4-일, 4-메틸-피페라진-1-일, 피롤리딘-1-일, 또는 피페라진-1-일이고;
- [0185] R^c 는
- [0186] a) -할로젠,
- [0187] b) $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0188] c) $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0189] d) -헤테로사이클일,
- [0190] e) -시아노,
- [0191] f) $-CF_3$,
- [0192] g) $-OCF_3$,
- [0193] h) $-O-R^h$,
- [0194] i) $-S(O)_w-R^h$,
- [0195] j) $-S(O)_2O-R^h$,

- [0196] k) $-NR^hR^k$,
- [0197] l) $-C(O)-R^h$,
- [0198] m) $-C(O)-O-R^h$,
- [0199] n) $-OC(O)-R^h$,
- [0200] o) $-C(O)NR^hR^k$,
- [0201] p) $-C(O)$ -헤테로사이클일,
- [0202] q) $-NR^hC(O)R^k$,
- [0203] r) $-OC(O)NR^hR^k$,
- [0204] s) $-NR^hC(O)OR^k$,
- [0205] t) $-NR^hC(O)NR^hR^k$,
- [0206] u) -페닐,
- [0207] v) -헤테로아릴, 또는
- [0208] w) $-O-(C_{1-4}\text{알킬렌})-O-(C_{1-4}\text{알킬렌})-N(R^h)C(O)-OR^k$ 이고,
- [0209] 여기서 알킬렌, 알킬, 시클로알킬, 헤테로사이클일, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0210] R^h 및 R^k 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, C_{3-10} 시클로알킬, 페닐, 또는 헤테로아릴이고, 여기서 알킬, 시클로알킬, 페닐, 및 헤테로아릴기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^h 및 R^k 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 및 아제파노로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0211] R^y 는
- [0212] a) -할로젠,
- [0213] b) $-NH_2$,
- [0214] c) -시아노,
- [0215] d) -카르복시,
- [0216] e) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0217] f) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, -헤테로사이클일,
- [0218] g) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0219] h) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-O-C_{1-6}$ 알킬,
- [0220] i) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-O-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0221] j) -히드록시,

- [0222] k) -티올,
- [0223] l) $-\text{CF}_3$,
- [0224] m) $-\text{OCF}_3$,
- [0225] n) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-\text{C}(\text{O})-\text{C}_{1-6}$ 알킬,
- [0226] o) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{C}_{1-6}$ 알킬,
- [0227] p) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-\text{S}-\text{C}_{1-6}$ 알킬, 또는
- [0228] q) 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{C}_{1-6}$ 알킬이다.
- [0229] 구체예 3: 구체예 2에 따른 화합물로서, 여기서
- [0230] R^3 는 수소이다.
- [0231] 구체예 4: 구체예 2에 따른 화합물로서, 여기서
- [0232] R^3 는 메틸이다.
- [0233] 구체예 5: 구체예 2에 따른 화합물로서, 여기서
- [0234] R^3 는 에틸이다.
- [0235] 구체예 6: 구체예 2에 따른 화합물로서, 여기서
- [0236] R^3 는 이소프로필이다.
- [0237] 구체예 7: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0238] X^3 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이다.
- [0239] 구체예 8: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0240] X^3 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^1 및 X^4 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이고, X^2 는 N이다.
- [0241] 구체예 9: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0242] X^3 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^1 및 X^2 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이고, X^4 는 N이다.
- [0243] 구체예 10: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0244] X^3 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^2 및 X^4 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이고, X^1 은 N이다.
- [0245] 구체예 11: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0246] X^2 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이다.
- [0247] 구체예 12: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0248] X^2 는 $\text{C}(\text{L}-\text{G})$ 이고, X^1 및 X^4 는 $\text{C}(\text{R}^1)$ 이고, X^3 는 N이다.
- [0249] 구체예 13: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0250] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 및 X^3 는 C-R^1 이고, X^4 는 N이다.
- [0251] 구체예 14: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0252] X^2 는 C-L-G 이고, X^3 및 X^4 는 C-R^1 이고, X^1 은 N이다.
- [0253] 구체예 15: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0254] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 중 2개는 N이다.
- [0255] 구체예 16: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0256] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 중 2개는 N이다.
- [0257] 구체예 17: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0258] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 는 N이다.
- [0259] 구체예 18: 구체예 2 내지 6의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0260] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 는 N이다.
- [0261] 구체예 19: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0262] v 는 0 내지 2의 정수이다.
- [0263] 구체예 20: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0264] v 는 0 또는 1이다.
- [0265] 구체예 21: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0266] v 는 1이다.
- [0267] 구체예 22: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0268] v 는 1이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 5-위치 또는 6-위치에 부착된다.
- [0269] 구체예 23: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0270] v 는 1이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 6-위치에 부착된다.
- [0271] 구체예 24: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0272] v 는 2이고, 하나의 R^2 는 벤조티아졸 고리의 6-위치에 부착된다.
- [0273] 구체예 25: 구체예 2 내지 18의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0274] v 는 2이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 5-위치 및 6-위치에 부착된다.
- [0275] 구체예 26: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0276] R^2 는 -할로젠, $-\text{C}_{1-6}$ 알킬, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{O-R}^f$, 또는 $-\text{S}(\text{O})_w-\text{R}^f$ 이고, 여기서 알킬기는 R^2 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0277] 구체예 27: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0278] R^2 는 -할로젠, -메틸, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-SCF_3$, -O-헤테로아릴, 또는 $-S(O)_2-CH_3$ 이다.
- [0279] 구체예 28: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0280] R^2 는 $-Cl$, $-F$, $-CF_3$, 및 $-OCF_3$ 로부터 선택된다.
- [0281] 구체예 29: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0282] R^2 는 $-OCF_3$ 이다.
- [0283] 구체예 30: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0284] R^2 는 $-CF_3$ 이다.
- [0285] 구체예 31: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0286] R^2 는 $-F$ 이다.
- [0287] 구체예 32: 구체예 2 내지 25의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0288] R^2 는 $-Cl$ 이다.
- [0289] 구체예 33: 구체예 2 내지 32의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0290] R^4 는 -메틸, -에틸, -n-프로필, -이소프로필, -n-부틸, -sec-부틸, -이소부틸, -tert-부틸, $-(CH_2)_{1-2}-OCH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-F$, $-(CH_2)_{1-2}-Cl$, $-(CH_2)_{1-2}-OCF_3$, $-(CH_2)_{1-2}-NH_2$, $-(CH_2)_{1-2}-CN$, $-(CH_2)_{1-2}-OH$, $-(CH_2)_{1-2}-CF_3$, $-(CH_2)_{1-2}-CO_2H$, $-(CH_2)_{1-2}-SH$, $-(CH_2)_{1-2}-SCH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-S(O)_2CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-OCH_2CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-SCH_2CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-S(O)_2CH_2CH_3$, $-(CH_2)_{1-2}-NH-CH_3$, 또는 $-(CH_2)_{1-2}-N(CH_3)_2$ 이다.
- [0291] 구체예 34: 구체예 2 내지 33의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0292] R^4 는 -메틸, -에틸, -이소프로필, -이소부틸, $-CH_2CH_2-OCH_3$, $-CH_2CH_2-F$, 또는 $-CH_2CH_2-NH_2$ 이다.
- [0293] 구체예 35: 구체예 2 내지 34의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0294] R^4 는 -메틸, -에틸, -이소프로필, 또는 -이소부틸이다.
- [0295] 구체예 36: 구체예 2 내지 35의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0296] R^4 는 -메틸이다.
- [0297] 구체예 37: 구체예 2 내지 35의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0298] R^4 는 -에틸이다.
- [0299] 구체예 38: 구체예 2 내지 33의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0300] R^4 는 $-(CH_2)_2-OCH_3$, $-(CH_2)_2-F$, $-(CH_2)_2-Cl$, $-(CH_2)_2-OCF_3$, $-(CH_2)_2-NH_2$, $-(CH_2)_2-CN$, $-(CH_2)_2-OH$, $-(CH_2)_2-CF_3$, $-(CH_2)_2-CO_2H$, $-(CH_2)_2-SH$, $-(CH_2)_2-SCH_3$, 또는 $-(CH_2)_2-S(O)_2CH_3$ 이다.
- [0301] 구체예 39: 구체예 2 내지 38의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0302] R^1 은 수소, $-OCH_3$, $-F$, $-Cl$, $-NH_2$, -시아노, $-OH$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-SH$, $-S-C_{1-6}$ 알킬, $-S(O)_2-C_{1-6}$ 알킬, $-CO_2H$, $-NH-C_{1-6}$ 알킬, $-N(C_{1-6}알킬)_2$, 및 $-NH-C_{1-6}알킬$ 로부터 독립적으로 선택된다.
- [0303] 구체예 40: 구체예 2 내지 38의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0304] R^1 은 $-OCH_3$, $-F$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-N(CH_3)_2$, $-N(CH_2CH_3)_2$, 및 $-N(CH_3)(CH_2CH_3)$ 로부터 독립적으로 선택된다.
- [0305] 구체예 41: 구체예 2 내지 38의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0306] R^1 은 수소, $-OCH_3$, 및 $-F$ 로부터 독립적으로 선택된다.
- [0307] 구체예 42: 구체예 2 내지 38의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0308] R^1 은 수소이다.
- [0309] 구체예 43: 구체예 2 내지 41의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0310] 하나 이하의 R^1 치환기는 수소가 아니다.
- [0311] 구체예 44: 구체예 2 내지 43의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0312] G는 수소, $-C_{1-8}$ 알킬, $-C_{3-10}$ 시클로알킬, $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-8} 시클로알킬, 헤테로사이클일, 또는 NR^hR^k 이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은 G는 $-CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2CH_2Y^3$, $-CH(CH_3)CH_2Y^3$, $-CH_2CH(Y^3)CH_3$, $-CH(Y^3)CH_3$, $-CH_2C(Y^3)(CH_3)_2$, $-C(Y^3)(CH_3)_2$, 또는 Δ^{Y^3} 이고, 여기서 Y^3 는 -시클로프로필, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-F$, $-Cl$, $-OH$, $-O(CH_2)_2-OH$, $-O(CH_2)_2-F$, $-SCH_3$, $-S(O)_2-CH_3$, $-SCH_2CH_3$, $-S(O)_2CH_2CH_3$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, 테트라히드로피란-4-일, 테트라히드로푸란-2-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-4-일, 피페리딘-1-일, 4-히드록시-피페리딘-1-일, 3-히드록시-피페리딘-1-일, $-NH-C(O)-CH_3$, $-NH-C(O)-CH_2CH_3$, 테트라히드로푸란-2-일-메틸옥시, 또는 $-C(O)-Y^4$ 이고, 여기서 Y^4 는 $-OH$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-OC(CH_3)_3$, $-NH_2$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, $-N(CH_2CH_3)_2$, 모르폴린-4-일, 4-메틸-피페라진-1-일, 피롤리딘-1-일, 또는 피페라진-1-일이고;
- [0313] L은 $-CH_2-C(O)N(R^6)-$, $-C(O)N(R^6)-$, $-C(O)-O-$, $-SO_2-$, $-C(O)-$, 또는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로사이클일렌이고; 혹은 $-L-G$ 기는 -시아노이고;
- [0314] R^1 은 수소 또는 R^3 이고;
- [0315] R^c 는
- [0316] a) -할로젠,
- [0317] b) $-C_{1-6}$ 알킬,
- [0318] c) $-C_{3-10}$ 시클로알킬,
- [0319] d) -헤테로사이클일,
- [0320] e) -시아노,
- [0321] f) $-CF_3$,
- [0322] g) $-OCF_3$,
- [0323] h) $-O-R^h$,
- [0324] i) $-S(O)_w-R^h$,
- [0325] j) $-S(O)_2O-R^h$,

- [0326] k) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0327] l) $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0328] m) $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0329] n) $-\text{OC}(\text{O})-\text{R}^{\text{h}}$,
- [0330] o) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0331] p) $-\text{C}(\text{O})$ -헤테로사이클일,
- [0332] q) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{R}^{\text{k}}$,
- [0333] r) $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$,
- [0334] s) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{OR}^{\text{k}}$,
- [0335] t) $-\text{NR}^{\text{h}}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$, 또는
- [0336] u) $-\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{알킬렌})-\text{O}-(\text{C}_{1-4}\text{알킬렌})-\text{N}(\text{R}^{\text{h}})\text{C}(\text{O})-\text{OR}^{\text{k}}$ 이고,
- [0337] 여기서 알킬렌, 알킬, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^{x} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0338] R^{h} 및 R^{k} 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, 또는 C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬, 및 시클로알킬기는 R^{x} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^{h} 및 R^{k} 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오모르폴리노, 및 아제파노로 구성된 군으로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^{x} 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0339] R^{x} 는 R^{y} 이다.
- [0340] 구체예 45: 구체예 2 내지 44의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0341] $-\text{L}-\text{G}$ 는 $-\text{시아노}$ 가 아니다.
- [0342] 구체예 46: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0343] $-\text{L}-\text{G}$ 는 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 이다.
- [0344] 구체예 47: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0345] L 은 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$ 또는 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$ 이다.
- [0346] 구체예 48: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0347] L 은 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$ 이다.
- [0348] 구체예 49: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0349] L 은 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$ 가 아니다.
- [0350] 구체예 50: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0351] L 은 $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$ 이다.

- [0352] 구체예 51: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0353] L은 $-C(O)-$ 이다.
- [0354] 구체예 52: 구체예 2 내지 45의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0355] L은 $-S(O)_2-$ 이다.
- [0356] 구체예 53: 구체예 2 내지 43의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0357] L은 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로아틸렌이다.
- [0358] 구체예 54: 구체예 2 내지 53의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0359] R^6 는 수소이다.
- [0360] 구체예 55: 구체예 2 내지 53의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0361] R^6 는 수소 또는 -메틸이다.
- [0362] 구체예 56: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0363] G는 수소, $-C_{1-8}$ 알킬, $-C_{3-10}$ 시클로알킬, 또는 $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-8} 시클로알킬이고, 여기서 알킬, 시클로알킬, 및 알킬렌기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0364] 구체예 57: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0365] G는 $-H$, -메틸, -에틸, -n-프로필, -이소프로필, -이소부틸, $-CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2Y^3$, $-CH_2CH_2CH_2Y^3$, $-CH(CH_3)CH_2Y^3$, $-CH_2CH(Y^3)CH_3$, $-CH(Y^3)CH_3$, $-CH_2C(Y^3)(CH_3)_2$, 또는 $-C(Y^3)(CH_3)_2$ 이고, 여기서 Y^3 는 -시클로프로필, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-F$, $-OH$, $-O(CH_2)_2-OH$, $-O(CH_2)_2-F$, $-SCH_3$, $-S(O)_2-CH_3$, $-SCH_2CH_3$, $-S(O)_2CH_2CH_3$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, $-NH-C(O)-CH_3$, $-NH-C(O)-CH_2CH_3$, 또는 $C(O)-Y^4$ 이고, 여기서 Y^4 는 $-OH$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-OC(CH_3)_3$, $-NH_2$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, $-N(CH_3)_2$, 또는 $-N(CH_2CH_3)_2$ 이다.
- [0366] 구체예 58: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0367] G는 -메틸, -에틸, -n-프로필, -이소프로필, 또는 -이소부틸이고, 여기서 각각은 $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-F$, $-OH$, $-O(CH_2)_2-OH$, $-O(CH_2)_2-F$, $-SCH_3$, $-SCH_2CH_3$, $-NH-CH_3$, $-NH-CH_2CH_3$, 및 $-N(CH_3)_2$ 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0368] 구체예 59: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0369] G는 H이다.
- [0370] 구체예 60: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0371] G는 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된 C_{1-8} 알킬이다.
- [0372] 구체예 61: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0373] G는 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된 C_{3-10} 시클로알킬이다.
- [0374] 구체예 62: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0375] G는 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로사이클일이다.
- [0376] 구체예 63: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0377] G는 할로젠으로 한번 이상 선택적으로 치환된 $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬이다.
- [0378] 구체예 64: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0379] G 는 NR^hR^k 이다.
- [0380] 구체예 65: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0381] G 는 $-CH_2-R^c$ 이다.
- [0382] 구체예 66: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0383] G 는 $-CH_2CH_2-R^c$ 이다.
- [0384] 구체예 67: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0385] G 는 $-CH_2CH_2CH_2-R^c$ 이다.
- [0386] 구체예 68: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0387] G 는 $-CH(CH_3)CH_2R^c$ 이다.
- [0388] 구체예 69: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0389] G 는 $-CH_2CH(R^c)CH_3$ 이다.
- [0390] 구체예 70: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0391] G 는 $-CH(R^c)CH_3$ 이다.
- [0392] 구체예 71: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0393] G 는 $-CH_2C(R^c)(CH_3)_2$ 이다.
- [0394] 구체예 72: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0395] G 는 $-C(R^c)(CH_3)_2$ 이다.
- [0396] 구체예 73: 구체예 2 내지 55의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0397] G 는 이미다졸-2-일, 티아졸-2일, 옥사졸-2-일, 피라졸-1-일, 푸란-2일, 티오펜-2-일, 피롤-1-일, 1H-1,2,4-트리아졸일-3-일, 5-메틸-1H-1,2,4-트리아졸일-3-일, $-(CH_2)_{1-3}$ -(이미다졸-2-일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(티아졸-2일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(옥사졸-2-일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(피라졸-1-일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(푸란-2일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(티오펜-2-일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(피롤-1-일), $-(CH_2)_{1-3}$ -(1H-1,2,4-트리아졸일-3-일), 또는 $-(CH_2)_{1-3}$ -(5-메틸-1H-1,2,4-트리아졸일-3-일)이다.
- [0398] 구체예 74: 구체예 2 내지 73의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0399] 화합물은 그것의 유리(비염)형으로 있다.
- [0400] 구체예 75: 구체예 2 내지 73의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0401] 화합물은 약학적으로 허용가능한 염형으로 있다.
- [0402] 구체예 76: 구체예 1 내지 75의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0403] 화합물에 존재하는 어떤 "헤테로사이클일"기는 아제티딘-1-일, 아제티딘-2-일, 아제티딘-3-일, 피롤리딘-1-일, 피롤리딘-2-일, 피롤리딘-3-일, 테트라히드로푸란-2-일, 테트라히드로푸란-3-일, 테트라히드로티오펜-2-일, 테트라히드로티오펜-3-일, 피라졸리딘-1-일, 피라졸리딘-3-일, 피라졸리딘-4-일, 이미다졸리딘-1-일, 이미다졸리딘-2-일, 이미다졸리딘-4-일, 옥사졸리딘-2-일, 옥사졸리딘-3-일, 옥사졸리딘-4-일, 옥사졸리딘-5-일, 이소옥사졸리딘-2-일, 이소옥사졸리딘-3-일, 이소옥사졸리딘-4-일, 이소옥사졸리딘-5-일, 티아졸리딘-2-일, 티아졸리딘-3-일, 티아졸리딘-4-일, 티아졸리딘-5-일, 이소티아졸리딘-2-일, 이소티아졸리딘-3-일, 이소티아졸리딘-4-일, 이소티아졸리딘-5-일, 1,3-디옥소란-2-일, 1,3-디옥소란-4-일, 1,3-옥사티오란-2-일, 1,3-옥사티오란-4-일,

1,3-옥사티오란-5-일, 1,2-디티오란-3-일, 1,2-디티오란-4-일, 1,3-디티오란-2-일, 1,3-디티오란-4-일, 피페리딘-1-일, 피페리딘-2-일, 피페리딘-3-일, 피페리딘-4-일, 테트라히드로피란-2-일, 테트라히드로피란-3-일, 테트라히드로피란-4-일, 티안-2-일, 티안-3-일, 티안-4-일, 피페라진-1-일, 피페라진-2-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-3-일, 모르폴린-4-일, 티오모르폴린-2-일, 티오모르폴린-3-일, 티오모르폴린-4-일, 1,4-디옥산-2-일, 1,3-디옥산-2-일, 1,3-디옥산-4-일, 1,3-디옥산-5-일, 1,4-디티안-2-일, 1,3-디티안-2-일, 1,3-디티안-4-일, 1,3-디티안-5-일, 1,2-디티안-3-일, 1,2-디티안-4-일, 아제판-1-일, 아제판-2-일, 아제판-3-일, 및 아제판-4-일로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 이들 지정고리 각각은 할로젠, -NH₂, 시아노, 카르복시, C₁₋₄알킬, C₃₋₁₀시클로알킬, 히드록실, 티올, -CF₃, -OCF₃, -O-C₁₋₄알킬, -NH-C₁₋₄알킬, -N(C₁₋₄알킬)₂, -S-C₁₋₄알킬, -S(O)₂-C₁₋₄알킬, -C(O)-C₁₋₄알킬, -C(O)O-C₁₋₄알킬, -C(O)NH₂, -C(O)NH-C₁₋₄알킬, 및 -C(O)N(C₁₋₄알킬)₂로부터 독립적으로 선택된 치환기와 한번 이상 선택적으로 치환될 수 있고, 여기서 이들 지정 고리의 어떤 것에서 어떤 질소 원자는 화학적으로 가능할 때 선택적으로 산화될 수 있고, 여기서 이들 지정 고리의 어떤 것에서 어떤 황 원자는 화학적으로 가능할 때 선택적으로 한번 또는 2번 산화될 수 있다.

[0404] 구체예 77: 구체예 1 내지 76의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

[0405] 화합물에 존재하는 어떤 "헤테로아릴"기는 1H-피롤-1-일, 1H-피롤-2-일, 1H-피롤-3-일, 푸란-2-일, 푸란-3-일, 티오펜-2-일, 티오펜-3-일, 1H-이미다졸-1-일, 1H-이미다졸-2-일, 1H-이미다졸-4-일, 1H-이미다졸-5-일, 1H-피라졸-1-일, 1H-피라졸-3-일, 1H-피라졸-4-일, 1H-피라졸-5-일, 옥사졸-2-일, 옥사졸-4-일, 옥사졸-5-일, 티아졸-2-일, 티아졸-4-일, 티아졸-5-일, 이소옥사졸-3-일, 이소옥사졸-4-일, 이소옥사졸-5-일, 이소티아졸-3-일, 이소티아졸-4-일, 이소티아졸-5-일, 1H-1,2,3-트리아졸-1-일, 1H-1,2,3-트리아졸-4-일, 1H-1,2,3-트리아졸-5-일, 1H-1,2,4-트리아졸-1-일, 1H-1,2,4-트리아졸-3-일, 1H-1,2,4-트리아졸-5-일, 푸라잔-3-일, 피리딘-2-일, 피리딘-3-일, 피리딘-4-일, 피리다진-3-일, 피리다진-4-일, 피리미딘-2-일, 피리미딘-4-일, 피리미딘-5-일, 피라진-2-일, 1,3,5-트리아진-2-일, 1H-인돌-1-일, 1H-인돌-2-일, 1H-인돌-3-일, 2H-이소인돌-1-일, 2H-이소인돌-2-일, 퀴놀린-2-일, 퀴놀린-3-일, 퀴놀린-4-일, 이소퀴놀린-1-일, 이소퀴놀린-3-일, 이소퀴놀린-4-일, 벤조옥사졸-2-일, 벤조티아졸-2-일, 1H-벤즈이미다졸-1-일, 1H-벤즈이미다졸-2-일, 벤조푸란-2-일, 벤조푸란-3-일, 벤조티오펜-2-일, 및 벤조티오펜-3-일로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 이들 지정 고리의 각각은 할로젠, -NH₂, 시아노, 카르복시, C₁₋₄알킬, C₃₋₁₀시클로알킬, 히드록실, 티올, -CF₃, -OCF₃, -O-C₁₋₄알킬, -NH-C₁₋₄알킬, -N(C₁₋₄알킬)₂, -S-C₁₋₄알킬, -S(O)₂-C₁₋₄알킬, -C(O)-C₁₋₄알킬, -C(O)O-C₁₋₄알킬, -C(O)NH₂, -C(O)NH-C₁₋₄알킬, -C(O)N(C₁₋₄알킬)₂, 및 페닐로부터 독립적으로 선택된 치환기와 한번 이상 선택적으로 치환될 수 있다.

[0406] 구체예 78: 구체예 1 내지 77의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

[0407] 화합물에 존재하는 어떤 "헤테로아릴렌"기는 1H-피롤-2,5-디일, 푸란-2,5-디일, 티오펜-2,5-디일, 1H-이미다졸-2,4-디일, 1H-이미다졸-2,5-디일, 옥사졸-2,4-디일, 옥사졸-2,5-디일, 티아졸-2,4-디일, 티아졸-2,5-디일, 1H-1,2,4-트리아졸-3,5-디일, 및 2H-이소인돌-1,3-디일로 구성된 군으로부터 선택되고, 여기서 이들 지정 고리의 각각은 할로젠, -NH₂, 시아노, 카르복시, -C₁₋₄알킬, -C₃₋₁₀시클로알킬, 히드록실, 티올, -CF₃, -OCF₃, -O-C₁₋₄알킬, -NH-C₁₋₄알킬, -N(C₁₋₄알킬)₂, -S-C₁₋₄알킬, -S(O)₂-C₁₋₄알킬, -C(O)-C₁₋₄알킬, -C(O)O-C₁₋₄알킬, -C(O)NH₂, -C(O)NH-C₁₋₄알킬, -C(O)N(C₁₋₄알킬)₂, 및 페닐로부터 독립적으로 선택된 치환기와 한번 이상 선택적으로 치환될 수 있다.

[0408] 구체예 79: 구체예 1에 따른 화합물이다.

[0409] 구체예 80: 구체예 79에 따른 화합물로서, 여기서

[0410] R³는 수소이다.


[0411] 구체예 81: 구체예 79에 따른 화합물로서, 여기서

[0412] R³는 메틸이다.

[0413] 구체예 82: 구체예 79에 따른 화합물로서, 여기서

[0414] R³는 에틸이다.

- [0415] 구체예 83: 구체예 79에 따른 화합물로서, 여기서
- [0416] R^3 는 이소프로필이다.
- [0417] 구체예 84: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0418] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 는 C-R^1 이다.
- [0419] 구체예 85: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0420] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 및 X^4 는 C-R^1 이고, X^2 는 N이다.
- [0421] 구체예 86: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0422] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 및 X^2 는 C-R^1 이고, X^4 는 N이다.
- [0423] 구체예 87: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0424] X^3 는 C-L-G 이고, X^2 및 X^4 는 C-R^1 이고, X^1 은 N이다.
- [0425] 구체예 88: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0426] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 는 C-R^1 이다.
- [0427] 구체예 89: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0428] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 및 X^4 는 C-R^1 이고, X^3 는 N이다.
- [0429] 구체예 90: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0430] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 및 X^3 는 C-R^1 이고, X^4 는 N이다.
- [0431] 구체예 91: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0432] X^2 는 C-L-G 이고, X^3 및 X^4 는 C-R^1 이고, X^1 은 N이다.
- [0433] 구체예 92: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0434] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 중 2개는 N이다.
- [0435] 구체예 93: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0436] X^3 는 C-L-G 이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 중 2개는 N이다.
- [0437] 구체예 94: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0438] X^2 는 C-L-G 이고, X^1 , X^3 , 및 X^4 는 N이다.
- [0439] 구체예 95: 구체예 79 내지 83의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0440] X^3 는  이고, X^1 , X^2 , 및 X^4 는 N이다.
- [0441] 구체예 96: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0442] v 는 0, 1 또는 2이다.
- [0443] 구체예 97: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0444] v 는 1 또는 2이다.
- [0445] 구체예 98: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0446] v 는 1이다.
- [0447] 구체예 99: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0448] v 는 1이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 5-위치 또는 6-위치에 부착된다.
- [0449] 구체예 100: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0450] v 는 1이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 6-위치에 부착된다.
- [0451] 구체예 101: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0452] v 는 2이고, 하나의 R^2 는 벤조티아졸 고리의 6-위치에 부착된다.
- [0453] 구체예 102: 구체예 79 내지 95의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0454] v 는 2이고, R^2 는 벤조티아졸 고리의 5-위치 및 6-위치에 부착된다.
- [0455] 구체예 103: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0456] R^2 는 -할로젠, $-C_{1-6}$ 알킬, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-OR^f$, 또는 $-S(O)_w-R^f$ 이고, 여기서 알킬기는 R^z 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0457] 구체예 104: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0458] R^2 는 -할로젠, -메틸, 에틸, 이소프로필, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-OCH(CH_3)_2$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-SCF_3$, $-S(O)_2-CH_3$, -O-페닐, -O-(2-피리딜), -O-(3-피리딜), 또는 -O-(4-피리딜)이다.
- [0459] 구체예 105: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0460] R^2 는 -할로젠, -메틸, 에틸, 이소프로필, $-OCH_3$, $-OCH_2CH_3$, $-OCH(CH_3)_2$, $-CF_3$, $-OCF_3$, $-SCF_3$, $-S(O)_2-CH_3$, 또는 -O-(3-피리딜)이다.
- [0461] 구체예 106: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0462] R^2 는 $-Cl$, $-F$, $-CF_3$, 또는 $-OCF_3$ 이다.
- [0463] 구체예 107: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0464] R^2 는 $-OCF_3$ 이다.
- [0465] 구체예 108: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0466] R^2 는 $-CF_3$ 이다.
- [0467] 구체예 109: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0468] R^2 는 $-F$ 이다.

- [0469] 구체예 110: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0470] R^2 는 -Cl이다.
- [0471] 구체예 111: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0472] R^2 는 -SO₂CH₃이다.
- [0473] 구체예 112: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0474] R^2 는 메틸, 에틸, 또는 이소프로필이다.
- [0475] 구체예 113: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0476] R^2 는 메틸이다.
- [0477] 구체예 114: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0478] R^2 는 -OCH₂CH₃이다.
- [0479] 구체예 115: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0480] R^2 는 -O-페닐이다.
- [0481] 구체예 116: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0482] R^2 는 -O-(2-피리딜), -O-(3-피리딜), 또는 -O-(4-피리딜)이다.
- [0483] 구체예 117: 구체예 79 내지 102의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0484] R^2 는 -O-(3-피리딜)이다.
- [0485] 구체예 118: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0486] R^4 는 -메틸, -에틸, -n-프로필, -이소프로필, -n-부틸, -sec-부틸, -이소부틸, -tert-부틸, -(CH₂)₁₋₂-OCH₃, -(CH₂)₁₋₂-F, -(CH₂)₁₋₂-Cl, -(CH₂)₁₋₂-OCF₃, -(CH₂)₁₋₂-NH₂, -(CH₂)₁₋₂-CN, -(CH₂)₁₋₂-OH, -(CH₂)₁₋₂-CF₃, -(CH₂)₁₋₂-CO₂H, -(CH₂)₁₋₂-SH, -(CH₂)₁₋₂-SCH₃, -(CH₂)₁₋₂-S(O)₂CH₃, -(CH₂)₁₋₂-OCH₂CH₃, -(CH₂)₁₋₂-SCH₂CH₃, -(CH₂)₁₋₂-S(O)₂CH₂CH₃, -(CH₂)₁₋₂-NH-CH₃, 또는 -(CH₂)₁₋₂-N(CH₃)₂이다.
- [0487] 구체예 119: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0488] R^4 는 -메틸, -에틸, -이소프로필, -이소부틸, -CH₂CH₂-OCH₃, -CH₂CH₂-F, -CH₂CH₂-NH₂, 또는 -CH₂CH₂-NH-CH₃이다.
- [0489] 구체예 120: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0490] R^4 는 -메틸, -에틸, -이소프로필, 또는 -이소부틸이다.
- [0491] 구체예 121: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0492] R^4 는 -메틸이다.
- [0493] 구체예 122: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0494] R^4 는 -에틸이다.
- [0495] 구체예 123: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0496] R^4 는 -이소프로필이다.
- [0497] 구체예 124: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0498] R^4 는 -이소부틸이다.
- [0499] 구체예 125: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0500] R^4 는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{OCH}_3$ 이다.
- [0501] 구체예 126: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0502] R^4 는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{F}$ 이다.
- [0503] 구체예 127: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0504] R^4 는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NH}_2$ 이다.
- [0505] 구체예 128: 구체예 79 내지 117의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0506] R^4 는 $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{NH}-\text{CH}_3$ 이다.
- [0507] 구체예 129: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0508] R^1 은 독립적으로 수소, $-\text{OCH}_3$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{NH}_2$, -시아노, $-\text{OH}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{SH}$, $-\text{S}-\text{C}_{1-6}$ 알킬, $-\text{S}(\text{O})_2-\text{C}_{1-6}$ 알킬, $-\text{CO}_2\text{H}$, $-\text{NH}-\text{C}_{1-6}$ 알킬, $-\text{N}(\text{C}_{1-6}\text{알킬})_2$, 또는 $-\text{NH}-\text{C}_{1-6}$ 알킬이다.
- [0509] 구체예 130: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0510] R^1 은 독립적으로 $-\text{OCH}_3$, $-\text{F}$, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, 또는 $-\text{N}(\text{CH}_3)(\text{CH}_2\text{CH}_3)$ 이다.
- [0511] 구체예 131: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0512] R^1 은 독립적으로 수소, $-\text{OCH}_3$, 또는 $-\text{F}$ 이다.
- [0513] 구체예 132: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0514] R^1 은 수소이다.
- [0515] 구체예 133: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0516] R^1 은 $-\text{F}$ 이다.
- [0517] 구체예 134: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0518] R^1 은 $-\text{OCH}_3$ 이다.
- [0519] 구체예 135: 구체예 79 내지 128의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0520] R^1 은 $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$ 이다.
- [0521] 구체예 136: 구체예 79 내지 135의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0522] 하나 이하의 R^1 치환기는 수소가 아니다.
- [0523] 구체예 137: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0524] G는 수소, $-\text{C}_{1-8}$ 알킬, $-\text{C}_{3-10}$ 시클로알킬, $-\text{C}_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬, 헤테로사이클일, $-\text{C}_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 헤테로사이클일, 또는 NR^hR^k 이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은 G는 $-\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{Y}^3$, $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{Y}^3$,

$-\text{CH}_2\text{CH}(\text{Y}^3)\text{CH}_3$, $-\text{CH}(\text{Y}^3)\text{CH}_3$, $-\text{CH}_2\text{C}(\text{Y}^3)(\text{CH}_3)_2$, $-\text{C}(\text{Y}^3)(\text{CH}_3)_2$, 또는 Y^3 이고, 여기서 Y^3 는 시클로프로필, $-\text{CF}_3$, $-\text{OCF}_3$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{F}$, $-\text{Cl}$, $-\text{OH}$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{OH}$, $-\text{O}(\text{CH}_2)_2\text{F}$, $-\text{SCH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$, $-\text{SCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{NH-CH}_3$, $-\text{NH-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, 테트라히드로피란-4-일, 테트라히드로푸란-2-일, 모르폴린-2-일, 모르폴린-4-일, 피페리딘-1-일, 4-히드록시-피페리딘-1-일, 3-히드록시-피페리딘-1-일, $-\text{NH-C}(\text{O})-\text{CH}_3$, $-\text{NH-C}(\text{O})-\text{CH}_2\text{CH}_3$, 테트라히드로푸란-2-일-메틸옥시, 또는 $-\text{C}(\text{O})-\text{Y}^4$ 이고, 여기서 Y^4 는 $-\text{OH}$, $-\text{OCH}_3$, $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$, $-\text{OC}(\text{CH}_3)_3$, $-\text{NH}_2$, $-\text{NH-CH}_3$, $-\text{NH-CH}_2\text{CH}_3$, $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$, $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_3)_2$, 모르폴린-4-일, 4-메틸-피페라진-1-일, 피롤리딘-1-일, 또는 피페라진-1-일이고;

[0525] L은 $-\text{CH}_2\text{-C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$, $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^6)-$, $-\text{C}(\text{O})-\text{O}-$, $-\text{SO}_2-$, $-\text{C}(\text{O})-$, 또는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로사이클일렌이고; 혹은 $-\text{L-G}$ 기는 -시아노이고;

[0526] R^1 은 수소 또는 R^a 이고;

[0527] R^c 는

[0528] a) -할로젠,

[0529] b) $-\text{C}_{1-6}$ 알킬,

[0530] c) $-\text{C}_{3-10}$ 시클로알킬,

[0531] d) -헤테로사이클일,

[0532] e) -시아노,

[0533] f) $-\text{CF}_3$,

[0534] g) $-\text{OCF}_3$,

[0535] h) $-\text{O-R}^h$,

[0536] i) $-\text{S}(\text{O})_w\text{-R}^h$,

[0537] j) $-\text{S}(\text{O})_2\text{O-R}^h$,

[0538] k) $-\text{NR}^h\text{R}^k$,

[0539] l) $-\text{C}(\text{O})-\text{R}^h$,

[0540] m) $-\text{C}(\text{O})-\text{O-R}^h$,

[0541] n) $-\text{OC}(\text{O})-\text{R}^h$,

[0542] o) $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^k$,

[0543] p) $-\text{C}(\text{O})$ -헤테로사이클일,

[0544] q) $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{R}^k$,

[0545] r) $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^k$,

[0546] s) $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{OR}^k$,

[0547] t) $-\text{NR}^h\text{C}(\text{O})\text{NR}^h\text{R}^k$,

- [0548] u) $-NR^hS(O)_wR^k$, 또는
- [0549] v) $-O-(C_{1-4}\text{알킬렌})-O-(C_{1-4}\text{알킬렌})-N(R^h)C(O)-OR^k$ 이고,
- [0550] 여기서 알킬렌, 알킬, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0551] R^h 및 R^k 는 독립적으로 수소, C_{1-6} 알킬, C_{3-10} 시클로알킬, 또는 헤테로사이클일이고, 여기서 알킬, 시클로알킬, 및 헤테로사이클일기는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고; 혹은, R^h 및 R^k 둘 다 동일한 질소 원자에 부착된 경우, 질소 원자와 함께 아제티디노, 피롤리디노, 피라졸리디노, 이미다졸리디노, 옥사졸리디노, 이소옥사졸리디노, 티아졸리디노, 이소티아졸리디노, 피페리디노, 피페라지노, 모르폴리노, 티오 모르폴리노, 및 아제파노로부터 선택된 헤테로환 고리를 선택적으로 형성할 수 있고, 여기서 각 고리는 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환되고;
- [0552] R^x 는 R^y 이다.
- [0553] 구체예 137: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0554] $-L-G$ 는 $-시아노$ 가 아니다.
- [0555] 구체예 138: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0556] L 은 $-C(O)N(R^6)-$ 이다.
- [0557] 구체예 139: 구체예 138에 따른 화합물로서, 여기서
- [0558] R^6 는 수소다.
- [0559] 구체예 140: 구체예 138에 따른 화합물로서, 여기서
- [0560] R^6 는 메틸이다.
- [0561] 구체예 141: 구체예 140에 따른 화합물로서, 여기서
- [0562] G 는 $-N(CH_3)_2$ 이다.
- [0563] 구체예 142: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0564] $-L-G$ 는 $-C(O)NR^hR^k$ 이다.
- [0565] 구체예 143: 구체예 142에 따른 화합물로서, 여기서
- [0566] NR^hR^k 는 피롤리디노, 피페리디노, 피페라지노, 4-메틸-피페라지노, 또는 모르폴리노이고, 여기서 하기 각각은 $-(CH_2)_{1-3}-OH$ 로 선택적으로 한번 치환된다.
- [0567] 구체예 144: 구체예 143에 따른 화합물로서, 여기서
- [0568] NR^hR^k 는 피롤리디노, 4-(2-히드록시에틸)-피페라지노, 또는 4-(3-히드록시프로필)-피페리디노이다.
- [0569] 구체예 145: 구체예 142에 따른 화합물로서, 여기서
- [0570] NR^hR^k 는 $N[(CH_2)_2-OH]_2$ 이다.
- [0571] 구체예 146: 구체예 79 내지 137의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0572] L 은 $-CH_2-C(O)N(R^6)-$ 가 아니다.

- [0573] 구체예 147: 구체예 79 내지 146의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0574] L은 헥테로사이클릴렌이 아니다.
- [0575] 구체예 148: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0576] L은 $-S(O)_2-$ 이다.
- [0577] 구체예 149: 구체예 148에 따른 화합물로서, 여기서
- [0578] G는 메틸 또는 $-CF_3$ 이다.
- [0579] 구체예 150: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0580] L은 R^x 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헥테로아틸렌이다.
- [0581] 구체예 151: 구체예 150에 따른 화합물로서, 여기서
- [0582] $-L-G$ 는 이미다졸-2-일, 1,2,4-트리아졸-3-일, 또는 5-메틸-1,2,4-트리아졸-3-일이다.
- [0583] 구체예 152: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0584] L은 $-C(O)-O-$ 이다.
- [0585] 구체예 153: 구체예 152에 따른 화합물로서, 여기서
- [0586] G는 수소, 또는 $-C_{1-8}$ 알킬이고, 여기서 알킬기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0587] 구체예 154: 구체예 153에 따른 화합물로서, 여기서
- [0588] G는 메틸 또는 에틸이다.
- [0589] 구체예 155: 구체예 153에 따른 화합물로서, 여기서
- [0590] G는 수소다.
- [0591] 구체예 156: 구체예 79 내지 139의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0592] G는 $-C_{1-8}$ 알킬, $-C_{3-10}$ 시클로알킬, $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬, 헥테로사이클릴, 또는 $-C_{1-6}$ 알킬렌- C_{3-10} 헥테로사이클릴이고, 여기서 알킬, 알킬렌, 시클로알킬, 및 헥테로사이클릴기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0593] 구체예 157: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0594] G는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0595] 구체예 158: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0596] G는 메틸, 에틸, 이소프로필, n-프로필, n-부틸, sec-부틸, 또는 이소부틸이다.
- [0597] 구체예 159: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0598] G는 메틸, 에틸, 또는 n-프로필이다.
- [0599] 구체예 160: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0600] G는 2-플루오로에틸, 2,2-디플루오로에틸, 또는 2,2,2-트리플루오로에틸이다.
- [0601] 구체예 161: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0602] G는 2-시아노에틸이다.
- [0603] 구체예 162: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서

- [0604] G는 $-C(O)-O-R^h$ 에 의해 한번 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0605] 구체예 163: 구체예 162에 따른 화합물로서, 여기서
- [0606] G는 $-CH_2-C(O)-O-R^h$ 이다.
- [0607] 구체예 164: 구체예 163에 따른 화합물로서, 여기서
- [0608] R^h 는 수소 또는 메틸이다.
- [0609] 구체예 165: 구체예 162에 따른 화합물로서, 여기서
- [0610] G는 $-CH_2CH_2-C(O)-O-R^h$ 이다.
- [0611] 구체예 166: 구체예 165에 따른 화합물로서, 여기서
- [0612] R^h 는 수소 또는 메틸이다.
- [0613] 구체예 167: 구체예 162에 따른 화합물로서, 여기서
- [0614] G는 $-C(CH_3)_2-C(O)-O-R^h$ 이다.
- [0615] 구체예 168: 구체예 167에 따른 화합물로서, 여기서
- [0616] R^h 는 수소 또는 메틸이다.
- [0617] 구체예 169: 구체예 162에 따른 화합물로서, 여기서
- [0618] G는 $-CH(CH_3)-C(O)-O-R^h$ 이다.
- [0619] 구체예 170: 구체예 169에 따른 화합물로서, 여기서
- [0620] R^h 는 수소 또는 메틸이다.
- [0621] 구체예 171: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0622] G는 $-C(O)NR^hR^k$ 에 의해 한번 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0623] 구체예 172: 구체예 171에 따른 화합물로서, 여기서
- [0624] G는 $CH_2-C(O)-NR^hR^k$ 이다.
- [0625] 구체예 173: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0626] NR^hR^k 는 메틸아미노, 디메틸아미노, 또는 디에틸아미노이다.
- [0627] 구체예 174: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0628] NR^hR^k 는 티오모르폴리노 또는 1,1-디옥소티오모르폴리노이다.
- [0629] 구체예 175: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0630] NR^hR^k 는 모르폴리노, 피롤리디노, 피페리디노, 피페라지노, 또는 4-메틸피페라지노이다.
- [0631] 구체예 176: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0632] NR^hR^k 는 피롤리디노, 3-히드록시-피롤리디노, 3-메톡시-피롤리디노, 3-아미노-피롤리디노, 3-(메틸아미노)-피롤리디노, 3-(디메틸아미노)-피롤리디노, 2-(히드록시메틸)-피롤리디노, 2-(디메틸아미노카보닐)-피롤리디노 또는 3,4-디히드록시-피롤리디노이다.

- [0633] 구체예 177: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0634] NR^hR^k 는 피페라지노, 4-메틸피페라지노, 4-(메틸술포닐)-피페라지노, 또는 4-(디메틸아미노술포닐)-피페라지노이다.
- [0635] 구체예 178: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0636] NR^hR^k 는 피페리디노, 3-히드록시피페리디노, 4-히드록시피페리디노, 2-(히드록시메틸)-피페리디노, 3-(히드록시메틸)-피페리디노, 4-(히드록시메틸)-피페리디노, 3-메톡시-피페리디노, 4-(메톡시메틸)-피페리디노, 4-(플루오로메틸)-피페리디노, 4-(트리플루오로메틸)-피페리디노, 4-시아노-피페리디노, 4-카바모일-피페리디노, 4-(메틸아미노)-피페리디노, 4-(디메틸아미노)-피페리디노, 4-(메틸아미노메틸)-피페리디노, 또는 4-(디메틸아미노메틸)-피페리디노이다.
- [0637] 구체예 179: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0638] NR^hR^k 는 NHR^k 이고, 여기서 R^k 는 2-히드록시프로필, 2-(메틸술포닐)-에틸, 테트라히드로푸란-3-일, 테트라히드로피란-4-일, 1-메틸피페리딘-4-일, 피페리딘-3-일, 또는 1-메틸피페리딘-3-일이다.
- [0639] 구체예 180: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0640] NR^hR^k 는 $N(CH_3)R^k$ 이고, 여기서 R^k 는 2-히드록시에틸, 테트라히드로피란-4-일, 피롤리딘-3-일, 1-메틸피롤리딘-3-일, 또는 피페라진-3-일이다.
- [0641] 구체예 181: 구체예 172에 따른 화합물로서, 여기서
- [0642] NR^hR^k 는 $N(CH_2CH_2OH)_2$ 이다.
- [0643] 구체예 182: 구체예 171에 따른 화합물로서, 여기서
- [0644] G는 $-(CH_2)_{2-3}-C(O)-N(CH_3)_2$ 이다.
- [0645] 구체예 183: 구체예 171에 따른 화합물로서, 여기서
- [0646] G는 $-(CH_2)_3-C(O)-(4\text{-메틸피페라지노})$ 이다.
- [0647] 구체예 184: 구체예 171에 따른 화합물로서, 여기서
- [0648] G는 $-CH(CH_3)-C(O)-NR^hR^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 메틸아미노, 디메틸아미노, 4-메틸피페라지노, 또는 모르폴리노이다.
- [0649] 구체예 185: 구체예 171에 따른 화합물로서, 여기서
- [0650] G는 $-C(CH_3)_2-C(O)-N(CH_3)_2$ 이다.
- [0651] 구체예 186: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0652] G는 $-CH-[C(O)-N(CH_3)_2]-[CH_2OH]$, $-CH-[C(O)-N(CH_3)_2]-[(CH_2)_4-NH_2]$, 또는 $-CH-[C(O)-N(CH_3)_2]-[(CH_2)_4-N(CH_3)_2]$ 이다.
- [0653] 구체예 187: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0654] G는 $-OR^h$ 에 의해 한번 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0655] 구체예 188: 구체예 187에 따른 화합물로서, 여기서
- [0656] G는 $-(CH_2)_2-O-R^h$ 이다.
- [0657] 구체예 189: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서

- [0658] R^h 는 수소, 메틸, 또는 에틸이다.
- [0659] 구체예 190: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0660] R^h 는 트리플루오로메틸, 2-플루오로에틸, 3-플루오로프로필, 또는 2,2-디플루오로에틸이다.
- [0661] 구체예 191: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0662] R^h 는 테트라히드로푸란-2-일메틸이다.
- [0663] 구체예 192: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0664] R^h 는 2-히드록시에틸이다.
- [0665] 구체예 193: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0666] R^h 는 3-히드록시프로필이다.
- [0667] 구체예 194: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0668] R^h 는 2-메톡시에틸이다.
- [0669] 구체예 195: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0670] R^h 는 2-(2-히드록시에톡시)-에틸이다.
- [0671] 구체예 196: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0672] R^h 는 2-히드록시프로필 또는 1-히드록시프로프-2-일이다.
- [0673] 구체예 197: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0674] R^h 는 2-시아노에틸, 2-(메틸카보닐아미노)-에틸, 또는 2-(메틸술폰닐아미노)-에틸이다.
- [0675] 구체예 198: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0676] R^h 는 2-아미노에틸, 2-(메틸아미노)-에틸, 또는 2-(디메틸아미노)-에틸이다.
- [0677] 구체예 199: 구체예 188에 따른 화합물로서, 여기서
- [0678] R^h 는 카바모일메틸이다.
- [0679] 구체예 200: 구체예 187에 따른 화합물로서, 여기서
- [0680] G 는 $-(CH_2)_3-O-R^h$ 이다.
- [0681] 구체예 201: 구체예 200에 따른 화합물로서, 여기서
- [0682] R^h 는 수소, 메틸, 또는 에틸이다.
- [0683] 구체예 202: 구체예 200에 따른 화합물로서, 여기서
- [0684] R^h 는 2-히드록시에틸이다.
- [0685] 구체예 203: 구체예 187에 따른 화합물로서, 여기서
- [0686] G 는 $-(CH_2)_4-OH$, $-(CH_2)_5-OH$, $-CH_2C(CH_3)_2-OH$, $-CH_2C(CH_3)_2-OCH_3$, $-CH_2C(CH_3)_2-CH_2-OH$, $-CH(CH_3)-CH_2-OCH_3$, $-(CH_2)_3C(CH_3)_2-CH_2-OH$, $-(CH_2)_2CH(CH_3)-CH_2-OH$, 또는 $-(CH_2)_2CH(CH_3)-OH$ 이다.
- [0687] 구체예 204: 구체예 187에 따른 화합물로서, 여기서

- [0688] G는 $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{O}-\text{R}^{\text{h}}$ 이다.
- [0689] 구체예 205: 구체예 204에 따른 화합물로서, 여기서
- [0690] R^{h} 는 수소, 메틸, 또는 에틸이다.
- [0691] 구체예 206: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0692] G는 $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{CH}_2-\text{OH}$ 이다.
- [0693] 구체예 207: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0694] G는 $-\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 에 의해 한번 치환된 $-\text{C}_{1-8}$ 알킬이다.
- [0695] 구체예 208: 구체예 207에 따른 화합물로서, 여기서
- [0696] G는 $-(\text{CH}_2)_2-\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 이다.
- [0697] 구체예 209: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0698] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 아미노, 메틸아미노, 또는 디메틸아미노이다.
- [0699] 구체예 210: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0700] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 메틸카보닐아미노이다.
- [0701] 구체예 211: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0702] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 (디메틸아미노)메틸카보닐아미노, 히드록시메틸카보닐아미노, 또는 1-히드록시메틸카보닐아미노이다.
- [0703] 구체예 212: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0704] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 메틸술폰아미노이다.
- [0705] 구체예 213: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0706] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 피페리디노, 4-히드록시피페리디노, 또는 3-히드록시피페리디노이다.
- [0707] 구체예 214: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0708] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 피페리디노, 4,4-디플루오로피페리디노, 또는 3,3-디플루오로피페리디노이다.
- [0709] 구체예 215: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0710] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 2-옥소-피롤리디노, 2-옥소-이미다졸리디노, 또는 3-옥소-피페라지노이다.
- [0711] 구체예 216: 구체예 208에 따른 화합물로서, 여기서
- [0712] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 피페라지노, 4-메틸피페라지노, 모르폴리노, 또는 1,1-디옥소-티오모르폴리노이다.
- [0713] 구체예 217: 구체예 207에 따른 화합물로서, 여기서
- [0714] G는 $-(\text{CH}_2)_3-\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 이다.
- [0715] 구체예 218: 구체예 217에 따른 화합물로서, 여기서
- [0716] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 아미노, 디메틸아미노, 또는 디에틸아미노이다.
- [0717] 구체예 219: 구체예 217에 따른 화합물로서, 여기서
- [0718] $\text{NR}^{\text{h}}\text{R}^{\text{k}}$ 는 피페리디노, 4-메틸피페라지노, 또는 모르폴리노이다.

- [0719] 구체예 220: 구체예 207에 따른 화합물로서, 여기서
- [0720] G 는 $-(CH_2)_4-NR^hR^k$ 이다.
- [0721] 구체예 221: 구체예 220에 따른 화합물로서, 여기서
- [0722] NR^hR^k 는 아미노, 디메틸아미노, 또는 디에틸아미노이다.
- [0723] 구체예 222: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0724] G 는 $-C_{1-6}$ 알킬렌-헤테로사이클일이고, 여기서 알킬렌 및 헤테로사이클일기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0725] 구체예 223: 구체예 222에 따른 화합물로서, 여기서
- [0726] G 는 $-CH_2$ -헤테로사이클일이고, 여기서 헤테로사이클일기는 R^c 로부터 선택된 치환기로 한번 선택적으로 치환된다.
- [0727] 구체예 224: 구체예 223에 따른 화합물로서, 여기서
- [0728] 헤테로사이클일기는 테트라히드로피란-4-일, 테트라히드로푸란-2-일, 1,4-디옥산-2-일, 모르폴린-2-일, 테트라히드로피란-2-일, 피페리딘-4-일, 1-(2-히드록시에틸)-피페리딘-4-일, 1-(디메틸아미노메틸카보닐)-피페리딘-4-일, 피페라진-2-일, 또는 1-메틸-피페라진-2-일이다.
- [0729] 구체예 225: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0730] G 는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 C_{3-10} 시클로알킬이다.
- [0731] 구체예 226: 구체예 225에 따른 화합물로서, 여기서
- [0732] G 는 4-히드록시-시클로헥실, 4-카르복시-시클로헥실, 또는 4-(디메틸아미노카보닐)-시클로헥실이다.
- [0733] 구체예 227: 구체예 225에 따른 화합물로서, 여기서
- [0734] G 는 1-카르복시-시클로프로필, 1-(에톡시카보닐)-시클로프로필, 또는 1-(디메틸아미노-카보닐)-시클로프로필이다.
- [0735] 구체예 228: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0736] G 는 C_{1-6} 알킬렌- C_{3-10} 시클로알킬이고, 여기서 알킬렌 및 시클로알킬기는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0737] 구체예 229: 구체예 228에 따른 화합물로서, 여기서
- [0738] G 는 $-CH_2$ -(4-히드록시-시클로헥실)이다.
- [0739] 구체예 230: 구체예 228에 따른 화합물로서, 여기서
- [0740] G 는 $-(CH_2)_2$ -(4-히드록시-시클로헥실)이다.
- [0741] 구체예 231: 구체예 228에 따른 화합물로서, 여기서
- [0742] G 는 $-CH_2$ -[4-(히드록시메틸)-시클로헥실]이다.
- [0743] 구체예 232: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0744] G 는 R^c 로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된 헤테로사이클일이다.
- [0745] 구체예 233: 구체예 232에 따른 화합물로서, 여기서
- [0746] G 는 피페리딘-4-일, 1-메틸-피페리딘-4-일, 1-카르복시-피페리딘-4-일, 1-(메틸술포닐)-피페리딘-4-일, 1-(2-히드록시에틸)-피페리딘-4-일, 1-(디메틸-아미노카보닐)피페리딘-4-일, 또는 1-(디메틸아미노메틸카보닐)-피페리

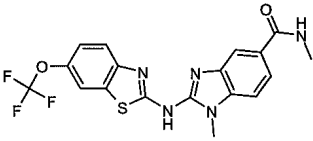
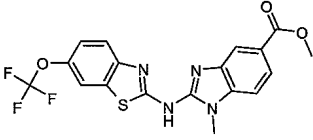
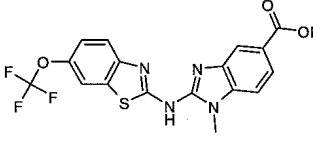
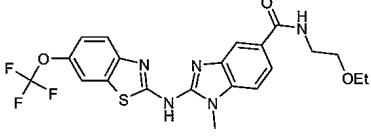
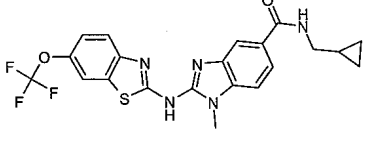
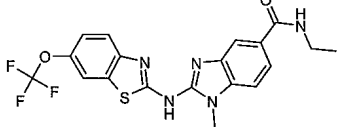
딘-4-일이다.

- [0747] 구체예 234: 구체예 232에 따른 화합물로서, 여기서
- [0748] G는 피페리딘-3-일 또는 1-(디메틸아미노메틸카보닐)-피페리딘-3-일이다.
- [0749] 구체예 235: 구체예 232에 따른 화합물로서, 여기서
- [0750] G는 1,1-디옥소-테트라히드로티오펜-3-일이다.
- [0751] 구체예 236: 구체예 232에 따른 화합물로서, 여기서
- [0752] G는 피롤리딘-3-일, 1-메틸-피롤리딘-3-일, 1-(2-히드록시에틸)-피롤리딘-3-일, 1-(2-히드록시프로필)-피롤리딘-3-일, 1-(2-히드록시-2-메틸프로필)-피롤리딘-3-일, 1-(1-히드록시에틸카보닐)-피롤리딘-3-일, 1-(2-카르복시에틸)-피롤리딘-3-일, 또는 1-(2-메틸술폰닐아미노-에틸)-피롤리딘-3-일이다.
- [0753] 구체예 237: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0754] G는 $-S-R^h$ 에 의해 한번 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0755] 구체예 238: 구체예 237에 따른 화합물로서, 여기서
- [0756] G는 $-(CH_2)_2-S-R^h$ 이다.
- [0757] 구체예 239: 구체예 238에 따른 화합물로서, 여기서
- [0758] R^h 는 메틸 또는 에틸이다.
- [0759] 구체예 240: 구체예 238에 따른 화합물로서, 여기서
- [0760] R^h 는 2-히드록시에틸이다.
- [0761] 구체예 241: 구체예 237에 따른 화합물로서, 여기서
- [0762] G는 $-(CH_2)_3-S-R^h$ 이다.
- [0763] 구체예 242: 구체예 241에 따른 화합물로서, 여기서
- [0764] R^h 는 메틸이다.
- [0765] 구체예 243: 구체예 157에 따른 화합물로서, 여기서
- [0766] G는 $-SO_2-R^h$ 에 의해 한번 치환된 $-C_{1-8}$ 알킬이다.
- [0767] 구체예 244: 구체예 243에 따른 화합물로서, 여기서
- [0768] G는 $-(CH_2)_2-SO_2-R^h$ 이다.
- [0769] 구체예 245: 구체예 244에 따른 화합물로서, 여기서
- [0770] R^h 는 메틸 또는 에틸이다.
- [0771] 구체예 246: 구체예 244에 따른 화합물로서, 여기서
- [0772] R^h 는 2-히드록시에틸이다.
- [0773] 구체예 247: 구체예 243에 따른 화합물로서, 여기서
- [0774] G는 $-(CH_2)_3-SO_2-R^h$ 이다.
- [0775] 구체예 248: 구체예 247에 따른 화합물로서, 여기서

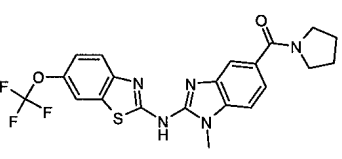
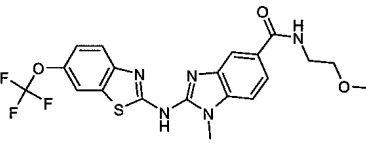
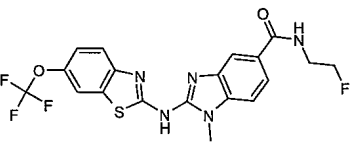
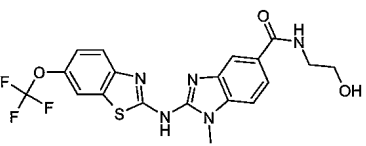
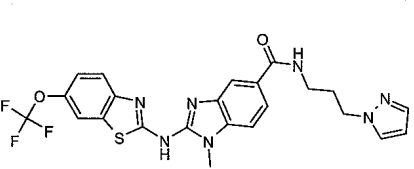
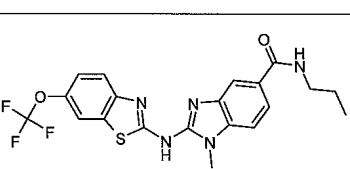
- [0776] R^h 는 메틸이다.
- [0777] 구체예 249: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0778] G는 $-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{NR}^h\text{R}^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 피롤리디노, 피페리디노, 4-메틸-피페라지노, 모르폴리노, 또는 디메틸아미노이다.
- [0779] 구체예 250: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0780] G는 1-(2-히드록시프로필)-피롤리딘-3-일 또는 1-(1-히드록시에틸카보닐)-피롤리딘-3-일이다.
- [0781] 구체예 251: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0782] G는 1-(디메틸아미노메틸카보닐)-피페리딘-4-일이다.
- [0783] 구체예 252: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0784] G는 $-(\text{CH}_2)_{3-5}-\text{OH}$ 이다.
- [0785] 구체예 253: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0786] G는 4-히드록시-시클로헥실메틸이다.
- [0787] 구체예 254: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0788] G는 $-(\text{CH}_2)_2-\text{NHC}(\text{O})-\text{CH}_2-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 이다.
- [0789] 구체예 255: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0790] G는 4-히드록시-시클로헥실메틸이다.
- [0791] 구체예 256: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0792] G는 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^h\text{R}^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 3-히드록시-피롤리디노 또는 3-(디메틸-아미노)-피롤리디노이다.
- [0793] 구체예 257: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0794] G는 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^h\text{R}^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 모르폴리노이다.
- [0795] 구체예 258: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0796] G는 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^h\text{R}^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 4-히드록시-피페리디노, 4-메톡시-피페리디노, 4-(히드록시메틸)-피페리디노, 3-히드록시-피페리디노, 3-메톡시-피페리디노, 3-(히드록시메틸)-피페리디노, 또는 4,4-디플루오로피페리디노이다.
- [0797] 구체예 259: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0798] G는 $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})-\text{NR}^h\text{R}^k$ 이고, 여기서 NR^hR^k 는 디메틸아미노이다.
- [0799] 구체예 260: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0800] G는 $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{OH}$ 이다.
- [0801] 구체예 261: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0802] G는 $-(\text{CH}_2)_2-\text{O}-(\text{CH}_2)_2-\text{OCH}_3$ 이다.
- [0803] 구체예 262: 구체예 156에 따른 화합물로서, 여기서
- [0804] G는 $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{OH}$ 이다.
- [0805] 구체예 263: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서

- [0806] L은 C(O)NH이고, G는 헤테로아릴기에 의해 한번 치환된 C₁₋₈알킬이고, 여기서 헤테로아릴기는 R^x로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0807] 구체예 264: 구체예 263에 따른 화합물로서, 여기서
- [0808] G는 -CH₂-(2-푸릴), -CH₂-(2-티엔일), -CH₂-(2-옥사졸일), 또는 -CH₂-(2-티아졸일)이다.
- [0809] 구체예 265: 구체예 263에 따른 화합물로서, 여기서
- [0810] G는 -(CH₂)₂₋₃-(1-피롤일), -(CH₂)₂₋₃-(1-피라졸일), 또는 -(CH₂)₂₋₃-(1-이미다졸일)이다.
- [0811] 구체예 266: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0812] L은 C(O)NH이고, G는 페닐기에 의해 한번 치환된 C₁₋₈알킬이고, 여기서 페닐기는 R^x로부터 독립적으로 선택된 치환기로 한번 이상 선택적으로 치환된다.
- [0813] 구체예 267: 구체예 266에 따른 화합물로서, 여기서
- [0814] G는 -(CH₂)₁₋₂-(4-히드록시페닐) 또는 -(CH₂)₁₋₂-(4-메톡시-3-히드록시페닐)이다.
- [0815] 구체예 268: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0816] L은 C(O)NH이고, G는 -CH₂-C(O)NH-CH₂-(4-히드록시페닐)이다.
- [0817] 구체예 269: 구체예 79 내지 136의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서
- [0818] L은 C(O)NH이고, G는 -CH₂-C(O)-[4-(피리미딘-2-일옥시)-피페리디노]이다.
- [0819] 구체예 270: 구체예 1 내지 269의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서 화합물은 유리산 또는 유리염기형으로 있다.
- [0820] 구체예 271: 구체예 1 내지 269의 어떤 하나에 따른 화합물로서, 여기서 화합물은 약학적으로 허용가능한 염형으로 있다.
- [0821] 실시예에서의 경로는 식(I)의 화합물, 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염의 합성 방법을 도시한다. 당업자는 본 발명의 화합물이 본원에 구체적으로 기술된 것들과 다른 방법에 의해, 본원에 기술된 방법의 조정에 의해, 및/또는 그것의 조정, 예를 들어 종래 기술의 방법에 의해, 만들어질 수 있다고 평가할 것이다.
- [0822] 유용한 생물학적 활성을 갖는 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염의 예는 실시예 섹션 및 표 1에 언급되었다. HMOX1의 수준 또는 활성을 증가시키는 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염의 활성은 하기 기술된 생물학적 어세이를 사용하여 평가되었다. 하기 나타낸 화학 구조에서, 때때로 Me = 메틸, Et = 에틸, OMe = 메티옥시, OEt = 에티옥시, 등을 포함하는 표준 화학 약어가 사용된다. 일부 경우에서, 이름은 화합물의 염형을 열거할 수 있음을 언급한다. 이들 경우에서, 대응하는 구조가 반대이온의 존재를 나타내지 않을 수 있을지라도, 화합물의 염형을 만들었다. 염산염형에서 만들어진 화합물의 경우, 이름 또는 구조가 반대이온들 사이의 어떤 특정 화학량론 관계를 열거한다고 나타내진 않는다.

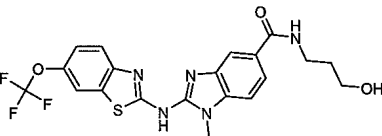
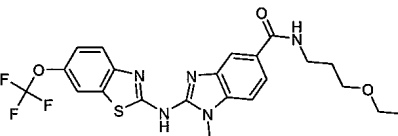
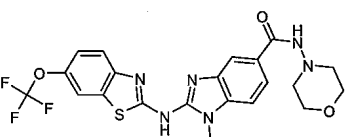
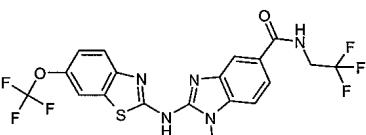
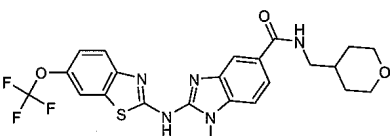
표 1

번호	구조	이름
1		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸아미드
2		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸 에스테르
3		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산
4		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-에톡시-에틸)-아미드
5		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 시클로프로필메틸-아미드
6		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 에틸아미드

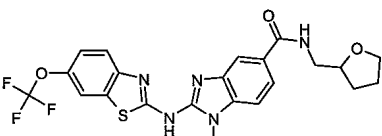
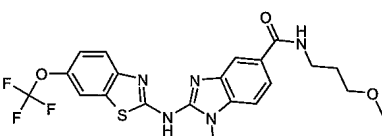
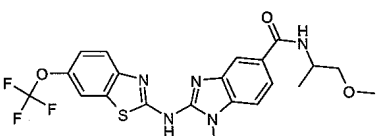
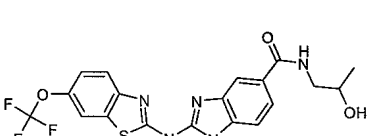
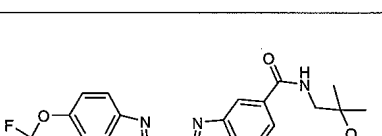
[0823]

번호	구조	이름
7		[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-피롤리딘-1-일-메탄온
8		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
9		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드
10		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드
11		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-피라졸-1-일-프로필)-아미드
12		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 프로필아미드

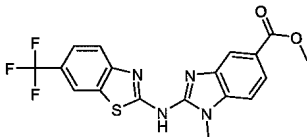
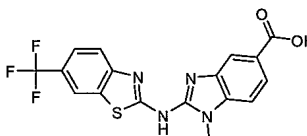
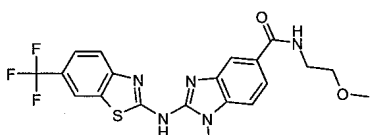
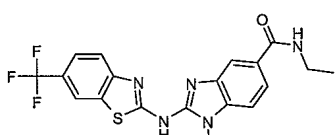
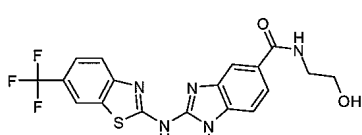
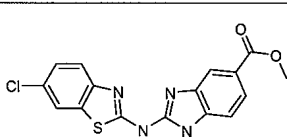
[0824]

번호	구조	이름
13		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (3-히드록시-프로필)-아미 드
14		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (3-에톡시-프로필)-아미드
15		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 모르폴린-4-일아미드
16		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2,2,2-트리플루오로-에틸)- 아미드
17		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (테트라히드로-피란-4-일메 틸)-아미드

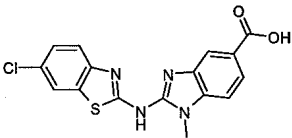
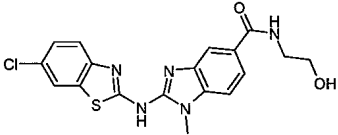
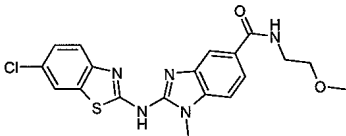
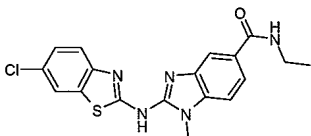
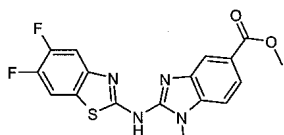
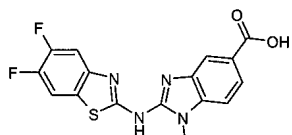
[0825]

번호	구조	이름
18		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (테트라히드로-푸란-2-일메틸)-아미드
19		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메톡시-프로필)-아미드
20		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-1-메틸-에틸)-아미드
21		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-1-메틸-에틸)-아미드
22		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드

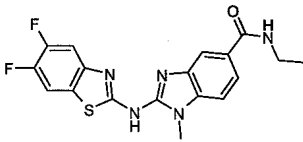
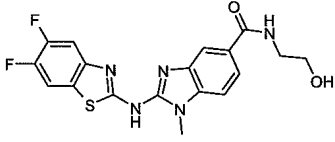
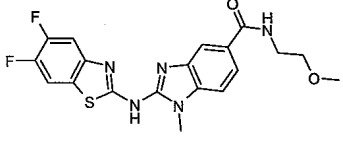
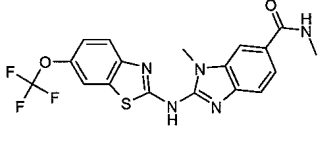
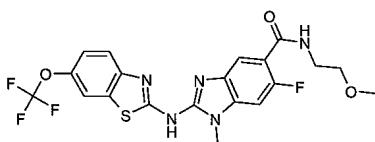
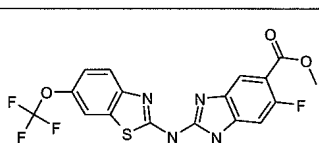
[0826]

번호	구조	이름
23		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
24		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
25		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
26		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
27		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드
28		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

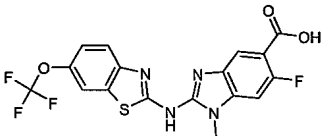
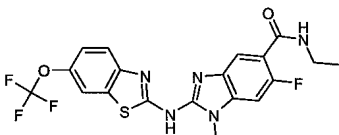
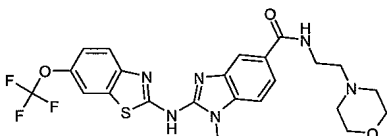
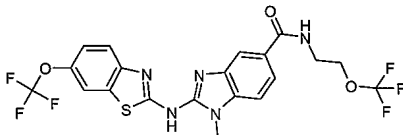
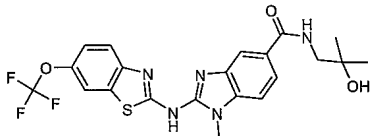
[0827]

번호	구조	이름
29		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
30		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드
31		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
32		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
33		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸에스테르
34		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

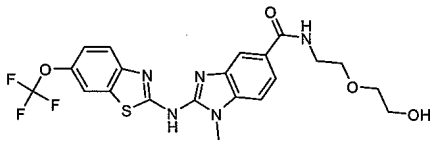
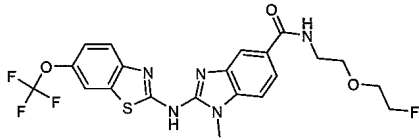
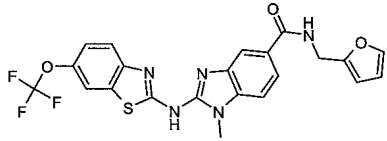
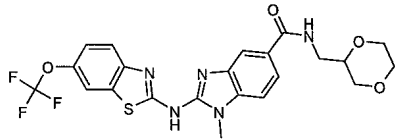
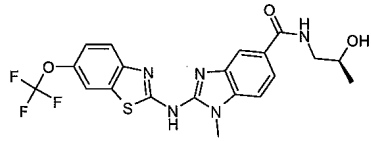
[0828]

번호	구조	이름
35		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
36		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드
37		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
38		3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
39		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
40		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[0829]

번호	구조	이름
41		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
42		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
43		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
44		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-트리플루오로메톡시-에틸)-아미드
45		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-2-메틸-프로필)-아미드

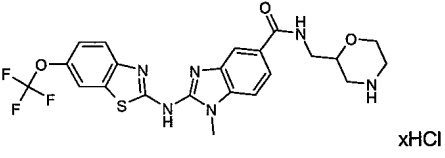
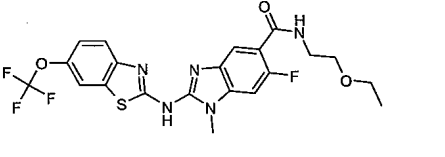
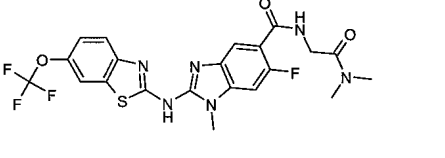
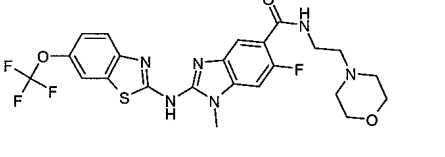
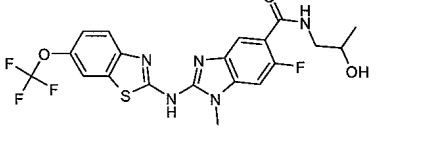
[0830]

번호	구조	이름
46		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에 틸]-아미드
47		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에 틸]-아미드
48		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (푸란-2-일메틸)-아미드
49		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ([1,4]디옥산-2-일메틸)-아 미드
50		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아 미드

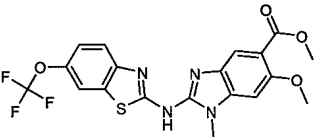
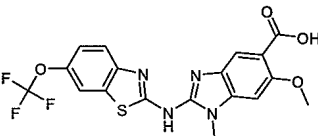
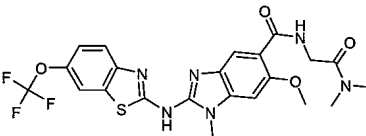
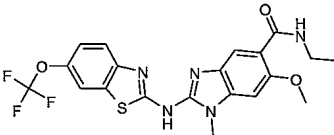
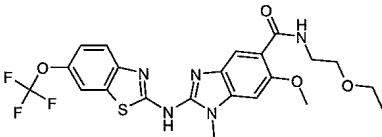
[0831]

번호	구조	이름
51		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드
52		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실)-아미드
53		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(테트라하드로-푸란-2-일메톡시)-에틸]-아미드
54		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-프로필)-아미드
55		2-(((1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐)-아미노)-메틸)-모르폴린-4-카르복시산 tert-부틸 에스테르

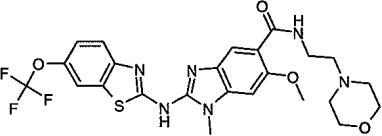
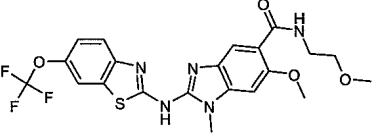
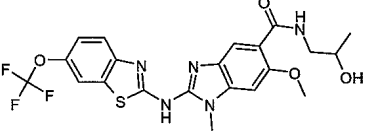
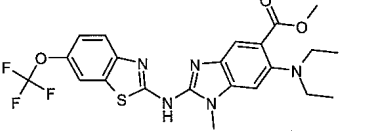
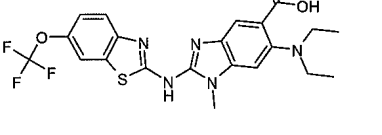
[0832]

번호	구조	이름
56		1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (모르폴린-2-일메틸)-아미드 염산염
57		6-플루오로-1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
58		6-플루오로-1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
59		6-플루오로-1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
60		6-플루오로-1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드

[0833]

번호	구조	이름
61		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
62		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
63		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일-메틸-아미드
64		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
65		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

[0834]

번호	구조	이름
66		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
67		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
68		6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드
69		6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
70		6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

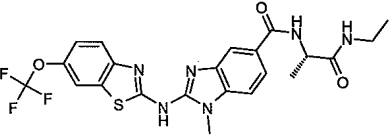
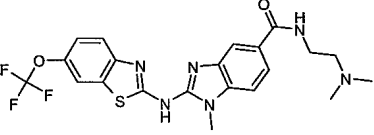
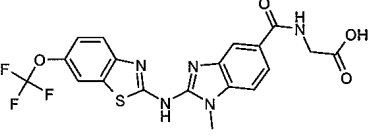
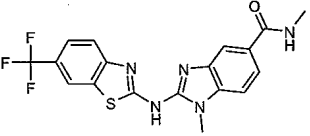
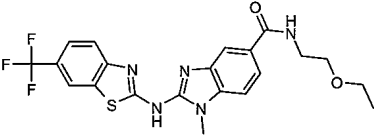
[0835]

번호	구조	이름
71		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 에틸 에스테르
72		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산
73		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 (2-메톡시-에틸)- 아미드
74		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 디메틸카바모일메 틸-아미드
75		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 (2-에톡시-에틸)- 아미드

[0836]

번호	구조	이름
76		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 에틸아미드
77		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 (2-모르폴린-4-일- 에틸)-아미드
78		3-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6- 카르복시산 (2-히드록시-프로 필)-아미드
79		{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카보닐]- 아미노}-아세트산 메틸 에스 테르
80		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 디메틸카바모일메틸-아미 드

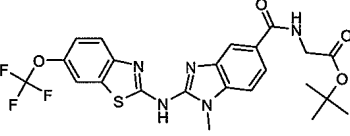
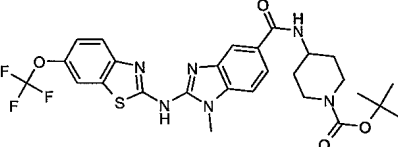
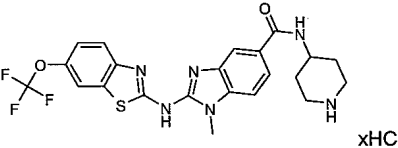
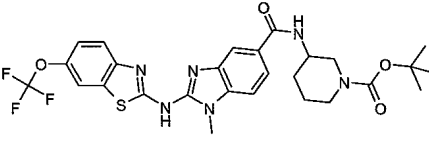
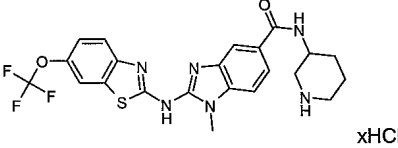
[0837]

번호	구조	이름
81		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1 <i>H</i> -벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((S)-1-에틸카바모일-에틸)- 아미드
82		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1 <i>H</i> -벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-디메틸아미노-에틸)-아 미드
83		[[1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1 <i>H</i> -벤조이미다졸-5-카보닐]- 아미노]-아세트산
84		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 틸-벤조티아졸-2-일아미노)- 1 <i>H</i> -벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸아미드
85		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 틸-벤조티아졸-2-일아미노)- 1 <i>H</i> -벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-에톡시-에틸)-아미드

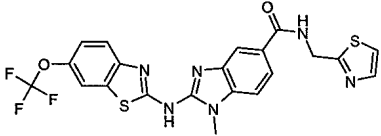
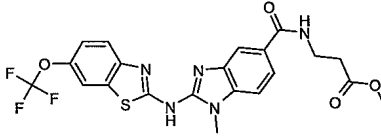
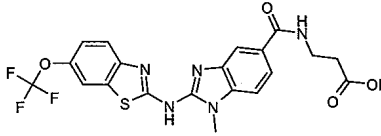
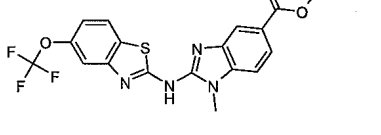
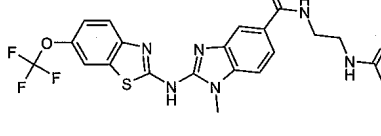
[0838]

번호	구조	이름
86		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
87		2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
88		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
89		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
90		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아미드

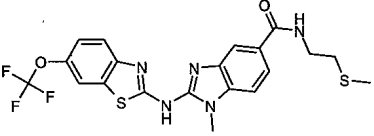
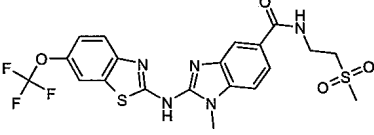
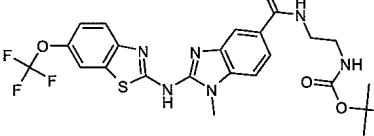
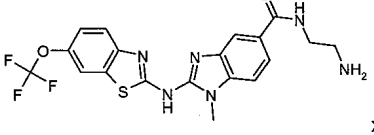
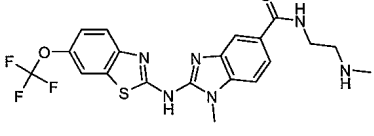
[0839]

번호	구조	이름
91		[[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노]-아세트산 <i>tert</i> -부틸 에스테르
92		4-[[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노]-피페리딘-1-카르복시산 <i>tert</i> -부틸 에스테르
93		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 염산 염
94		3-[[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노]-피페리딘-1-카르복시산 <i>tert</i> -부틸 에스테르
95		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-3-일아미드 염산 염

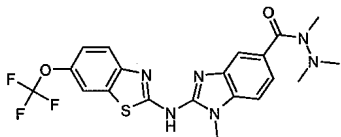
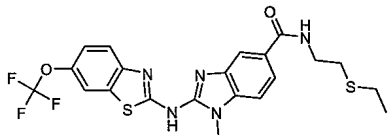
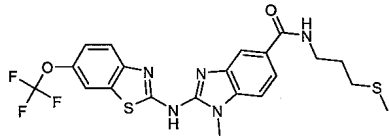
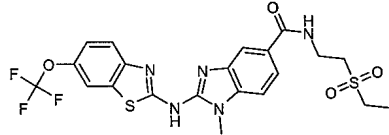
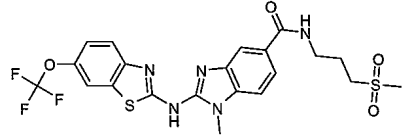
[0840]

번호	구조	이름
96		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (티아졸-2-일메틸)-아미드
97		3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르
98		3-([2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산
99		1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
100		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아세틸아미노-에틸)-아미드

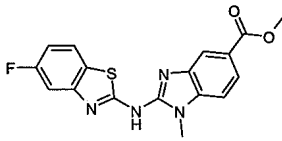
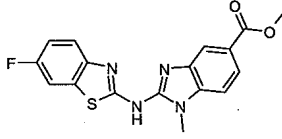
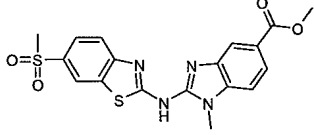
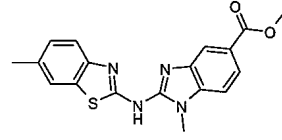
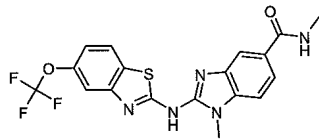
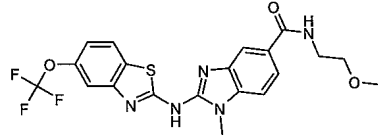
[0841]

번호	구조	이름
101		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-메틸술파닐-에틸)-아미 드
102		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-메탄술폰닐-에틸)-아미 드
103		(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로 메톡시-벤조티아졸-2-일아미 노)-1H-벤조이미다졸-5-카보 닐]-아미노)-에틸)-카르바산 <i>tert</i> -부틸 에스테르
104		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-아미노-에틸)-아미드 염 산염
105		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-메틸아미노-에틸)-아미 드

[0842]

번호	구조	이름
106		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 트리메틸히드라지드
107		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-에틸술파닐-에틸)-아미 드
108		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (3-메틸술파닐-프로필)-아 미드
109		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-에탄술포닐-에틸)-아미 드
110		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (3-메탄술포닐-프로필)-아 미드

[0843]

번호	구조	이름
111		2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
112		2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
113		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
114		1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
115		1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
116		1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

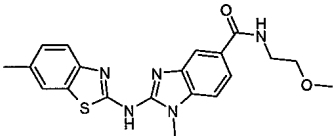
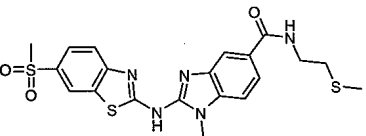
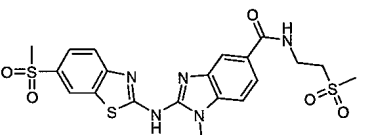
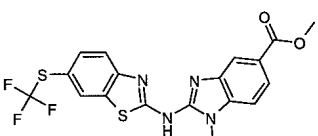
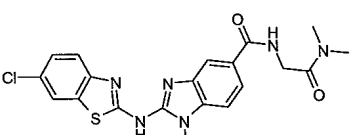
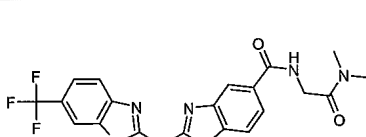
[0844]

번호	구조	이름
117		2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
118		2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
119		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
120		1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
121		1-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (1,1-디옥소-테트라히드로-1λ ⁶ -티오피엔-3-일)-아미드
122		2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

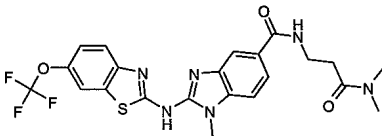
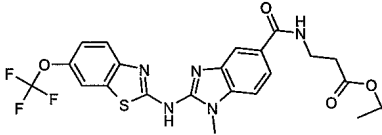
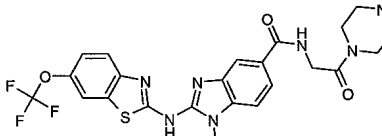
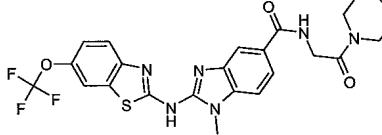
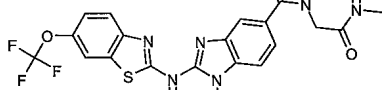
[0845]

번호	구조	이름
123		2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
124		2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
125		2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
126		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
127		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
128		2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1 <i>H</i> -벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

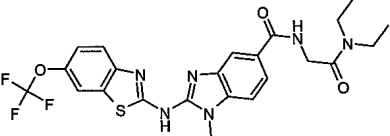
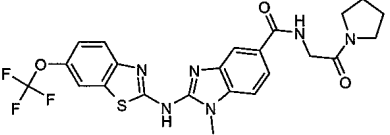
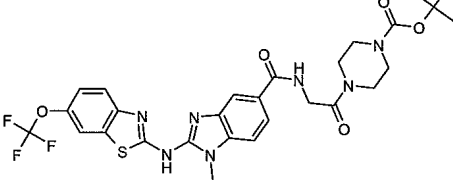
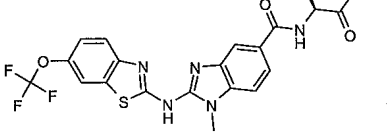
[0846]

번호	구조	이름
129		2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
130		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰파닐-에틸)-아미드
131		2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰파닐-에틸)-아미드
132		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸술폰파닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
133		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
134		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

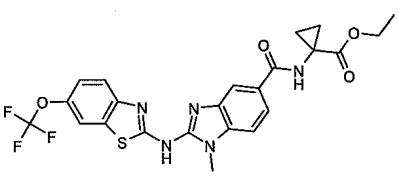
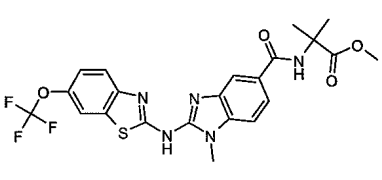
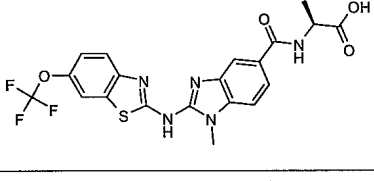
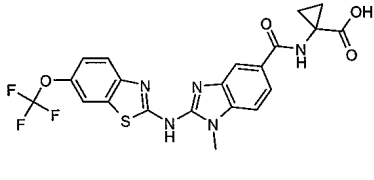
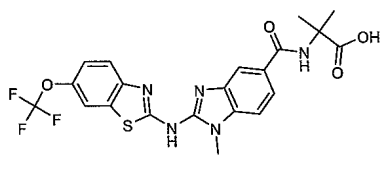
[0847]

번호	구조	이름
135		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤즈이미다졸-5-카르복시 산 (2-디메틸카바모일-에틸)- 아미드
136		3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로 메톡시-벤조티아졸-2-일아미 노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보 닐]-아미노)-프로피온산 <i>tert</i> - 부틸 에스테르
137		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤즈이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)- 2-옥소-에틸]-아미드
138		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤즈이미다졸-5-카르복시 산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소- 에틸)-아미드
139		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤즈이미다졸-5-카르복시 산 메틸카바모일메틸-아미드

[0848]

번호	구조	이름
140		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 디에틸카바모일메틸-아미 드
141		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-옥소-2-피롤리딘-1-일- 에틸)-아미드
142		4-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오 로메톡시-벤조티아졸-2-일아 미노)-1H-벤조이미다졸-5-카 보닐]-아미노)-아세틸)-피페라 진-1-카르복시산 tert-부틸 에 스테르
143		(S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루 오로메톡시-벤조티아졸-2-일 아미노)-1H-벤조이미다졸-5- 카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르

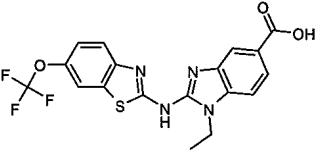
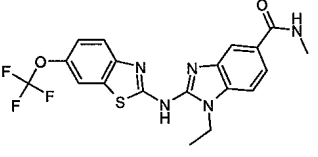
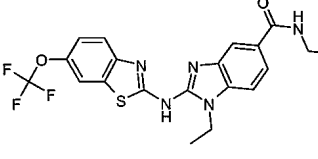
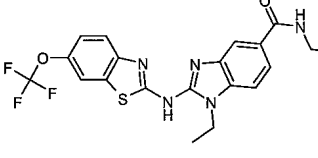
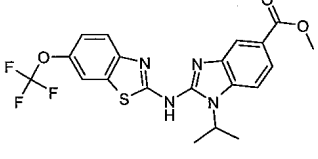
[0849]

번호	구조	이름
144		1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산 에틸 에스테르
145		2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르
146		(S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산
147		1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산
148		2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산

[0850]

번호	구조	이름
149		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((S)-1-디메틸카바모일-에 틸)-아미드
150		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (1-디메틸카바모일-시클로 프로필)-아미드
151		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (1-디메틸카바모일-1-메틸- 에틸)-아미드
152		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-옥소-2-피페라진-1-일- 에틸)-아미드 염산염
153		1-에틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸 에스테르

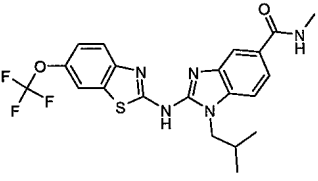
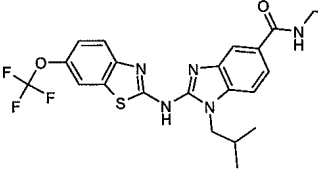
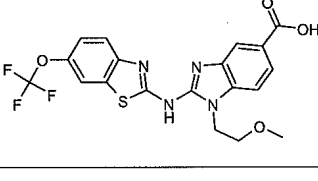
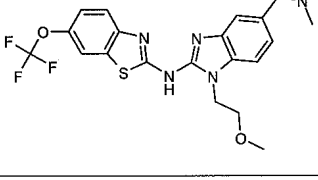
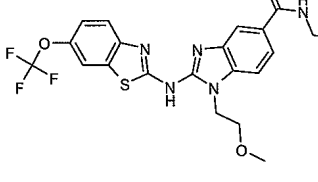
[0851]

번호	구조	이름
154		1-에틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산
155		1-에틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸아미드
156		1-에틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 에틸아미드
157		1-에틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-에톡시-에틸)-아미드
158		1-이소프로필-2-(6-트리플루 오로메톡시-벤조티아졸-2-일 아미노)-1H 벤조이미다졸-5- 카르복시산 메틸 에스테르

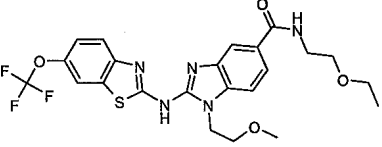
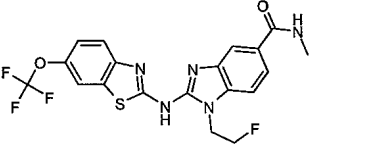
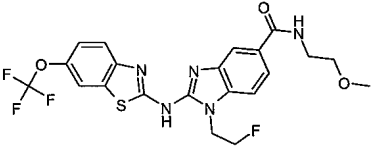
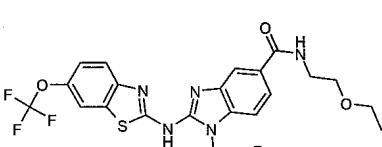
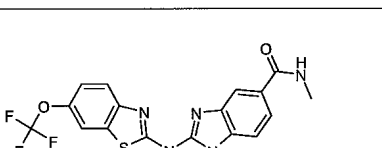
[0852]

번호	구조	이름
159		1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
160		1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
161		1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
162		1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
163		1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

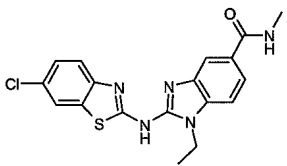
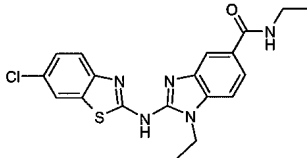
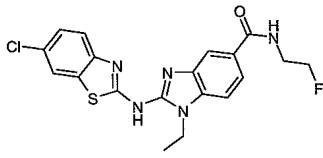
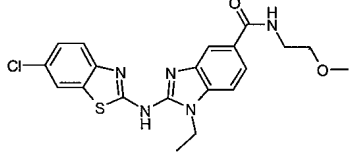
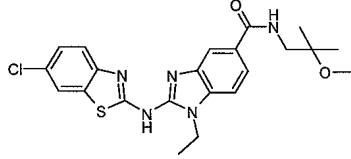
[0853]

번호	구조	이름
164		1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
165		1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
166		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
167		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
168		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

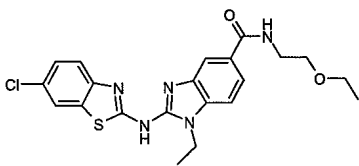
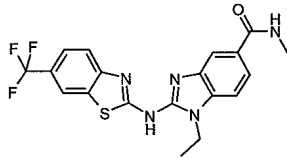
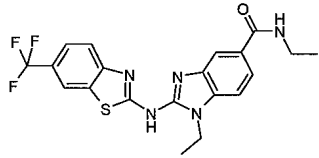
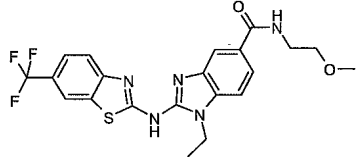
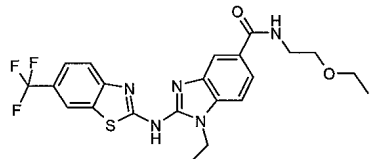
[0854]

번호	구조	이름
169		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
170		1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
171		1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
172		1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
173		1-(2-아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드 염산염

[0855]

번호	구조	이름
174		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-에틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 메틸아미 드
175		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-에틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 에틸아미 드
176		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-에틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-플루오 로-에틸)-아미드
177		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-에틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-메톡시- 에틸)-아미드
178		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-에틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-메톡시- 2-메틸-프로필)-아미드

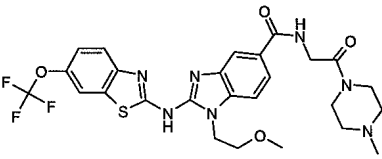
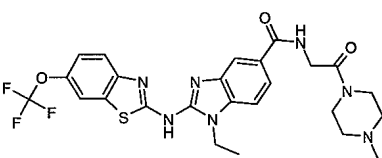
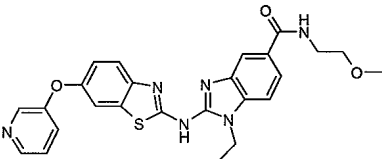
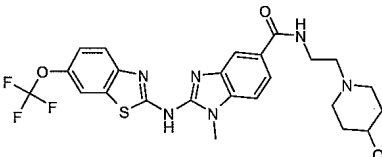
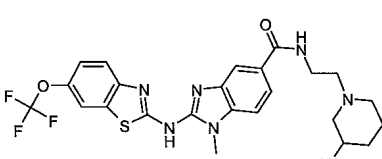
[0856]

번호	구조	이름
179		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
180		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
181		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
182		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
183		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

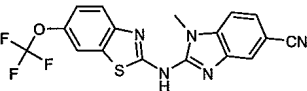
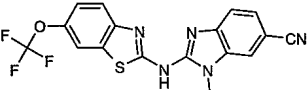
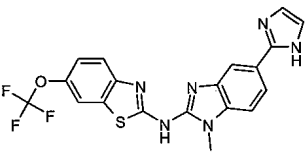
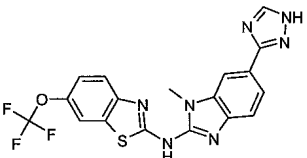
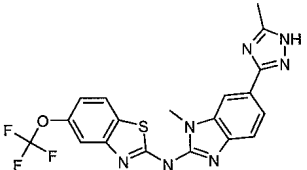
[0857]

번호	구조	이름
184		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-에틸-프로필)-아미드
185		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술파닐-에틸)-아미드
186		1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
187		1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
188		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

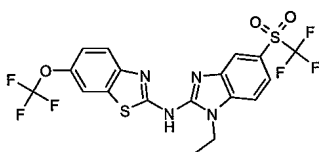
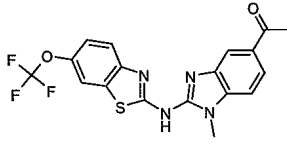
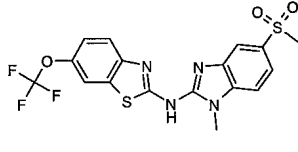
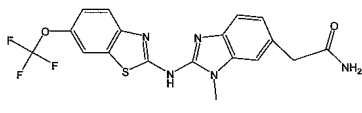
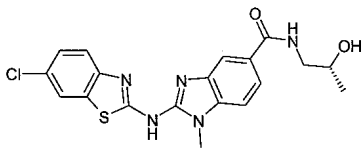
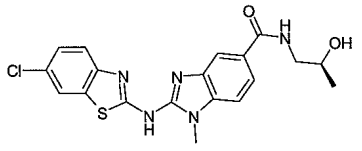
[0858]

번호	구조	이름
189		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
190		1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
191		1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
192		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드
193		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드

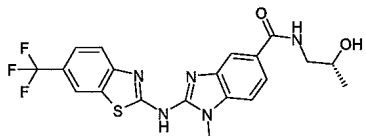
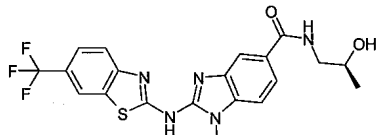
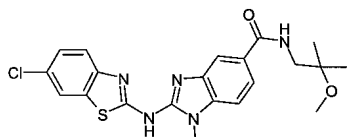
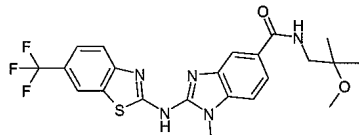
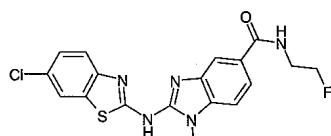
[0859]

번호	구조	이름
194		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르보니 트릴
195		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-6-카르보니 트릴
196		[5-(1H-이미다졸-2-일)-1-메틸 -1H-벤조이미다졸-2-일]-(6-트 리플루오로메톡시-벤조티아졸 -2-일)-아민
197		[1-메틸-6-(1H-1,2,4-트리아졸- 3-일)-1H-벤조이미다졸-2-일]- (6-트리플루오로메톡시-벤조 티아졸-2-일)-아민
198		[1-메틸-6-(5-메틸-1H-1,2,4-트 리아졸-3-일)-1H-벤조이미다 졸-2-일]-(5-트리플루오로메톡 시-벤조티아졸-2-일)-아민

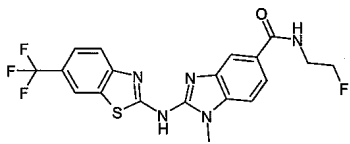
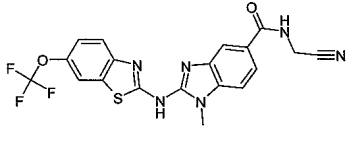
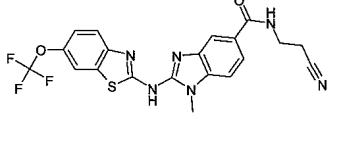
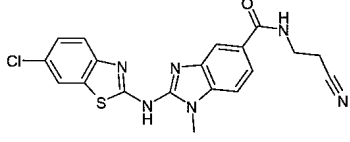
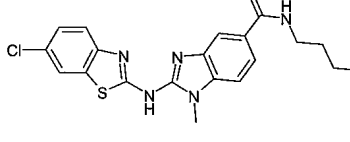
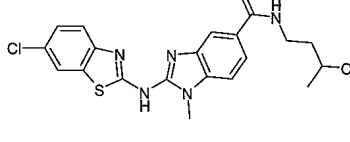
[0860]

번호	구조	이름
199		(1-에틸-5-트리플루오로메탄 술포닐-1H-벤조이미다졸-2- 일)-(6-트리플루오로메톡시-벤 조티아졸-2-일)-아민
200		1-[1-메틸-2-(6-트리플루오로 메톡시-벤조티아졸-2-일아미 노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-에 탄온
201		(5-메탄술포닐-1-메틸-1H-벤 조이미다졸-2-일)-(6-트리플루 오로메톡시-벤조티아졸-2-일)- 아민
202		2-[1-메틸-2-(6-트리플루오로 메톡시-벤조티아졸-2-일아미 노)-1H-벤조이미다졸-6-일]-아 세트아미드
203		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히 드록시-프로필)-아미드
204		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히 드록시-프로필)-아미드

[0861]

번호	구조	이름
205		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드
206		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드
207		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드
208		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드
209		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드

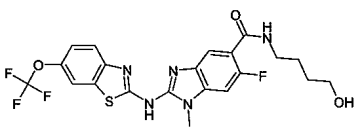
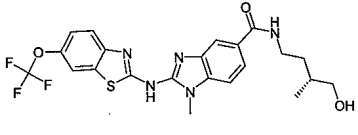
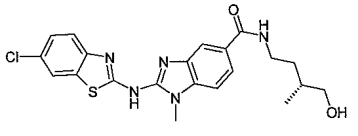
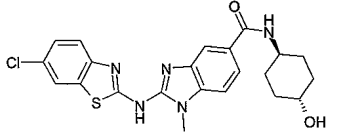
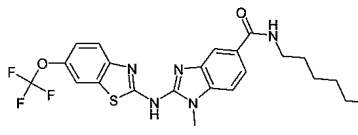
[0862]

번호	구조	이름
210		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드
211		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 시아노메틸-아미드
212		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-시아노-에틸)-아미드
213		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-시아노-에틸)-아미드
214		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-프로필)-아미드
215		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-부틸)-아미드

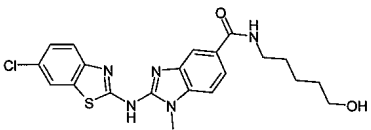
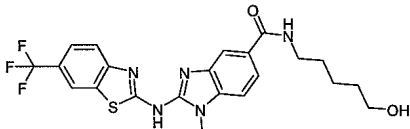
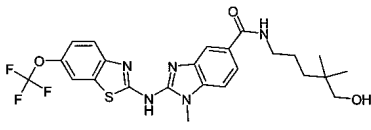
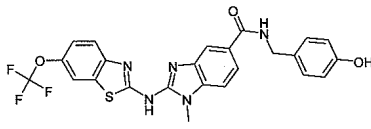
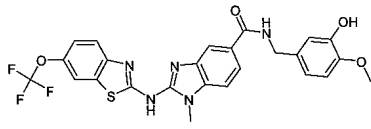
[0863]

번호	구조	이름
216		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-부틸)-아미드
217		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-2,2-디메틸-프로필)-아미드
218		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-2,2-디메틸-프로필)-아미드
219		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
220		2-(6-클로로-1H-벤조이미다졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
221		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드

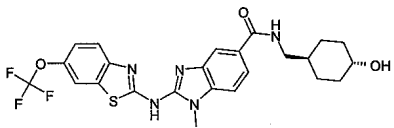
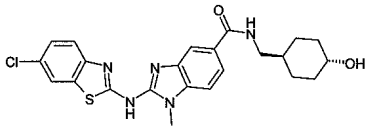
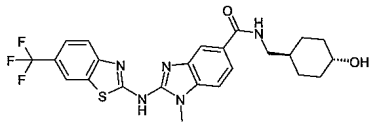
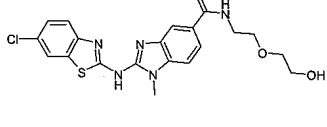
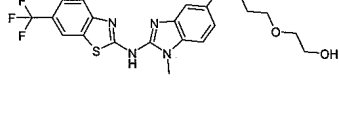
[0864]

번호	구조	이름
222		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
223		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-4-히드록시-3-메틸-부틸)-아미드
224		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-4-히드록시-3-메틸-부틸)-아미드
225		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실)-아미드
226		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-펜틸)-아미드

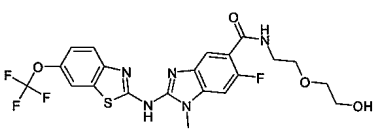
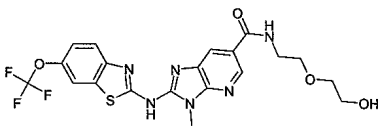
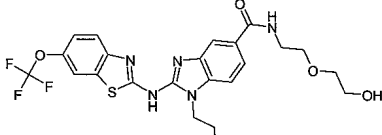
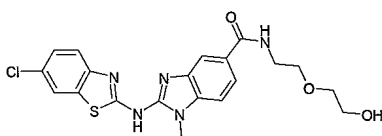
[0865]

번호	구조	이름
227		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-펜틸)-아미드
228		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-펜틸)-아미드
229		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-4,4-디메틸-펜틸)-아미드
230		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 4-히드록시-벤질아미드
231		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 3-히드록시-4-메톡시-벤질아미드

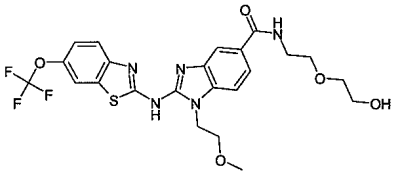
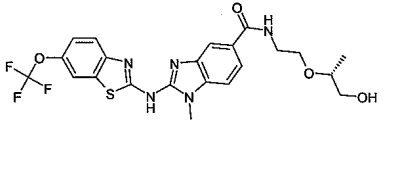
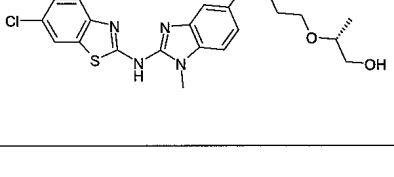
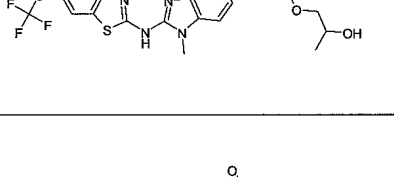
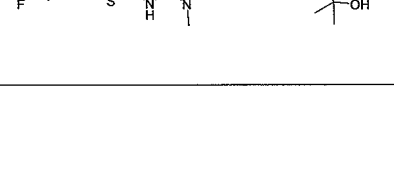
[0866]

번호	구조	이름
232		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (<i>트랜스</i> -4-히드록시-시클로헥실메틸)-아미드
233		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (<i>트랜스</i> -4-히드록시-시클로헥실메틸)-아미드
234		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (<i>트랜스</i> -4-히드록시-시클로헥실메틸)-아미드
235		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
236		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

[0867]

번호	구조	이름
237		6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
238		3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
239		1-(2-메틸아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드 염산염
240		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드 염산염

[0868]

번호	구조	이름
241		1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
242		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-2-히드록시-1-메틸-에톡시)-에틸]-아미드
243		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-2-히드록시-1-메틸-에톡시)-에틸]-아미드
244		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-프로폭시)-에틸]-아미드
245		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-2-메틸-프로폭시)-에틸]-아미드

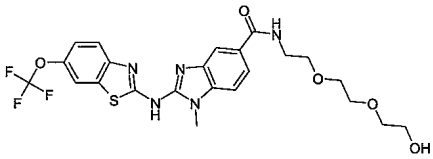
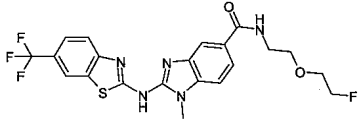
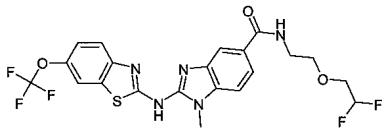
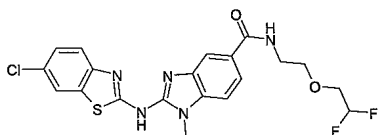
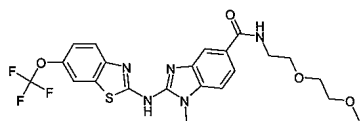
[0869]

번호	구조	이름
246		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(3-히드록시-프로폭시)- 에틸]-아미드
247		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(3-플루오로-프로폭시)- 에틸]-아미드
248		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드 록시-프로폭시)-에틸]-아미드
249		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(3-플루 오로-프로폭시)-에틸]-아미드
250		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [3-(2-히드록시-에톡시)-프 로필]-아미드

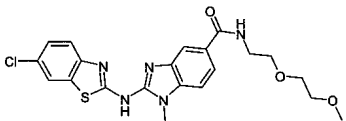
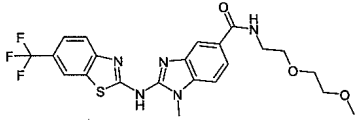
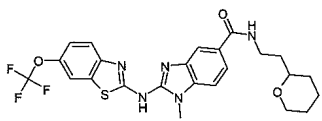
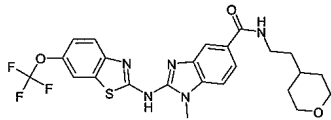
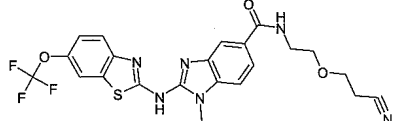
[0870]

번호	구조	이름
251		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-히드록시-페닐)-에 틸]-아미드
252		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(3-히드록시-페닐)-에 틸]-아미드
253		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-히드록시-시클로헥 실)-에틸]-아미드
254		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (트랜스-4-히드록시메틸-시 클로헥실메틸)-아미드
255		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (트랜스-4- 히드록시메틸-시클로헥실메 틸)-아미드

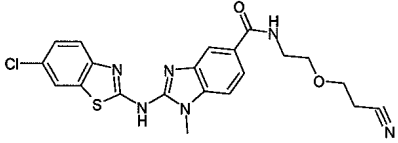
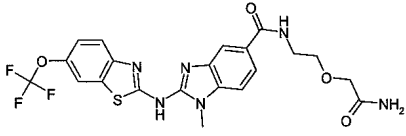
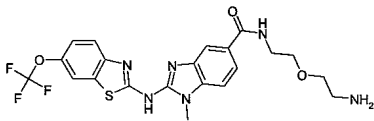
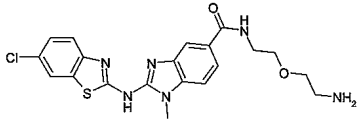
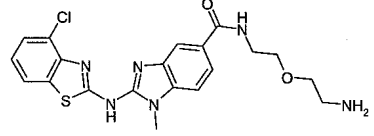
[0871]

번호	구조	이름
256		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-[2-(2-히드록시-에톡시)- 에톡시]-에틸]-아미드
257		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 틸-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에 틸]-아미드
258		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2,2-디플루오로-에톡 시)-에틸]-아미드
259		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2,2-디 플루오로-에톡시)-에틸]-아미 드
260		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에 틸]-아미드

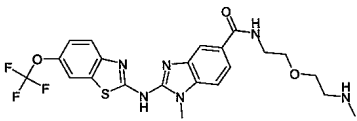
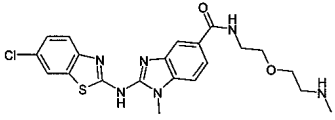
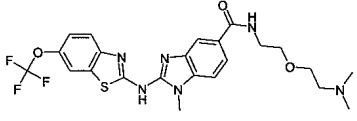
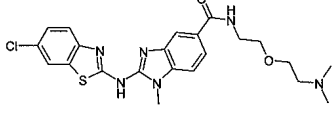
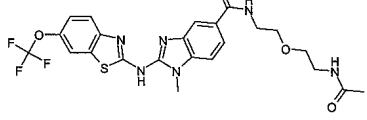
[0872]

번호	구조	이름
261		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드
262		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드
263		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(테트라히드로-피란-2-일)-에틸]-아미드
264		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(테트라히드로-피란-4-일)-에틸]-아미드
265		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-아미드

[0873]

번호	구조	이름
266		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아 노-에톡시)-에틸]-아미드
267		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-카바모일메톡시-에틸)- 아미드
268		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H 벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-아미노-에톡시)-에 틸]-아미드
269		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미 노-에톡시)-에틸]-아미드
270		2-(4-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H 벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미 노-에톡시)-에틸]-아미드

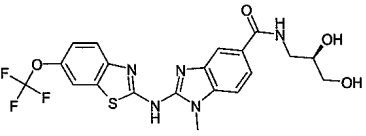
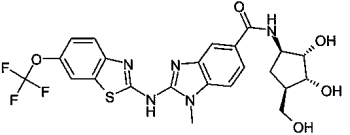
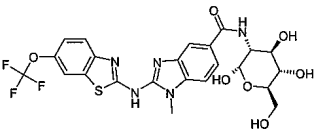
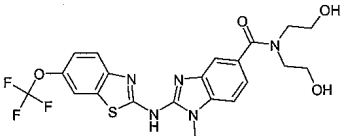
[0874]

번호	구조	이름
271		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-메틸아미노-에톡시)- 에틸]-아미드 염산염
272		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-메틸 아미노-에톡시)-에틸]-아미드 염산염
273		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-디메틸아미노-에톡 시)-에틸]-아미드
274		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메 틸아미노-에톡시)-에틸]-아미 드
275		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-아세틸아미노-에톡 시)-에틸]-아미드

[0875]

번호	구조	이름
276		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-메탄술포닐아미노-에 톡시)-에틸]-아미드
277		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-에탄술포 닐-에틸)-아미드
278		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드 록시-에탄술포닐)-에틸]-아미 드
279		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루 오로-에틸아미노)-에틸]-아미 드 염산염
280		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((S)-2,3-디히드록시-프로 필)-아미드

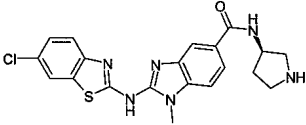
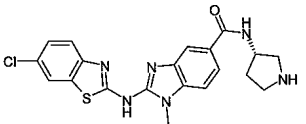
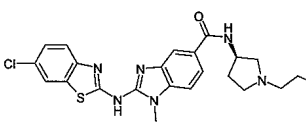
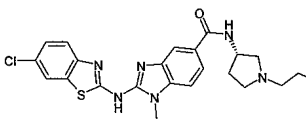
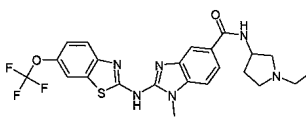
[0876]

번호	구조	이름
281		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((R)-2,3-디히드록시-프로 필)-아미드
282		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((1R,2S,3R,4R)-2,3-디히드 록시-4-히드록시메틸-시클로 펜틸)-아미드
283		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 ((2S,3R,4R,5S,6R)-2,4,5-트 리히드록시-6-히드록시메틸- 테트라히드로-피란-3-일)-아미 드
284		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 비스-(2-히드록시-에틸)-아 미드

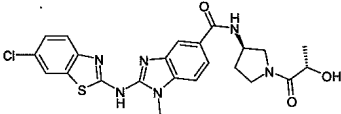
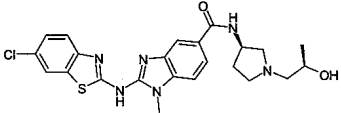
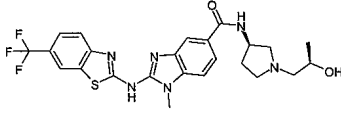
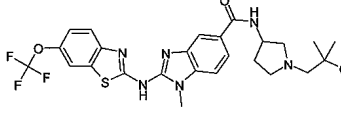
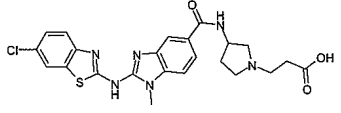
[0877]

번호	구조	이름
285		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
286		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
287		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
288		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
289		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피롤리딘-3-일아미드 염산염

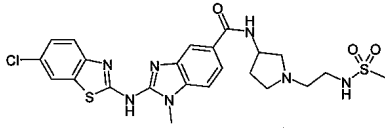
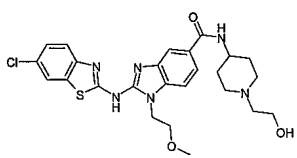
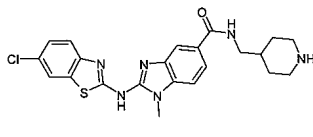
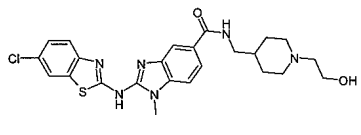
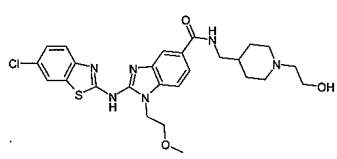
[0878]

번호	구조	이름
290		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (R)-피롤리 딘-3-일아미드 염산염
291		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (S)-피롤리 딘-3-일아미드 염산염
292		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(R)-1-(2- 히드록시-에틸)-피롤리딘-3- 일]-아미드
293		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(S)-1-(2- 히드록시-에틸)-피롤리딘-3- 일]-아미드
294		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [1-((R)-2-히드록시-프로 필)-피롤리딘-3-일]-아미드

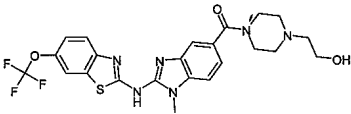
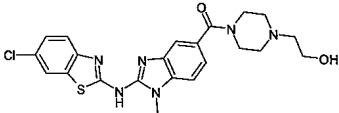
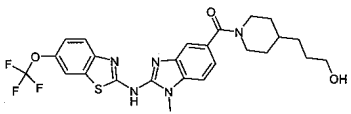
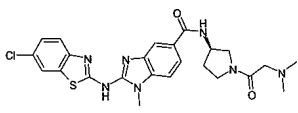
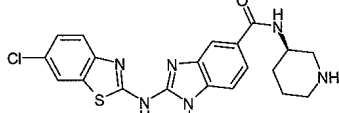
[0879]

번호	구조	이름
295		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-((S)-2-히드록시-프로피오닐)-피롤리딘-3-일)-아미드
296		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일)-아미드
297		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일)-아미드
298		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-2-메틸-프로필)-피롤리딘-3-일)-아미드
299		3-(3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-일)-프로피온산

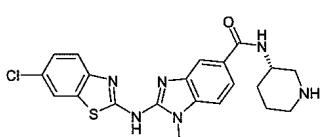
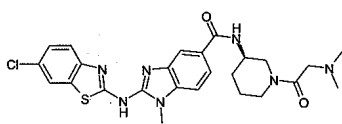
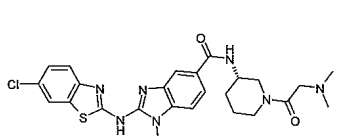
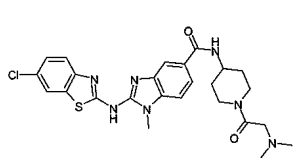
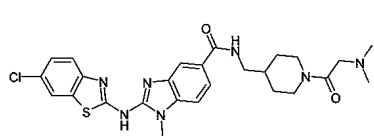
[0880]

번호	구조	이름
300		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [1-(2-메탄 술포닐아미노-에틸)-피롤리딘- 3-일]-아미드
301		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-(2-메톡시-에틸)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페 리딘-4-일]-아미드
302		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (피페리딘- 4-일메틸)-아미드 염산염
303		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드 록시-에틸)-피페리딘-4-일메 틸]-아미드
304		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-(2-메톡시-에틸)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페 리딘-4-일메틸]-아미드

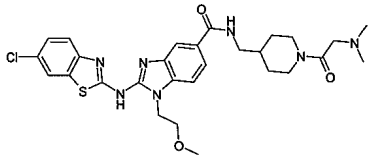
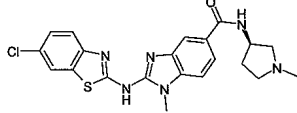
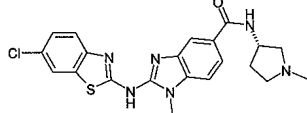
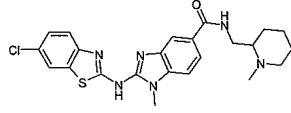
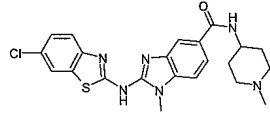
[0881]

번호	구조	이름
305		[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-메탄온
306		[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-일]-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-메탄온
307		[4-(3-히드록시-프로필)-피페리딘-1-일]-[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-메탄온
308		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-(2-디메틸아미노-아세틸)-피롤리딘-3-일]-아미드
309		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (R)-피페리딘-3-일아미드 염산염

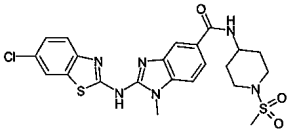
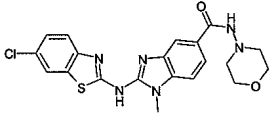
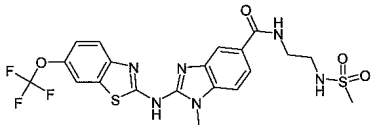
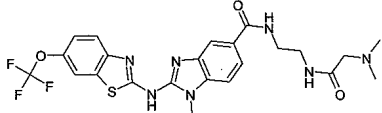
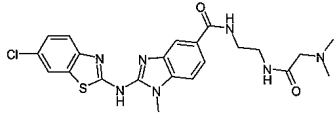
[0882]

번호	구조	이름
310		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (S)-피페리 딘-3-일아미드 염산염
311		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(R)-1-(2- 디메틸아미노-아세틸)-피페리 딘-3-일]-아미드
312		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(S)-1-(2- 디메틸아미노-아세틸)-피페리 딘-3-일]-아미드
313		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [1-(2-디메 틸아미노-아세틸)-피페리딘-4- 일]-아미드
314		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [1-(2-디메 틸아미노-아세틸)-피페리딘-4- 일메틸]-아미드

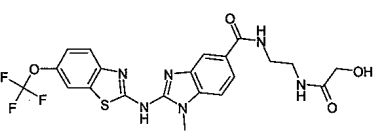
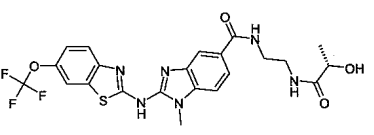
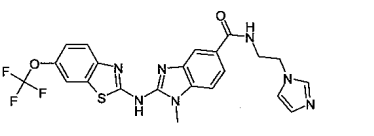
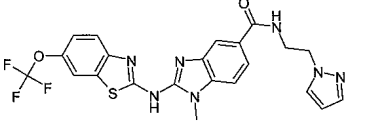
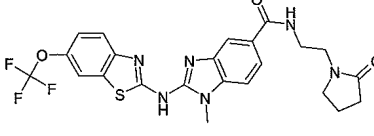
[0883]

번호	구조	이름
315		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-(2-메톡시-에틸)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [1-(2-디메틸아미노-아세 틸)-피페리딘-4-일메틸]-아미 드
316		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H 벤조이미 다졸-5-카르복시산 ((R)-1-메 틸-피롤리딘-3-일)-아미드
317		2-(6-클로로-벤조티아졸-2 일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메 틸-피롤리딘-3-일)-아미드
318		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (1-메틸-피 페리딘-2-일메틸)-아미드
319		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (1-메틸-피 페리딘-4-일)-아미드

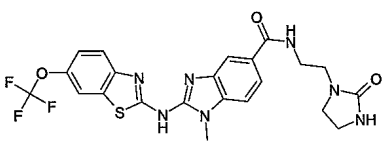
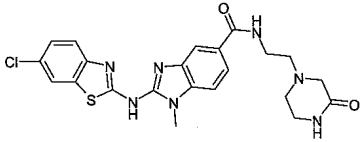
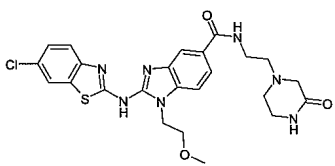
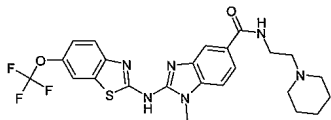
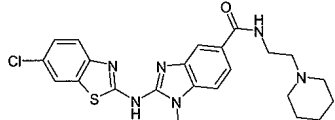
[0884]

번호	구조	이름
320		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-메탄술폰닐-피페리딘-4-일)-아미드
321		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 모르폴린-4-일아미드
322		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메탄술폰닐아미노-에틸)-아미드
323		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드
324		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드

[0885]

번호	구조	이름
325		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-히드록시-아세틸아미 노)-에틸]-아미드
326		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-((S)-2-히드록시-프로피 오닐아미노)-에틸]-아미드
327		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-이미다졸-1-일-에틸)-아 미드
328		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-피라졸-1-일-에틸)-아미 드
329		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-옥소-피롤리딘-1-일)- 에틸]-아미드

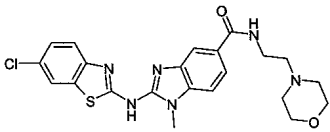
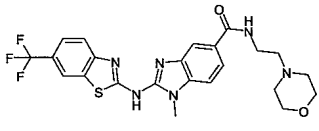
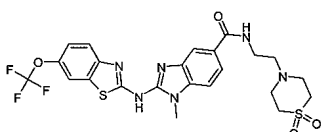
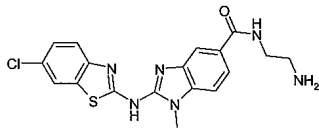
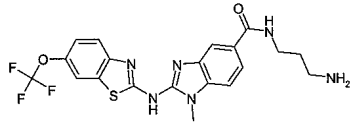
[0886]

번호	구조	이름
330		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(2-옥소-이마다졸리딘- 1-일)-에틸]-아미드
331		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(3-옥소 -피페라진-1-일)-에틸]-아미드
332		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-(2-메톡시-에틸)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(3-옥소-피페라진-1-일)- 에틸]-아미드
333		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (2-피페리딘-1-일-에틸)-아 미드
334		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-피페리 딘-1-일-에틸)-아미드

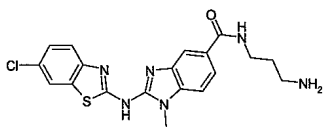
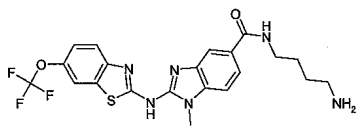
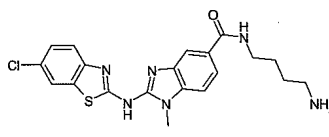
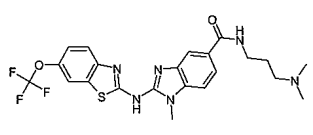
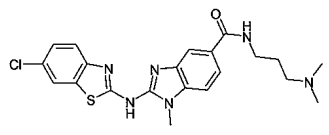
[0887]

번호	구조	이름
335		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(4,4-디 플루오로-피페리딘-1-일)-에 틸]-아미드
336		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(3,3-디 플루오로-피페리딘-1-일)-에 틸]-아미드
337		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)- 에틸]-아미드
338		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸 -피페라진-1-일)-에틸]-아미드
339		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-피페라 진-1-일-에틸)-아미드 염산염

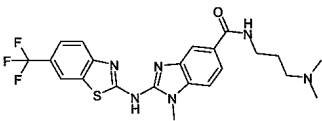
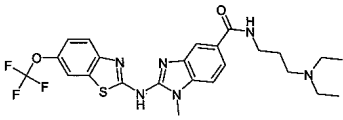
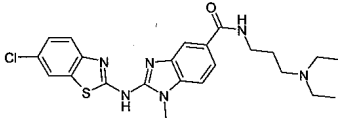
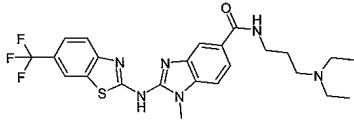
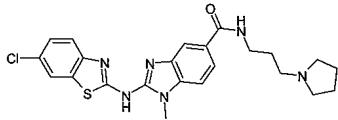
[0888]

번호	구조	이름
340		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
341		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
342		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(1,1-디옥소-티오모르폴린-4-일)-에틸]-아미드
343		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 염산염
344		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-아미노-프로필)-아미드 염산염

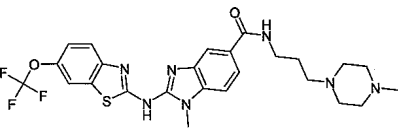
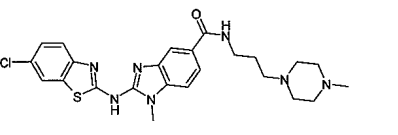
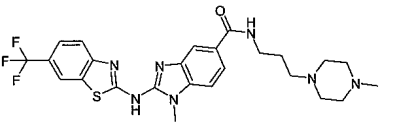
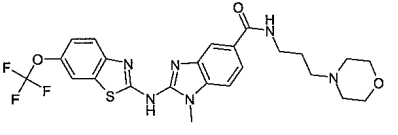
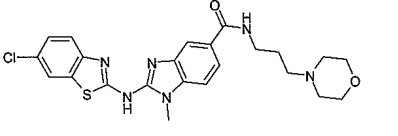
[0889]

번호	구조	이름
345		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-아미노-프로필)-아미드 염산염
346		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-아미노-부틸)-아미드 염산염
347		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-아미노-부틸)-아미드 염산염
348		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디메틸아미노-프로필)-아미드
349		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디메틸아미노-프로필)-아미드

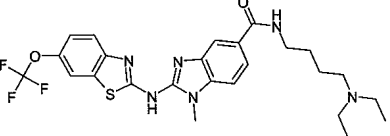
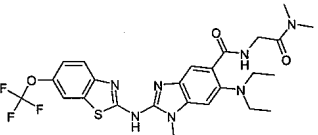
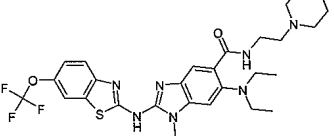
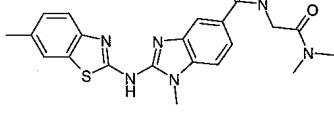
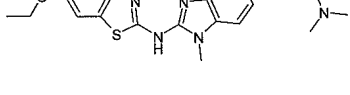
[0890]

번호	구조	이름
350		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디메틸아미노-프로필)-아미드
351		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디에틸아미노-프로필)-아미드
352		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디에틸아미노-프로필)-아미드
353		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디에틸아미노-프로필)-아미드
354		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-피롤리딘-1-일-프로필)-아미드

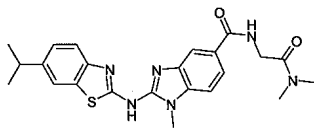
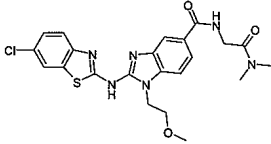
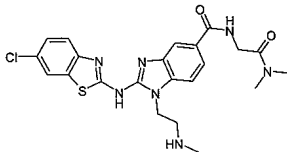
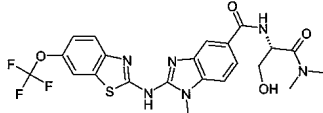
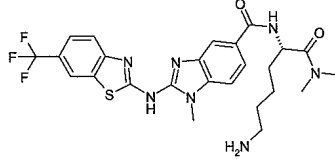
[0891]

번호	구조	이름
355		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [3-(4-메틸-피페라진-1-일)- 프로필]-아미드
356		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [3-(4-메틸 -피페라진-1-일)-프로필]-아미 드
357		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 틸-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [3-(4-메틸-피페라진-1-일)- 프로필]-아미드
358		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (3-모르폴린-4-일-프로필)- 아미드
359		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (3-모르폴 린-4-일-프로필)-아미드

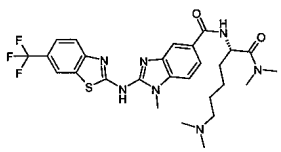
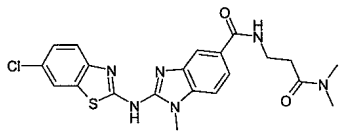
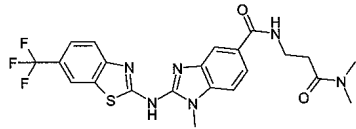
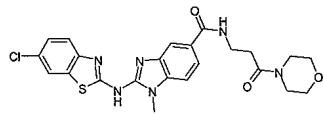
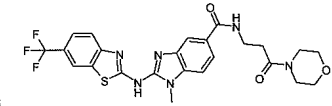
[0892]

번호	구조	이름
360		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 (4-디에틸아미노-부틸)-아 미드
361		6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6- 트리플루오로메톡시-벤조티아 졸-2-일아미노)-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 디메틸카 바모일메틸-아미드
362		6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6- 트리플루오로메톡시-벤조티아 졸-2-일아미노)-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-모르폴 린-4-일-에틸)-아미드
363		1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸- 2-일아미노)-1H-벤조이미다졸 -5-카르복시산 디메틸카바모 일메틸-아미드
364		2-(6-에톡시-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 디메틸카 바모일메틸-아미드

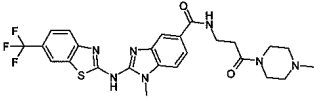
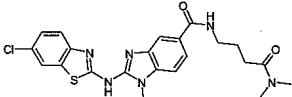
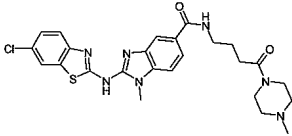
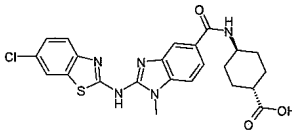
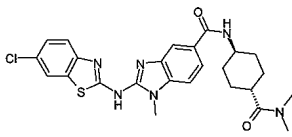
[0893]

번호	구조	이름
365		2-(6-이소프로필-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
366		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
367		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드 염산염
368		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-2-히드록시-에틸)-아미드
369		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-5-아미노-1-디메틸카바모일-펜틸)-아미드 염산염

[0894]

번호	구조	이름
370		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-5-디메틸아미노-1-디메틸카바모일-펜틸)-아미드
371		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드
372		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드
373		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-모르폴린-4-일-3-옥소-프로필)-아미드
374		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-모르폴린-4-일-3-옥소-프로필)-아미드

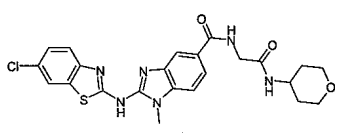
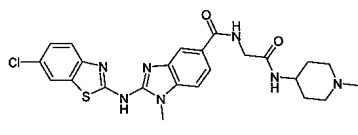
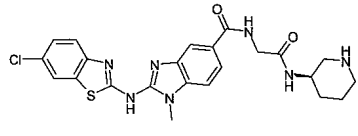
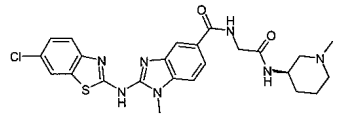
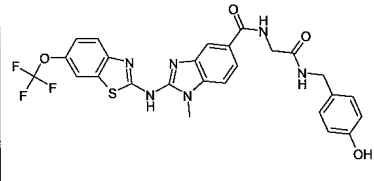
[0895]

번호	구조	이름
375		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [3-(4-메틸-피페라진-1-일)-3-옥소-프로필]-아미드
376		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-디메틸카바모일-프로필)-아미드
377		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [4-(4-메틸-피페라진-1-일)-4-옥소-부틸]-아미드
378		4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-트랜스-시클로헥산카르복시산
379		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-트랜스-디메틸카바모일-시클로헥실)-아미드

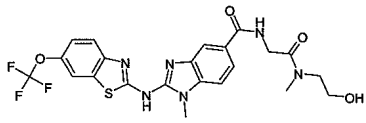
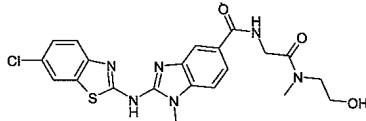
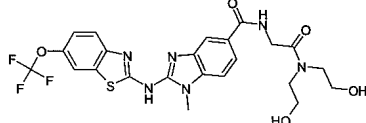
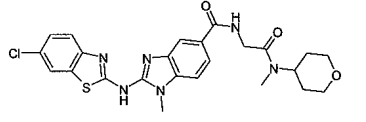
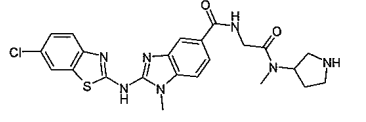
[0896]

번호	구조	이름
380		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 메틸카바 모일메틸-아미드
381		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 틸-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 메틸카바모일메틸-아미드
382		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[[R]-2-히 드록시-프로필카바모일)-메 틸]-아미드
383		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(2-메탄솔 포닐-에틸카바모일)-메틸]-아 미드
384		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [(테트라하 드로-푸란-3-일카바모일)-메 틸]-아미드

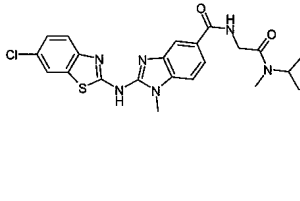
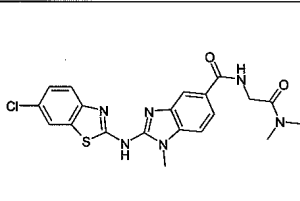
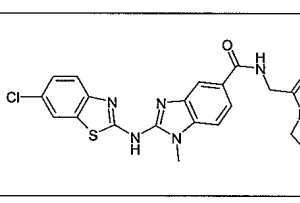
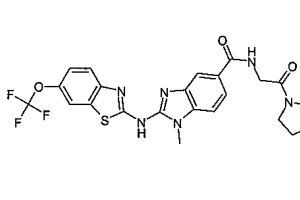
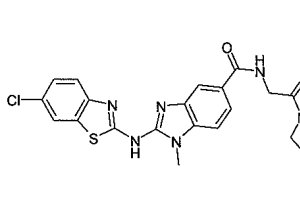
[0897]

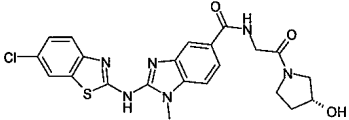
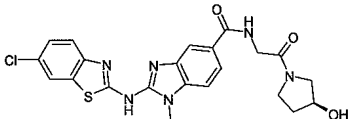
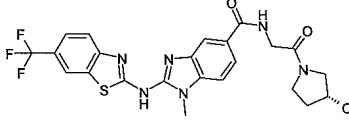
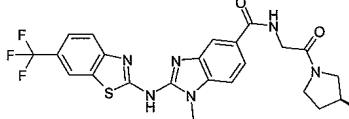
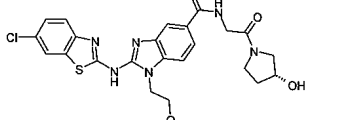
번호	구조	이름
385		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(테트라히드로-피란-4-일카바모일)-메틸]-아미드
386		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(1-메틸-피페리딘-4-일카바모일)-메틸]-아미드
387		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-피페리딘-3-일카바모일메틸)-아미드 염산염
388		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [((R)-1-메틸-피페리딘-3-일카바모일)-메틸]-아미드
389		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(4-히드록시-벤질카바모일)-메틸]-아미드

[0898]

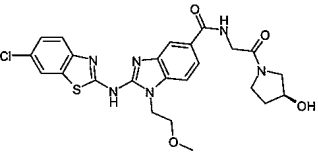
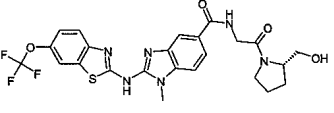
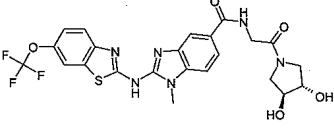
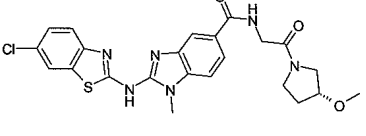
번호	구조	이름
390		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [[2-히드록시-에틸]-메틸- 카바모일]-메틸]-아미드
391		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[2-히드 록시-에틸]-메틸-카바모일]-메 틸]-아미드
392		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [[비스-(2-히드록시-에틸)- 카바모일]-메틸]-아미드
393		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[메틸-(테 트라히드로-피란-4-일)-카바모 일]-메틸]-아미드
394		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[메틸-피 롤리딘-3-일-카바모일]-메틸]- 아미드 염산염

[0899]

번호	구조	이름
395		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[메틸-(1- 메틸-피롤리딘-3-일)-카바모 일]-메틸]-아미드
396		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [[메틸-피 페리딘-3-일-카바모일]-메틸]- 아미드 염산염
397		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2- 피롤리딘-1-일-에틸)-아미드
398		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(3-히드록시-피롤리딘- 1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
399		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드 록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소- 에틸]-아미드

번호	구조	이름
400		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
401		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
402		1-메틸-2-(6-(트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
403		1-메틸-2-(6-(트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
404		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[0901]

번호	구조	이름
405		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
406		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-2-히드록시메틸-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
407		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((3S,4S)-3,4-디히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
408		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

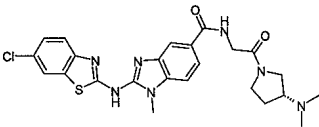
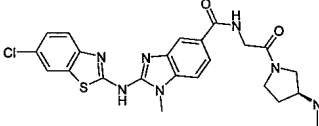
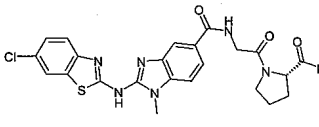
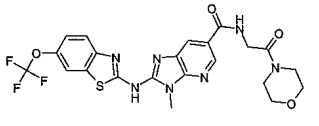
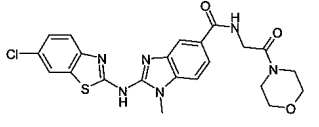
[0902]

번호	구조	이름
409		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
410		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
411		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염
412		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염

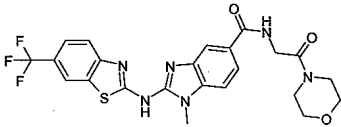
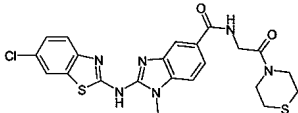
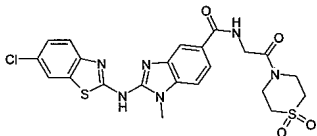
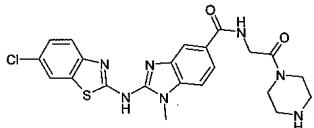
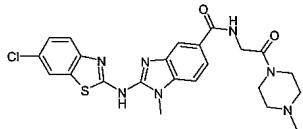
[0903]

번호	구조	이름
413		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염
414		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염
415		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
416		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

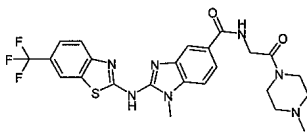
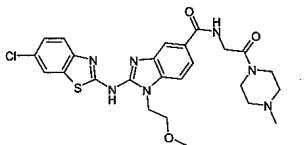
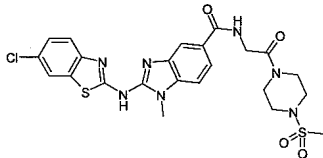
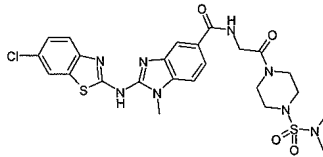
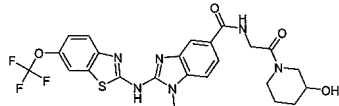
[0904]

번호	구조	이름
417		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
418		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
419		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-2-디메틸카바모일-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
420		3-메틸-2-(6-(트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드
421		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드

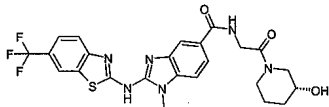
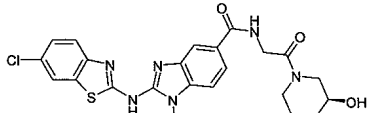
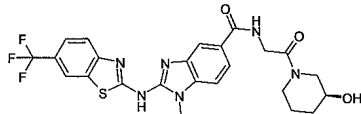
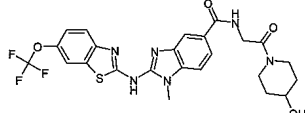
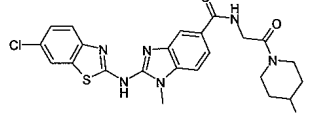
[0905]

번호	구조	이름
422		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아마이드
423		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-티오모르폴린-4-일-에틸)-아미드
424		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(1,1-디옥소-티오모르폴린-4-일)-2-옥소-에틸]-아미드
425		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미드 염산염
426		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

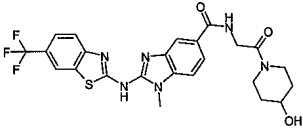
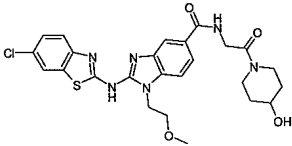
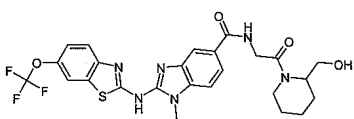
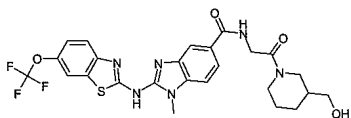
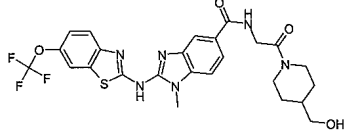
[0906]

번호	구조	이름
427		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
428		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
429		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메탄술폰닐-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
430		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-디메틸술폰파모일-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
431		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

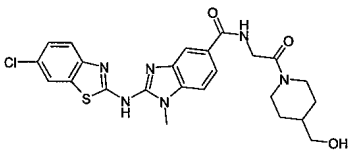
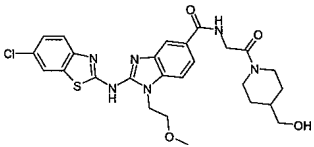
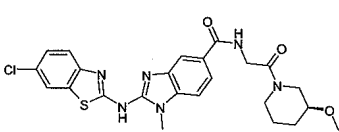
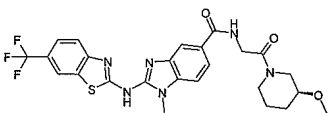
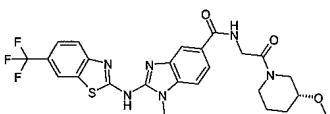
[0907]

번호	구조	이름
432		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
433		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
434		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
435		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
436		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

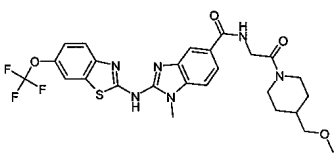
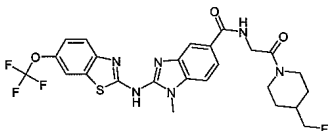
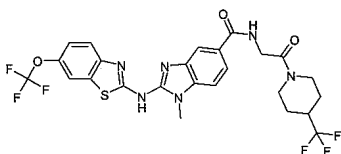
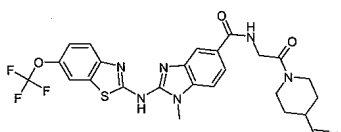
[0908]

번호	구조	이름
437		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
438		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
439		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
440		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
441		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

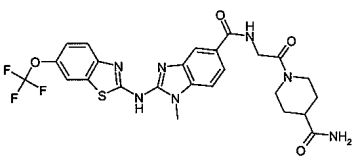
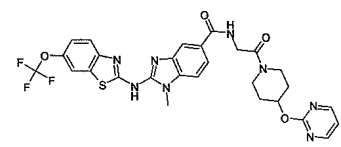
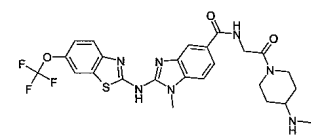
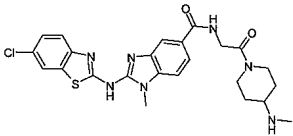
[0909]

번호	구조	이름
442		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
443		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
444		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
445		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
446		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

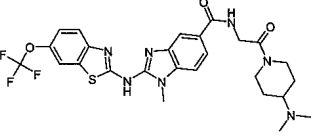
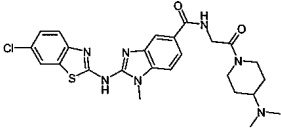
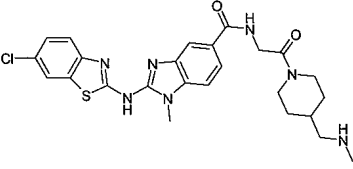
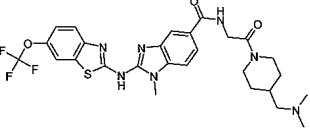
[0910]

번호	구조	이름
447		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메톡시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
448		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-플루오로메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
449		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-옥소-2-(4-트리플루오로메틸-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드
450		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-시아노-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

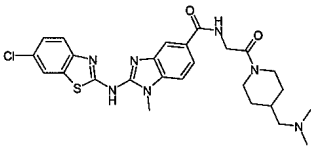
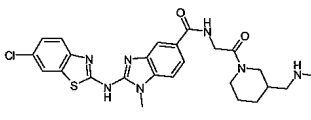
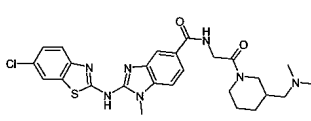
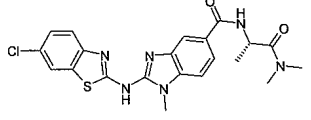
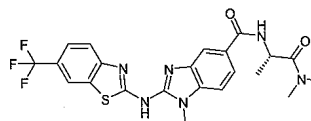
[0911]

번호	구조	이름
451		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-카바모일-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
452		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-[4-(피리미딘-2-일옥시)-피페리딘-1-일]-에틸)-아미드
453		1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸아미노-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염
454		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸아미노-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염

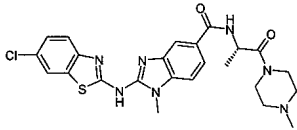
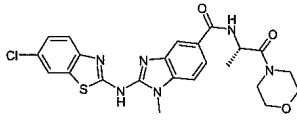
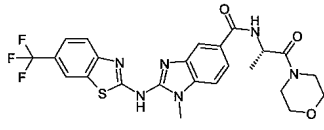
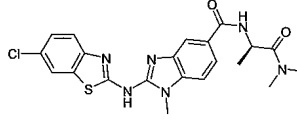
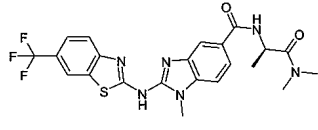
[0912]

번호	구조	이름
455		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-디메틸아미노-피페리 딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
456		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(4-디메 틸아미노-피페리딘-1-일)-2-옥 소-에틸]-아미드
457		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일 아미노)-1-메틸-1H-벤조이미 다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸 아미노메틸-피페리딘-1-일)-2- 옥소-에틸]-아미드 염산염
458		1-메틸-2-(6-트리플루오로메 톡시-벤조티아졸-2-일아미노)- 1H-벤조이미다졸-5-카르복시 산 [2-(4-디메틸아미노메틸-피 페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아 미드

[0913]

번호	구조	이름
459		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-디메틸아미노메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
460		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-메틸아미노메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드 염산염
461		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-디메틸아미노메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
462		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드
463		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드

[0914]

번호	구조	이름
464		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸)-아미드
465		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드
466		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드
467		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드
468		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드

[0915]

번호	구조	이름
469		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
470		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
471		2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드
472		1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-메틸-2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드

[0916]

[0917]

HMOX1의 수준 또는 활성을 증가시키는 화합물은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증 및 고혈압; 당뇨병 및 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병), 및 다발성 경화증; 천식; 만성 폐쇄성 폐질환; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 미숙아의 망막병증; 및 암과 같으나 이에 제한되지 않는, 산화적 스트레스와 적어도 부분으로 관련될 수 있는 질환 또는 상태를 치료하는데 잠재적으로 유용하다.

[0918]

그러므로 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염은 이들 질환의 하나 이상의 치료에 유용할 수 있다.

[0919]

한 구체예에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 포함하는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 1 내지 271의 구체예들(상기 열거됨) 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 포함하는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 구체예에서, 약학적 조성물은 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염) 및 약학적으로 허용가능한 담체, 부형제, 희석제, 또는 그것의 혼합물을 포함한다.

[0920]

구체예에서, 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 함유하는 약학적 조성물은, 예를 들어 정제형, 트로키형, 마름모형, 수성, 또는 오일현탁액, 분산가능한 분말 또는 과립제, 유화제, 경질 또는 연질캡슐, 혹은 시럽 또는 엘릭시르제로서 구강 사용에 적합한 형태로 있을 수 있다. 구강 사용으로 의도된 조성물은 종래 방법에 따라 제조될 수 있고, 이들 조성물은 약학적으로 세련되고 맛있는 제제를 제공하기 위해 감미료, 착향료, 착색료, 및 보존제로 구성된 군으로부터 선택된 하나 이상의 물질을 함유할 수 있다. 정제는 정제 제조에 적합한 비독성 약학적으로-허용가능한 부형제와 혼합한 활성 성분을 함유할 수 있다. 이들 부형제는 예를 들어, 불활성 희석제, 예를 들어 탄산칼슘, 탄산나트륨, 락토스, 인산칼슘 또는 인산나트륨; 과립화 및 봉해제, 예를 들어 옥수수전분 또는 알긴산; 결합제, 예를 들어, 전분, 젤라틴 또는 아카시아; 및 윤활제, 예를 들어 스테아르산마그네슘, 스테아르산 또는 탈크일 수 있다. 정제는 코팅하지 않거나, 또는 위장관에 분해 및 흡수를 지연시키는 종래 기술에 의해 코팅되어, 따라서 더 긴시간 이상 지속된 활동을 제공할 수 있다. 예를 들어, 시간 지연 재료, 예를 들어 글리세릴 모노스테아레이트 또는 글리세릴 디스테아레이트가 사용될 수 있다.

그것들은 또한 미국특허 제4,356,108호, 제4,166,452호, 및 제4,265,874호에 기술된 기술에 의해 코팅되어 조절된 방출을 위한 삼투 치료적 정제를 형성할 수 있다.

[0921] 다른 구체예에서, 구강 사용을 위한 조제는 경질 젤라틴 캡슐로서 존재되어, 이것의 활성 성분이 불활성 고체 희석제, 예를 들어, 탄산칼슘, 인산칼슘 또는 카올린으로 혼합될 수 있고, 또는 연질 젤라틴 캡슐의 활성 성분은 물 또는 오일 매질, 예를 들어 땅콩 오일, 액체 파라핀, 또는 올리브 오일과 섞여진다.

[0922] 다른 구체예에서, 조성물은 수성 현탁액을 포함할 수 있다. 수성 현탁액은 수성 현탁액의 제조에 적합한 부형제와의 혼합물로 활성 화합물을 함유할 수 있다. 이들 부형제는 현탁제, 예를 들어 나트륨카복시메틸셀룰로오스, 메틸셀룰로오스, 히드록시프로필메틸셀룰로오스, 알긴산나트륨, 폴리비닐피롤리돈, 트래거캔스고무 및 아카시아고무일 수 있고; 분산 또는 습윤제는 자연적으로-발생하는 포스파티드, 예를 들어 레시틴, 또는 산화알킬렌의 지방산과의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 스테아레이트, 또는 산화에틸렌의 긴쇄 지방족 알코올과의 축합 생성물, 예를 들어, 헵타데카에틸렌옥시세탄올, 또는 산화 에틸렌의 지방산 및 헥시톨로부터 유도된 부분 에스테르와의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비톨 모노올레이트, 또는 산화 에틸렌의 지방산 및 헥시톨 무수물로부터 유도된 부분 에스테르와의 축합 생성물, 예를 들어 폴리에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 수성 현탁액은 또한 하나 이상의 착색료, 하나 이상의 착향료, 및 하나 이상의 감미료, 예를 들어 수크로오스 또는 사카린을 함유할 수 있다.

[0923] 또한, 오일 현탁액은 활성 성분을 식물성 오일, 예를 들어 낙화생 오일, 올리브 오일, 참깨 오일 또는 코코넛 오일에서, 혹은 미네랄 오일, 예를 들어 액체 파라핀 중에 분산시킴으로써 조제될 수 있다. 오일 현탁액은 농조화제, 예를 들어 비즈왁스, 경질 파라핀 또는 세틸 알코올을 함유할 수 있다. 상기 제시된 것과 같은 감미료, 및 착향료는 맛있는 구강 제조를 얻기 위해 추가될 수 있다. 이들 조성물은 항산화제, 예를 들어 아스코르브산의 첨가에 의해 보존될 수 있다.

[0924] 물의 첨가에 의해 수성 현탁액 제조에 적합한 분산가능한 분말 및 과립제는 분산 또는 습윤제, 현탁제 및 하나 이상의 보존제와의 혼합물로 활성 화합물을 제공한다. 적합한 분산 또는 습윤제 및 현탁제는 이미 상기 언급된 것들에 의해 예시된다. 추가 부형제, 예를 들어, 감미료, 착향료, 및 착색료도 존재할 수 있다.

[0925] 본 발명의 약학적 조성물은 또한 수중유 에멀션 형태로 있을 수 있다. 오일 상은 식물성 오일, 예를 들어, 올리브 오일 또는 낙화생 오일, 혹은 미네랄 오일, 예를 들어 액체 파라핀, 또는 그것의 혼합물일 수 있다. 적합한 에멀션은 자연적으로-발생하는 고무, 예를 들어 아카시아고무 또는 트래거캔스고무, 자연적으로-발생하는 포스파티드, 예를 들어 대두, 레시틴, 및 지방산 및 헥시톨 무수물로부터 유도된 에스테르 또는 부분 에스테르, 예를 들어 소르비탄 모노올레이트, 및 상기 부분 에스테르의 산화 에틸렌과의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 유화제는 또한 감미료 및 착향료를 함유할 수 있다.

[0926] 다른 구체예에서, 본 발명의 약학적 조성물은 시럽 또는 엘릭시르제를 포함할 수 있다. 시럽 및 엘릭시르제는 감미료, 예를 들어 글리세롤, 프로필렌글리콜, 소르비톨 또는 수크로오스로 조제될 수 있다. 이들 조제는 또한 보호제, 보존제와 착향료 및 착색료를 함유할 수 있다. 약학적 조성물은 멸균 주사제 수성 또는 유성 현탁액 형태로 있을 수 있다. 이 현탁액은 상기 기술된 적합한 분산 또는 습윤제 및 현탁제를 사용하여 알려진 방법에 따라 조제될 수 있다. 멸균 주사제 제제는 비독성 비경구적으로-허용가능한 희석제 또는 용매 중의 멸균 주사제 용액 또는 현탁액, 예를 들어 1,3-부탄디올 중의 용액으로서 일 수 있다. 사용될 수 있는 허용가능한 부형제 및 용매는 물, 링거액, 및 등장성 염화나트륨 용액이다. 게다가, 멸균, 고정된 오일은 용매 또는 현탁 매질로서 편리하게 사용된다. 이 목적을 위해, 어떤 완하성 지방유가 합성의 모노- 또는 디글리세리드를 사용하여 사용될 수 있다. 게다가, 올레산과 같은 지방산은 주사제 제조에서의 사용이 발견된다.

[0927] 본 발명의 약학적 조성물은 또한 본 발명 화합물의 직장 투여용 좌약 형태로 있을 수 있다. 이들 조성물은 약물을 적합한 보통 온도에서는 고체이고, 직장 온도에서는 액체여서, 직장에서 약물을 방출하기 위해 녹을 고체인 비자극 부형제와 혼합함으로써 제조될 수 있다. 이들 재료는 예를 들어, 코코아 버터 및 폴리에틸렌 글리콜을 포함한다.

[0928] 구체예에서, 국부 사용을 위해, 본 발명의 화합물을 함유하는 크림, 연고, 젤리, 현탁액들의 용액, 등이 사용될 수 있다. 이 적용의 목적을 위해, 국부 적용은 구세액 및 가글을 포함할 것이다.

[0929] 구체예에서, 식(I)의 화합물 및 그것의 약학적으로 허용가능한 염은 또한 작은 단충관성소포제, 큰 단충관성소포제, 및 다충관성소포제와 같은 리포솜 전달 시스템형으로 투여될 수 있다. 리포솜은 다양한 인지질, 예를 들어 콜레스테롤, 스테아릴아민, 또는 포스파티딜콜린으로부터 형성될 수 있다.

- [0930] 염기성 또는 산성기가 구조에 존재하는, 식(I) 화합물의 약학적으로 허용가능한 염은 또한 본 발명의 범위 안에 포함된다. 용어 "약학적으로 허용가능한 염"은, 생물학적으로 또는 달리 바람직하지않은 본 발명 화합물의 염을 의미하고, 일반적으로 유리 염기를 적합한 유기 또는 무기산과 반응시킴으로써 또는 산을 적합한 유기 또는 무기염기와 반응함으로써 제조된다. 대표적인 염은 아세트레이트, 벤젠술폰산염, 벤조산염, 중탄산염, 중황산염, 중주석산염, 붕산염, 브롬화물, 칼슘에데테이트, 칼실레이트, 탄산염, 염화물, 클라불라네이트, 시트르산염, 이염산염, 에데테이트, 에디실레이트, 에스톨레이트, 에실레이트, 푸마레이트, 글루셉테이트, 글루콘산염, 글루타민산염, 글리콜릴아르사닐레이트, 헬실레줄신산염, 히드라바민, 브롬화수소산염, 염산염, 히드록시나프토에이트, 요오드화물, 이세치오네이트, 젯산염, 락토비오네이트, 라우르산염, 말산염, 말레산염, 만텔산염, 메실레이트, 메틸브롬화물, 메틸질산염, 메틸설페이트, 말레산일칼륨, 점액산염, 납실산염, 질산염, N-메틸글루카민, 옥살산염, 과오산염(엠보네이트), 팔미트산염, 판토텐산염, 인산염/이인산염, 폴리갈락투로네이트, 칼륨, 살리실산염, 나트륨, 스테아르산염, 2차 아세트레이트, 숙신산염, 타닌산염, 주석산염, 테오클레이트, 토실레이트, 트리에치오다이드, 트리메틸암모늄 및 발레르산염을 포함한다. -COOH와 같은 산성 치환기가 존재할 때, 투여량 형태로서의 사용을 위해, 암모늄, 모폴리늄, 나트륨, 칼륨, 바륨, 칼슘염, 등이 형성될 수 있다. 염기성 기는, 예를 들어 아미노 또는 염기성 헤테로아릴라디칼, 예를 들어, 피리딜이 존재할 때, 산성염, 예를 들어 염산염, 브롬화수소산염, 인산염, 황산염, 트리플루오로아세트레이트, 트리클로로아세트레이트, 아세트레이트, 옥살산염, 말레산염, 피루브산염, 말론산염, 숙신산염, 시트르산염, 주석산염, 푸마레이트, 만텔산염, 벤조산염, 신남산염, 메탄술폰산염, 에탄술폰산염, 피크르산염 등으로 형성되고, Stephen M. Berge, et al., *J. Pharm. Sci.*, Vol. 66(1), pp.1-19(1977)에 열거된 약학적으로 허용가능한 염과 관련된 산을 포함한다.
- [0931] 따라서, 다른 구체예에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염, 및 하나 이상의 약학적으로 허용가능한 담체, 부형제, 또는 희석제를 포함하는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염) 및 하나 이상의 약학적으로 허용가능한 담체, 부형제, 또는 희석제를 포함하는 약학적 조성물을 제공한다.
- [0932] 다른 구체예에서, 본 발명은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 약물사용을 위해 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 약물 사용을 위해 제공한다.
- [0933] 본 발명은 식(I)의 화합물, 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 동시, 후속, 또는 순차적인 투여를 위한 하나 이상의 의학상으로 효과적인 활성 화합물과의 조합으로 더 제공한다. 본 발명은 또한 동시, 후속, 또는 순차적인 투여를 위한 하나 이상의 의학상으로 효과적인 활성 화합물과의 조합으로 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 위해 제공한다. 이들 의학상으로 효과적인 활성 성분의 예는 Nrf2 활성제, 항산화제, 해독제, 및 소염제를 포함하나 이에 제한되지 않는다. 한 구체예에서, 본 발명은 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염) 및 Nrf2 활성제, 항산화제, 해독제, 및 소염제로부터 선택된 적어도 하나의 다른 의학상으로 효과적인 활성 성분을 포함하는 약학적 조성물을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 동시, 후속, 또는 순차적인 투여를 위한 Nrf2 활성제, 항산화제, 해독제, 및 소염제로부터 선택된 적어도 하나의 다른 의학상으로 효과적인 활성 성분과의 조합으로 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 위해 제공한다.
- [0934] Nrf2 활성제의 예는 술포라판, 아비신, 15dPGJ₂, 잔토희물, 커큐민, 카르노솔, 제롬본, 이소티오시아네이트, α-리포산, 올티프라즈(4-메틸-5-[2-피라진일]-1,2-디티올-3-티온), 1,2-디티올-3-티온, 및 2,3-부틸-4-히드록시아니솔을 포함한다.
- [0935] 항산화제의 예는 비타민 C, 비타민 E, 카로티노이드, 레티노이드, 폴리페놀, 플라보노이드, 리그난, 셀레늄, 부틸화히드록시아니솔, 에틸렌디아민테트라-아세트레이트, 칼슘이나트륨, 아세틸시스테인, 프로부콜, 및 템포를 포함한다.
- [0936] 해독제의 예는 디메틸카프롤, 글루타티온, 아세틸시스테인, 메티오닌, 탄산수소나트륨, 테페록사민메실레이트, 칼슘이나트륨에데테이트, 트리엔틴 염산염, 페니실아민, 및 약학적 차콜을 포함한다.
- [0937] 소염제는 스테로이드 소염제 및 비스테로이드 소염제를 포함한다. 스테로이드 소염제의 예는 코르티손 아세트레이트, 히드로코르티손, 파라메타손 아세트레이트, 프레드니솔론, 프레드니솔론, 메틸프레드니, 텍사메타손, 트리암시놀론, 및 베타메타손을 포함한다. 비스테로이드 소염제의 예는 살리실산 비스테로이드 소염제, 예를 들어 아스피린, 디플루니살, 아스피린+아스코르브산, 및 아스피린디알루미늄에이트; 아릴산 비스테로이드 소염제, 예를

들어 디클로페낙 나트륨, 숄린닥, 펜부펜, 인도메타신, 인도메타신 파르네실, 아세메타신, 프로글루메타신 말레이트, 암페낙 나트륨, 나부메톤, 모페졸락, 및 에토도락; 폐낭산 비스테로이드 소염제, 예를 들어 메페남산, 플루페남산 알루미늄, 톨페남산, 및 플룩타페닌; 프로피온산 비스테로이드 소염제, 예를 들어 이부프로펜, 플루비프로펜, 케토프로펜, 나프록센, 프라노프로펜, 페노프로펜 칼슘, 티아프로펜, 옥사프로진, 록소프로펜 나트륨, 알미노프로펜, 및 잘토프로펜; 옥시캄 비스테로이드 소염제, 예를 들어 피록시캄, 암피록시캄, 테녹시캄, 로녹시캄, 및 멜록시캄; 및 염기성 비스테로이드 소염제, 예를 들어 티아라미드 염산염, 에피리졸, 및 에모르파존을 포함한다.

[0938] 사용 방법

[0939] 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염, 혹은 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 포함하는 약학적 조성물은, 대상에서 전사 인자 Nrf2의 활성화에 의해, HMOX1의 활성 및/또는 양을 증가시킴으로써, ROS의 양을 감소시킴으로써, 치료할 수 있는 질환 또는 상태의 치료를 위해 사용될 수 있다. 치료는 전신이 될 수 있고, 또는 표적화될 수 있는데, 예를 들어, 인체에서 단핵구 및 대식세포에서 발견된 유도성 핵옥시게나제에 표적화될 수 있다.

[0940] 대상에서 전사 인자 Nrf2의 활성화에 의해, HMOX1의 활성 및/또는 양을 증가시킴으로써, ROS의 양을 감소시킴으로써, 치료할 수 있는 질환 또는 상태의 예는 뇌신경 퇴행성 질환, 눈병, 피부병, 천식, 암, 동맥경화증 및 그것과 관련된 질환 또는 상태를 포함한다. 뇌신경 퇴행성 질환의 예는 알츠하이머병, 파킨슨병, 및 루게릭병을 포함한다. 게다가, 눈병의 예는 노화 관련 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 미숙아의 망막병증을 포함한다. 만성 염증성 질환의 구체 예는 혈관염, 폐기관지염, 류마티스관절염, 퇴행성관절염, 간염, 췌장염, 피부염, 식도염, 궤양성대장염, 크론병, 및 결막염을 포함한다. 치료할 수 있는 상태의 추가 예는 혈전증 및 신장 질환을 포함한다. 따라서 본 발명은, 상기 언급된 질환 또는 상태 중 하나를 치료하기 위해, 대상에게 식(I)의 화합물 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다.

[0941] 한 구체예에서, 본 발명은 사람에게 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 사람에게 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 적어도 0.1 밀리그램을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다.

[0942] 다른 구체예에서, 본 발명은 만성 염증을 치료하기 위해, 사람에게 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다. 추가 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터 선택된 질환 또는 상태를 치료하기 위해, 사람에게 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다.

[0943] 다른 구체예에서, 본 발명은 약물 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 만성 염증의 치료에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 만성 염증 예방에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터 선택된 질환 또는 상태의 예방에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터 선택된 질환 또는 상태 예방에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다.

[0944] 다른 구체예에서, 본 발명은 만성 염증치료용 약제의 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 만성 염증 예방용 약제의 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다. 다른 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터 선택된 질환 또는 상태 치료용 약제의 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다. 추가 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터 선택된 질환 또는 상태 예방용 약제의 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다. 추가 구체예에서, 본 발명은 류마티스관절염, 만성 염증성 장질환, 다발성 경화증, 천식, 기도염증질환, 건염, 및 뇌에서의 만성 염증으로부터

터 선택된 질환 또는 상태 예방용 약제의 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다.

[0945] 다른 구체예에서, 본 발명은 대상에서 HMOX1의 활성 또는 양을 증가시키기 위해, 사람에게 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다. 추가 구체예에서, 본 발명은 사람에서 HMOX1의 활성 또는 양을 증가시키기 위해, 약제 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다.

[0946] 다른 구체예에서, 본 발명은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증, 말초혈관질환, 혈전증, 허혈-재관류 현상, 울혈성 심부전, 일차 및 이차 폐동맥 고혈압 및 고혈압; 신장질환, 예를 들어 급성 세뇨관괴사; 사구체신염, 예를 들어 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염 및 투석을 위한 지지요법, 예를 들어 동맥류의 개선; 폐질환, 예를 들어 기관지염, 기관지확장증, 만성 폐쇄성 폐질환, 폐부종, 천식, 폐기종, 유육종증; 간질환, 예를 들어 흉터(scarring)를 이끄는 것들 및 섬유증, 예를 들어 담즙울혈, 간염 B 및 C 감염, 간경변; 자가면역질환 혹은 그것의 합병증, 예를 들어 류마티스관절염, 강직성 척수염, 루프스, 경피증 및 건선; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 당뇨병의 망막병증, 미숙아; 및 암; 이식을 위한 지지요법, 예를 들어 이식의 생존력 및 허혈손상의 감소로부터 선택된 질환 또는 상태를 치료하기 위해, 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 사람에게 투여하는 단계를 포함하는 치료 방법을 제공한다.

[0947] 다른 구체예에서, 본 발명은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증, 말초혈관질환, 혈전증, 허혈-재관류 현상, 울혈성 심부전, 일차 및 이차 폐동맥 고혈압 및 고혈압; 신장질환, 예를 들어 급성 세뇨관괴사; 사구체신염, 예를 들어 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염 및 투석을 위한 지지요법, 예를 들어 동맥류의 개선; 폐질환, 예를 들어 기관지염, 기관지확장증, 만성 폐쇄성 폐질환, 폐부종, 천식, 폐기종, 유육종증; 간질환, 예를 들어 흉터를 이끄는 것들 및 섬유증, 예를 들어 담즙울혈, 간염 B 및 C 감염, 간경변; 자가면역질환 혹은 그것의 합병증, 예를 들어 류마티스관절염, 강직성 척수염, 루프스, 경피증 및 건선; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 당뇨병의 망막병증, 미숙아; 및 암; 이식을 위한 지지요법, 예를 들어 이식의 생존력 및 허혈손상의 감소로부터 선택된 질환 또는 상태 치료에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다.

[0948] 다른 구체예에서, 본 발명은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증, 말초혈관질환, 혈전증, 허혈-재관류 현상, 울혈성 심부전, 일차 및 이차 폐동맥 고혈압 및 고혈압; 신장질환, 예를 들어 급성 세뇨관괴사; 사구체신염, 예를 들어 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염 및 투석을 위한 지지요법, 예를 들어 동맥류의 개선; 폐질환, 예를 들어 기관지염, 기관지확장증, 만성 폐쇄성 폐질환, 폐부종, 천식, 폐기종, 유육종증; 간질환, 예를 들어 흉터를 이끄는 것들 및 섬유증, 예를 들어 담즙울혈, 간염 B 및 C 감염, 간경변; 자가면역질환 혹은 그것의 합병증, 예를 들어 류마티스관절염, 강직성 척수염, 루프스, 경피증 및 건선; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 당뇨병의 망막병증, 미숙아; 및 암; 이식을 위한 지지요법, 예를 들어 이식의 생존력 및 허혈손상의 감소로부터 선택된 질환 또는 상태의 예방에서의 사용을 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)을 제공한다.

[0949] 다른 구체예에서, 본 발명은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증, 말초혈관질환, 혈전증, 허혈-재관류 현상, 울혈성 심부전, 일차 및 이차 폐동맥 고혈압 및 고혈압; 신장질환, 예를 들어 급성 세뇨관괴사; 사구체신염, 예를 들어 당뇨병병증, 예를 들어 사구체신염 및 투석을 위한 지지요법, 예를 들어 동맥류의 개선; 폐질환, 예를 들어 기관지염, 기관지확장증, 만성 폐쇄성 폐질환, 폐부종, 천식, 폐기종, 유육종증; 간질환, 예를 들어 흉터를 이끄는 것들 및 섬유증, 예를 들어 담즙울혈, 간염 B 및 C 감염, 간경변; 자가면역질환 혹은 그것의 합병증, 예를 들어 류마티스관절염, 강직성 척수염, 루프스, 경피증 및 건선; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 당뇨병의 망막병증, 미숙아; 및 암; 이식을 위한 지지요법, 예를 들어 이식의 생존력 및 허혈손상의 감소로부터 선택된 질환 또는 상태의 치료용 약제 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다.

[0950] 다른 구체예에서, 본 발명은 심혈관질환, 예를 들어 동맥경화증, 말초혈관질환, 혈전증, 허혈-재관류 현상, 울혈성 심부전, 일차 및 이차 폐동맥 고혈압 및 고혈압; 신장질환, 예를 들어 급성 세뇨관괴사; 사구체신염, 예를

들어 당뇨병증, 예를 들어 사구체신염 및 투석을 위한 지지요법, 예를 들어 동맥류의 개선; 폐질환, 예를 들어 기관지염, 기관지확장증, 만성 폐쇄성 폐질환, 폐부종, 천식, 폐기종, 유육종증; 간질환, 예를 들어 흉터를 이끄는 것들 및 섬유증, 예를 들어 담즙울혈, 간염 B 및 C 감염, 간경변; 자가면역질환 혹은 그것의 합병증, 예를 들어 류마티스관절염, 강직성 척수염, 루프스, 경피증 및 건선; 뇌신경 퇴행성 질환, 예를 들어 알츠하이머병, 파킨슨병, ALS(루게릭병) 및 다발성 경화증; 피부병; 눈병, 예를 들어 시력 감퇴, 백내장, 가벼운 망막병증, 및 당뇨병의 망막병증, 미숙아; 및 암; 이식을 위한 지지요법, 예를 들어 이식의 생존력 및 허혈손상의 감소로부터 선택된 질환 또는 상태의 예방용 약제 제조를 위한 구체예 1 내지 271 중 어느 하나의 화합물(또는 염)의 사용을 제공한다.

[0951] 상기 기술된 방법 또는 사용의 각각에서, 구체예 1 내지 271의 어떤 화합물(또는 염)은 상기 기술된 약학적 조제의 부분으로서 대상에 투여될 수 있다.

[0952] 실시예

[0953] 본 발명의 화합물을 제조하는 방법에 사용되는 일반적인 절차는 하기 기술된다.

[0954] 일반적인 실험 섹션

[0955] LC-MS 데이터틀, Mux-UV 2488 다중채널 UV-Vis 검출기(215 및 254 nm에서 기록함) 및 Sepax GP-C18, 4.6 × 50 mm; 5 미크론 입자크기 컬럼을 사용하는 Leap Technologies HTS PAL Auto 샘플러가 갖춰진 4개의 Waters® 1525 이원 HPLC 펌프를 가동하는 평행 MUX™시스템 상의 구매 용리를 사용하여 얻는다. 일반적으로, 3분 구배를 25% B(97.5% 아세토니트릴, 2.5% 물, 0.05% TFA) 및 75% A(97.5% 물, 2.5% 아세토니트릴, 0.05% TFA) 내지 100% B로 가동한다. 시스템을 전자분무 이온화를 사용하는 Waters Micromass ZQ 질량분석기와 접속한다. MassLynx 소프트웨어가 사용된다. 모든 MS 데이터를, 달리 언급되지 않은 한, 양성 방식에서 얻었다. 보고된 m/z 데이터는 일반적으로 M⁺이온에 대해 약 ±1 내로 정밀하다.

[0956] ¹H NMR 데이터를 Varian® Mercury 400 MHz 분광기 상에서 얻었고, 화학 이동은 잔류 용매 프로톤 신호(예를 들어, CDCl₃ 중의 잔류 CHCl₃) 또는 내부 기준으로서 TMS 신호를 사용하여 표시된다. 마이크로파 가열 절차를 일부 실험에 사용하였고, 이들 경우에서, 상승된 온도에서 가압된 유리 반응 용기의 사용이 포함된, Discover® 마이크로파 합성 시스템(CEM, Matthews, NC, USA)을 사용하였다.

[0957] 무수 용매를 포함하는 모든 시약 및 용매는 상업적으로 구매가능하고, 달리 기술되지 않은 한, 받은 상태로 사용하였다. Grignard 시약 및 유기리튬 시약의 어떤 용액은 상업적으로 구매가능하고, 그것의 라벨 상에 언급된 농도에서 받은 상태로 사용하였다. 반응은 대부분의 경우에서 자석 교반하는 장비 및 자석 교반 막대를 사용하여 교반한다. 공기-민감한 시약을 사용하는 모든 반응은 불활성 기체 하에서 실행하였다. 마이크로파-생성 장비를 사용하여 가열하지 않는 반응의 경우, 실험 섹션에서 보고된 반응 온도는 반응 용기 주변에 위치한 오일 욕 또는 냉각 욕의 온도를 의미한다. 마이크로파-생성 장비를 사용하여 수행되는 반응의 경우, 온도는 마이크로파 장비에 의해 보고된 온도를 의미한다.

[0958] 약어

[0959] 하기는 명세서에 사용된 일부 공통 약어의 정의이다. 명세서는 본 분야에 잘 알려진 의미의 다른 약어도 사용할 수 있다.

[0960] AcOH = 아세트산

[0961] DCM = 디클로로메탄

[0962] DIEA = 디이소프로필에틸아민

[0963] DMAP = N,N'-디메틸아미노피리딘

[0964] DME = 1,2-디메톡시에탄

[0965] DMF = N,N'-디메틸포름아미드

[0966] DMSO = 디메틸설폭시드

[0967] DPPA = 디페닐포스포릴 아지드

- [0968] EDC = 1-에틸-3-(3-디메틸아미노프로필)카보디이미드
- [0969] EtOAc = 에틸 아세테이트
- [0970] EtOH = 에탄올
- [0971] ^1H NMR = 프로톤 NMR 분석
- [0972] HBTU = 2-(1H-벤조트리아졸-1-일)-1,1,3,3-테트라메틸우로늄 헥사플루오로포스페이트
- [0973] HCl = 염산
- [0974] LC/MS = 액체크로마토그래피-질량분석 분석
- [0975] MeOH = 메탄올
- [0976] OAc = 아세테이트
- [0977] THF = 테트라히드로푸란
- [0978] thioCDI = 1,1'-티오카보닐디이미다졸
- [0979] TLC = 박층크로마토그래피
- [0980] rt 또는 RT = 실온
- [0981] h = 시간
- [0982] min = 분
- [0983] M = 몰농도
- [0984] N = 노르말농도
- [0985] μL = μl = 마이크로리터
- [0986] mL = mL = 밀리리터
- [0987] μg = 마이크로그램
- [0988] mg = 밀리그램
- [0989] g = 그램
- [0990] 일반적인 절차 A: *o*-또는 *p*-니트로할로아렌의 입소(*Ips*o)치환
- [0991] 니트로할로아렌의 DMF 용액에 아민 또는 나트륨알콕시드를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반한다. 그것을 물에 붓고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 조합된 유기 추출물을 물로 세척하고, 염수로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축하여 생성물을 얻고, 이것을 더 정제하지 않고, 다음 단계에서 사용한다.
- [0992] 일반적인 절차 B: 니트로기의 아민으로의 환원
- [0993] 10% Pd/C를 메탄올 중의 니트로 화합물 용액에 첨가한다. 결과되는 혼합물을 H_2 분위기 실온에서 16시간 동안 교반한다. 그 다음 내용물을 셀라이트 또는 실리카겔의 패드를 통해 여과하고, 고체를 메탄올로 수회 세척한다. 여과액 및 세척액을 조합하고, 증발시켜 대응하는 아민을 얻고, 이것을 더 정제하지 않고 다음 단계에서 바로 사용한다.
- [0994] 일반적인 절차 C: 아미노벤조티아졸의 형성
- [0995] 아세트산 중의 아닐린 현탁액에 칼륨 이소티오시아네이트를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 10분 동안 교반한다. 그 다음 아세트산(20 mL) 중의 브롬(1.5 mL) 용액을 20분 이상 첨가한다. 반응 혼합물을 실온에서 24시간 동안 교반한 뒤, 얼음물에 붓고, 28% 수성 수산화암모늄으로 알칼리를 만들고, 결과되는 침전물을 여과하고, 물로 세척하고, 감압 하에서 건조하여 원하는 치환된 아미노벤조티아졸을 얻는다. 생성물을 추가 정제 없이 다음 단계에서 사용한다.

- [0996] 일반적인 절차 D: 티오우레아 형성 및 그것의 아미노벤즈이미다졸로의 전환
- [0997] 1,1'-티오카보닐이미다졸을 DMF 중의 아민 용액(10 mL)에 첨가하고, 반응 혼합물을 90-100 °C(1-24시간)에서 교반한다. 실온에서의 이 반응 혼합물에 EDC를 첨가하고, 60 °C에서 5분 동안 교반한다. 실온에서의 이 반응 혼합물에 치환된 페닐렌디아민을 첨가하고, 90 °C에서 16시간 동안 교반한다. 그 다음 반응 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 얼음물에 붓고, 고체를 여과에 의해 수집한다. 따라서 얻은 미정제 생성물을 DCM-메탄올(9:1)로 분쇄에 의해 정제한다.
- [0998] 일반적인 절차 E: 벤조산 에스테르의 가수분해
- [0999] 물 중의 LiOH 용액을 1:1 THF/MeOH 중의 에스테르 용액에 첨가하고, 결과되는 혼합물을 60 °C에서 16시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 혼합물을 진공 하에서 농축한다. 결과되는 현탁액의 pH는 6 N HCl의 적가에 의해 pH ~3으로 조절하고, 침전물을 여과에 의해 수집하고, 물로 세척하고, 진공 하에서 건조한다. 원하는 카르복시산을 정제 없이 사용한다.
- [1000] 일반적인 절차 F: 커플링 시약으로서 HBTU를 사용한 아마이드 형성
- [1001] 건조 DMF 중의 카르복시산 용액(5-10 mL)에 DIEA 다음 HBTU를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 30분 동안 교반한다. 그 다음 아민을 첨가하고, 반응을 실온에서 16시간 동안 교반한다. 내용물을 얼음물로 희석하고, 생성물을 침전시킨다. 순수 생성물을 물 및 DCM/메탄올로 후속 세척 또는 용리 시스템으로서 헥산/에틸 아세테이트(80:20 내지 60:40)를 사용한 실리카겔 크로마토그래피를 통해 여과 후 분리한다.
- [1002] 일반적인 절차 G: 알킬니트릴의 환원
- [1003] 수소화알루미늄리튬을 건조 에테르(50 mL)에 부유시키고, 질수 분위기 하에서 0 °C로 냉각시킨다. 건조 에테르 중의 니트릴(12.5 mL)을 적가하고, 반응 혼합물을 실온에서 밤새도록 교반한다. 냉각하며 격렬한 교반과 함께, 물(3 mL), 수산화나트륨(20%, 3 mL), 및 물(10 mL)을 첨가한다. 에테르 용액을 기울여 따르고, 잔류물을 에테르(2 × 12.5 mL)로 세척한다. 에테르 부분을 조합하고, 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축시킨다.
- [1004] 일반적인 절차 H: 알코올의 불소화
- [1005] 0 °C로 냉각된 알코올의 DCM 현탁액에 삼불화비스(2-메톡시에틸)아미노황을 적가한다. 반응을 실온으로 되돌리고 6시간 동안 교반한다. 그 다음 그것을 0 °C로 냉각시키고, 물(3 mL)을 적가한다. 수상을 DCM(2 × 3 mL)으로 추출한다. 조합된 유기물을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축시킨다.
- [1006] 일반적인 절차 I: 이미다졸의 형성
- [1007] 단계 1: 아릴니트릴(일반적인 절차 D에 의해 얻은 생성물)을 무수 에탄올(25 mL)에 용해시키고, 이 용액에 염산 기체를 주의깊게 -10 °C에서 30분 동안 캐놀라로 삽입한다. 반응 혼합물을 밀봉하고, 실온에서 16시간 동안 교반하여 아릴 에틸이미테이트를 얻는다. 그 다음 이 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에서 사용한다.
- [1008] 단계 2: EtOH(10 mL) 중의 아릴 에틸이미테이트 용액에 아미노아세트알데히드 디에틸아세탈 및 AcOH를 첨가한다. 그 다음 이 혼합물을 60 °C로 가열하고, 2시간 동안 교반한다. 그 다음 반응 혼합물을 냉각시키고, 진공에서 농축한다. 이 미정제 재료를 다시 EtOH(10 mL)에 용해시키고, 염산(0.2 mL, 물 중의 6N)을 혼합물에 첨가하고, 85 °C에서 16시간 동안 환류시킨다. 반응 완료 후, 그 다음 혼합물을 진공에서 농축시키고, 트리에틸아민으로 염기성화하고, DCM:MeOH(95:5 내지 80:20)를 사용한 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여 원하는 이미다졸(53-76% 수득률)을 얻는다.
- [1009] 일반적인 절차 J: 트리아졸의 형성
- [1010] 방법 A: 톨루엔(10 mL) 중의 벤즈아미드 용액에 N,N-디메틸포름아미드 디에틸아세탈을 첨가하고, 110 °C로 가열하고, 3시간 동안 환류시킨다. 그 다음 반응 혼합물을 냉각시키고, 진공에서 농축시킨다. 그 다음 이 잔류물을 AcOH(2 mL)에 용해시키고, 히드라진(THF 중의 1.0 M 용액)을 첨가하고, 용액을 100 °C로 가열하고, 이 온도에서 4시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 혼합물을 농축하고, 차가운 포화 중탄산나트륨 용액(25 mL)에 붓고, 에틸아세테이트(2 × 25 mL)로 추출한다. 조합된 유기 추출물을 물(25 mL) 및 염수(25 mL)로 세척하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 진공에서 농축시킨다. 그 다음 이 잔류물을 용리 시스템으로서 DCM:에틸 아세테이트(70:30 내지 50:50)를 사용한 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여, 원하는 트리아졸(58-66% 수득률)을 얻는다.

- [1011] 방법 B: EtOH(10 mL) 중의 아릴 에틸이미데이트 용액에 포름산 또는 아세트산 히드라이드를 첨가한다. 그 다음 반응 혼합물을 4시간 동안 환류시킨다. 혼합물을 진공에서 농축시키고, DCM:에틸 아세테이트(70:30 내지 40:60)를 사용한 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여 원하는 트리아졸(47-61% 수득률)을 얻는다.
- [1012] 일반적인 절차 K: 메틸 에스테르의 형성
- [1013] 얼음 수조를 사용하여 0 °C로 냉각된 벤조산의 메탄올 용액에 염화티오닐을 적가한다. 그 다음 반응 혼합물을 50 °C에서 5시간 동안 가열한다. 용매를 증발시키고, 에틸 아세테이트 및 포화 수성 중탄산나트륨을 첨가한다. 상을 분리시키고, 수상을 에틸 아세테이트로 2번 추출한다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다. 용매를 증발시켜, 순수 메틸 에스테르를 얻는다.
- [1014] 일반적인 절차 L: t-Boc기의 제거로 아릴아민 얻기
- [1015] DCM 중의 아릴아미노-tert-부틸 에스테르 용액(10 mL)을 실온에서 염산(3 당량, 및 디옥산 중의 4.0 N 용액)에 첨가하고 3시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 혼합물을 진공에서 농축시키고, 잔류물을 에테르(10 mL)로 세척하여 원하지 않는 유기 불순물을 제거하고, 그 다음 DCM:헥산(2:8)을 분쇄하여, 염산염으로서 원하는 아민(77-85% 수득률)을 얻는다.
- [1016] 일반적인 절차 M: 알킬술피드로부터 알킬술폰의 형성
- [1017] DCM 중의 알킬술피드 용액에 -10 °C에서 과아세트산(2 당량, 아세트산 중의 32 wt% 용액)을 첨가한다. 그 다음 반응 혼합물을 실온에서 2-6시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 혼합물을 포화 중탄산나트륨 용액(25 mL)에 붓고, DCM(25 mL)으로 추출하고, 황산나트륨으로 건조시키고, 진공에서 농축시킨다. 잔류물을 DCM:헥산(2:8)으로 분쇄하여, 원하는 술폰을 얻는다. 필요한 경우, 잔류물을 용리 시스템으로서 DCM:에틸 아세테이트(80:20 내지 60:40)를 사용하는 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여 원하는 술폰(88-96% 수득률)을 얻는다.
- [1018] 일반적인 절차 N: 커플링 시약으로서 DPPA를 사용한 아미드의 형성
- [1019] 건조 DMF 중의 카르복시산 용액에 DIEA 다음 DPPA를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 30분 동안 교반한다. 그 다음 아민을 첨가하고, 반응을 실온에서 2시간 동안 교반한다. 내용물을 얼음물로 희석하고, 생성물을 침전시킨다. 순수 생성물을 물 및 DCM/메탄올로 후속 세척하거나 또는 용리액으로서 헥산/에틸 아세테이트를 사용하는 실리카겔 크로마토그래피를 통해 여과 후 분리한다.
- [1020] 일반적인 절차 O: Fmoc의 탈보호
- [1021] 실온에서 아민의 플루오렌일메틸 카바메이트의 DMF 용액에 20%(v/v) 피페리딘을 첨가한다. 그 다음 반응 혼합물을 2시간 동안 교반한다. 반응 혼합물을 에틸 아세테이트 및 포화 수성 중탄산나트륨에 첨가한다. 상을 분리하고, 수상을 에틸 아세테이트로 2번 추출한다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 용리액으로서 DCM:메탄올을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제한다.
- [1022] 일반적인 절차 P: 환원 아민화
- [1023] 실온에서 아민의 DCM 용액에 알데히드 및 소듐 트리아세톡시보로히드라이드를 첨가한다. 그 다음 반응 혼합물을 2 - 8시간 동안 교반한다. 반응물을 DCM 및 포화 수성 중탄산나트륨에 첨가한다. 상을 분리하고, 수상을 DCM으로 2번 추출한다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 용리액으로서 DCM:메탄올을 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제한다.
- [1024] 일반적인 절차 Q: 술폰아미드의 형성
- [1025] 0 °C에서 아민의 DCM 용액에 트리에틸아민을 첨가하고, 바로 염화술폰을 적가한다. 그 다음 반응 혼합물을 0 °C에서 20분 동안, 그 다음 실온에서 30분 동안 교반한다. 반응물을 DCM 및 포화 수성 중탄산나트륨에 첨가한다. 상을 분리하고, 수상을 DCM으로 2번 추출한다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 용리액으로서 DCM:메탄올을 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제한다.
- [1026] 일반적인 절차 R: 아미드의 형성
- [1027] 0 °C에서 아민의 DCM 용액에 트리에틸아민을 첨가하고, 바로 염화아실을 적가한다. 그 다음 반응 혼합물을 0 °C에서 20분 동안, 그 다음 실온에서 30분 동안 교반한다. 반응물을 DCM 및 포화 수성 중탄산나트륨에 첨가한다. 상을 분리하고, 수상을 DCM으로 2번 추출한다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다.

용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 용리액으로서 DCM:메탄올을 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 분리한다.

[1028] 일반적인 절차 S: 알코올/아민의 알킬화

[1029] 실온에서 알코올/아민의 디옥산 또는 DMF 용액에 디벤질-(2-클로로-에틸)-아민 그 다음 50%(w/w) 수성 KOH 용액 또는 DIEA 및 브롬화테트라부틸암모늄의 촉매 양을 첨가한다. 반응 혼합물을 55 °C에서 8시간 동안 교반한다. 반응물을 포화 염화나트륨 용액에 첨가하고, 에틸 아세테이트로 추출한다. 상을 분리하고, 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과한다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 용리액으로서 헥산:에틸 아세테이트를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제한다.

[1030] 일반적인 절차 T: 아민의 탈벤질화

[1031] 실온에서 디벤질아민의 메탄올 용액에 Pd-C 20 wt%를 첨가한다. 반응 혼합물을 실온에서 12 - 24시간 동안 60 PSI의 수소 분위기로 대산화한다. 반응 혼합물을 셀라이트를 통해 여과하고, 메탄올로 세척한다. 여과액을 증발시켜, 순수 화합물을 분리한다.

[1032] 일반적인 절차 U: 할로젠화알킬의 아지드로의 전환

[1033] 건조 DMF 중의 브롬화알킬 용액에 나트륨 아지드를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 16시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 내용물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 물로 세척하고, 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축시킨다.

[1034] 일반적인 절차 V: 알코올의 토실레이트로의 전환

[1035] 피리딘 중의 알코올 용액에 DMAP를 첨가하고, 반응 혼합물을 0 °C로 냉각한다. *p*-톨루엔술포닐 클로라이드를 첨가하고, 반응 혼합물을 0 °C에서 3시간 동안 교반을 계속한다. 반응 완료 후, 내용물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 1 N HCl, 포화 수성 중탄산나트륨, 그 다음 물로 희석한다. 그 다음 그것을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축한다.

[1036] 일반적인 절차 W: 토실레이트 및 알코올의 반응

[1037] 톨루엔 중의 알코올 및 토실레이트 용액에 50% 수성 NaOH 용액 및 테트라부틸암모늄 수소 설페이트를 첨가한다. 반응 혼합물을 80 °C에서 3시간 동안 교반하고, 그 다음 50 °C에서 16시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 수성 염화암모늄 용액을 첨가하고, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 더 희석한다. 상을 분리하고, 수상을 에틸 아세테이트로 추출한다. 조합된 유기상을 무수 황산나트륨으로 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축한다.

[1038] 일반적인 절차 X: 알코올로 에폭시드 개환

[1039] 건조 DMF 중의 알코올 및 에폭시드 용액에 수산화칼륨을 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 16시간, 그 다음 60 °C에서 다른 24시간 동안 교반한다. 반응 완료 후, 내용물을 진공에서 농축한다. 순수 생성물을 실리카겔 크로마토그래피를 통해 분리한다.

[1040] 실시예 1:

[1041] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1042] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산(825 mg)은 THF 중의 4-플루오로-3-니트로-벤조산(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 8.1 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1043] N-메틸-4-메틸아미노-3-니트로-벤즈아미드(375 mg)의 합성은 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산(500 mg), HBTU(1.45 g), DIEA(0.89 mL), 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 8.1 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. 정제는 용리액으로서 헥산/에틸 아세테이트를 사용한 실리카겔 크로마토그래피를 사용하여 수행하였다.

[1044] 3-아미노-N-메틸-4-메틸아미노-벤즈아미드(460 mg)는 N-메틸-4-메틸아미노-3-니트로-벤즈아미드(535 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 54 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1045] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(74 mg)는

3-아미노-N-메틸-4-메틸아미노-벤즈아미드(460 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(499 mg), 1,1'-티오카보닐-디이미다졸(454 mg), 및 EDC(611 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 423.0. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.42(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.75(d, 2H), 7.50(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.68(bs, 3H), 2.81(d, 3H).

[1046] 실시예 2:

[1047] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1048] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1049] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 82 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1050] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.47 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(1.5 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(1.62 g), 1,1'-티오카보닐-디이미다졸(1.48 g), 및 EDC(1.99 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 423.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.20(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.85(bs, 1H), 7.78-7.63(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.35(d, 2H), 3.86(s, 3H), 3.63(bs, 3H).

[1051] 실시예 3:

[1052] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1053] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(185 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(200 mg) 및 수산 화리튬(80 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 409.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.16(s, 1H), 7.95(s, 1H), 7.86(d, 1H), 7.78-7.61(m, 2H), 7.51(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.67(s, 3H), -COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1054] 실시예 4:

[1055] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

[1056] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(27 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 2-에톡시에틸아민(20 mg), DPPA(61 mg), 및 DIEA(28 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 481.0. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.47(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.76(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.47(d, 1H), 7.35(s, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.54-3.37(m, 6H), 1.11(t, 3H).

[1057] 실시예 5:

[1058] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 시클로프로필메틸-아미드

[1059] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 시클로프로필메틸-아미드(24 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 시클로프로판-메틸아민(16 mg), DPPA(48 uL), 및 DIEA(39 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 462.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.16(bs, 1H), 8.30(s, 1H), 7.87(s, 1H), 7.68(s, 1H), 7.55(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.26(d, 1H), 7.12(d, 1H), 3.40(bs, 3H), 2.94(t, 2H), 0.89-0.78(m, 1H), 0.21(d, 2H), 0.02(d, 2H).

- [1060] 실시예 6:
- [1061] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1062] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(17 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 123 μ L), DPPA(53 μ L), 및 DIEA(43 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: 436.9 m/z(M+1)⁺. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.43(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.79-7.65(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.35(s, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.30-3.23(m, 2H), 1.13(t, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1063] 실시예 7:
- [1064] [1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-피롤리딘-1-일-메탄온
- [1065] [1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-피롤리딘-1-일-메탄온(34 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 피롤리딘(17 mg), DPPA(53 μ L), 및 DIEA(43 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 462.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.28(bs, 1H), 7.90(s, 1H), 7.80-7.56(m, 2H), 7.42(s, 2H), 7.33(d, 1H), 3.63(s, 3H), 3.55-3.33(m, 4H), 1.95-1.74(m, 4H).
- [1066] 실시예 8:
- [1067] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1068] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(22 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-메톡시-에틸아민(18 mg), DPPA(53 μ L), 및 DIEA(43 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.36(bs, 1H), 8.47(s, 1H), 8.08(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.76(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.47(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.53-3.38(m, 4H), 3.27(s, 3H).
- [1069] 실시예 9:
- [1070] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드
- [1071] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드(31 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-플루오로에틸아민 염산염(24 mg), DPPA(53 μ L), 및 DIEA(43 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 454.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.67(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.61(t, 1H), 4.49(t, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.58-3.48(m, 2H).
- [1072] 실시예 10:
- [1073] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드
- [1074] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드(27 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 에탄올아민(15 mg), DPPA(53 μ L), 및 DIEA(43 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 452.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.37(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.81-7.56(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.72(s, 1H), 3.64(s, 3H), 3.58-3.48(m, 2H), 3.40-3.32(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1075] 실시예 11:

- [1076] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-피라졸-1-일-프로필)-아미드
- [1077] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-피라졸-1-일-프로필)-아미드(99 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 3-(1H-피라졸-1-일)프로판-1-아민 이염산염(50 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 517.0. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.36(bs, 1H), 8.48(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.81-7.63(m, 3H), 7.47(d, 1H), 7.43(d, 1H), 7.35(d, 1H), 6.22(t, 1H), 4.18(t, 2H), 3.62(bs, 3H), 3.26(q, 2H), 2.09-1.97(m, 2H).
- [1078] 실시예 12:
- [1079] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 프로필아미드
- [1080] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 프로필아미드(86 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 프로필아민 (16 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 450.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.42(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.75(d, 1H), 7.72(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.22(q, 2H), 1.60-1.45(m, 2H), 0.90(t, 3H).
- [1081] 실시예 13:
- [1082] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-프로필)-아미드
- [1083] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-프로필)-아미드(98 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 3-아미노-1-프로판올(20 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.39(s, 1H), 8.05(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.78-7.60(m, 2H), 7.45(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.48(s, 1H), 3.63(bs, 3H), 3.48(q, 2H), 3.38-3.30(m, 2H), 1.76-1.64(m, 2H).
- [1084] 실시예 14:
- [1085] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-에톡시-프로필)-아미드
- [1086] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-에톡시-프로필)-아미드(97 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 3-에톡시-프로필아민(28 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.36(bs, 1H), 8.41(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.78-7.64(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.45-3.37(m, 4H), 3.36-3.31(m, 2H), 1.83-1.70(m, 2H), 1.10(t, 3H).
- [1087] 실시예 15:
- [1088] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 모르폴린-4-일아미드
- [1089] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 모르폴린-4-일아미드 (100 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 4-아미노모르폴린(28 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 9.49(s, 1H), 8.02(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.78-7.59(m, 2H), 7.47(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.78-3.56(m, 7H), 2.93-2.84(m, 4H).
- [1090] 실시예 16:

- [1091] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2,2,2-트리플루오로-에틸)-아미드
- [1092] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2,2,2-트리플루오로-에틸)-아미드(102 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2,2,2-트리플루오로에틸아민(27 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 490.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 9.05(s, 1H), 8.12(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.81(d, 1H), 7.72(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.18-4.01(m, 2H), 3.62(bs, 3H).
- [1093] 실시예 17:
- [1094] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (테트라히드로-피란-4-일메틸)-아미드
- [1095] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (테트라히드로-피란-4-일메틸)-아미드(91 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 4-아미노-메틸테트라히드로피란 염산염(41 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 507.0. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.47(s, 1H), 8.08(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.77(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.48(d, 1H), 7.35(d, 1H), 3.86(d, 2H), 3.63(bs, 3H), 3.28(t, 2H), 3.18(t, 2H), 1.91-1.62(m, 1H), 3.28(d, 2H), 1.30-1.14(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1096] 실시예 18:
- [1097] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (테트라히드로-푸란-2-일메틸)-아미드
- [1098] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (테트라히드로-푸란-2-일메틸)-아미드(73 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 테트라히드로푸르푸릴아민(27 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 492.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.47(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.77(d, 1H), 7.72(d, 1H), 7.47(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.03-3.94(m, 1H), 3.78(q, 1H), 3.74-3.57(m, 5H), 3.38-3.31(m, 1H), 2.00-1.73(m, 3H), 1.68-1.53(m, 1H).
- [1099] 실시예 19:
- [1100] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메톡시-프로필)-아미드
- [1101] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메톡시-프로필)-아미드(91 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 3-메톡시-프로필아민(24 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.42(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.78-7.63(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.38(t, 2H), 3.34-3.27(m, 2H), 3.24(s, 3H), 1.82-1.71(m, 2H).
- [1102] 실시예 20:
- [1103] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-1-메틸-에틸)-아미드
- [1104] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-1-메틸-에틸)-아미드(86 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 1-메톡시-2-프로필아민(24 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는

일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.18(s, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.76(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.30-4.15(m, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.42(dd, 1H), 3.29(dd, 1H), 3.27(s, 3H), 1.14(d, 3H).

[1105] 실시예 21:

[1106] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드

[1107] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드(67 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 1-아미노-2-프로판올(20 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.35(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.86-7.66(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.77(d, 1H), 3.87-3.77(m, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.29-3.17(m, 2H), 1.09(d, 3H).

[1108] 실시예 22:

[1109] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드

[1110] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드(68 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-메톡시-2-메틸-프로필아민(58 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.17(t, 1H), 8.08(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.36(d, 2H), 3.18(s, 3H), 1.14(d, 6H).

[1111] 실시예 23:

[1112] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1113] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(765 mg)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(991 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메틸)벤조티아졸(1.0 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.09 g), 및 EDC(1.32 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 407.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.15(s, 1H), 7.97(d, 1H), 7.95(d, 1H), 7.85(d, 1H), 7.62-7.43(m, 2H), 3.86(s, 3H), 3.62(bs, 3H).

[1114] 실시예 24:

[1115] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1116] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(434 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(765 mg) 및 수산화 리튬(316 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 393.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.77(bs, 1H), 12.49(bs, 1H), 8.34-8.14(m, 2H), 7.93-7.73(m, 2H), 7.67(d, 1H), 7.52(d, 1H), 3.64(bs, 3H).

[1117] 실시예 25:

[1118] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1119] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(78 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-메톡시-에틸아민(21 mg), HBTU(116 mg), 및 DIEA(67 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 450.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.45(bs, 1H), 8.47(s, 1H), 8.24(s, 1H), 8.09(s, 1H),

7.78(s, 2H), 7.67(d, 1H), 7.48(d, 1H), 3.66(bs, 3H), 3.51-3.39(m, 4H), 3.27(s, 3H).

[1120] 실시예 26:

[1121] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드

[1122] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(77 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 254 μ L), HBTU(116 mg), 및 DIEA(67 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 421.0. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.46(bs, 1H), 8.42(s, 1H), 8.24(s, 1H), 8.08(s, 1H), 7.74(s, 2H), 7.64(d, 1H), 7.48(d, 1H), 3.66(bs, 3H), 3.30(q, 2H), 1.13(t, 3H).

[1123] 실시예 27:

[1124] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드

[1125] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드(91 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 에탄올아민(17 mg), HBTU(116 mg), 및 DIEA(67 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 436.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.46(bs, 1H), 8.38(s, 1H), 8.24(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.77(s, 2H), 7.67(d, 1H), 7.48(d, 1H), 4.72(t, 1H), 3.65(bs, 3H), 3.52(q, 2H), 3.34(q, 2H).

[1126] 실시예 28:

[1127] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1128] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(842 mg)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(650 mg), 2-아미노-6-클로로-벤조티아졸(556 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(715 mg), 및 EDC(865 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 373.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.19(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.64(s, 1H), 7.50(d, 1H), 7.38(d, 1H), 3.86(s, 3H), 3.62(bs, 3H).

[1129] 실시예 29:

[1130] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1131] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(250 mg)은 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(842 mg) 및 수산화리튬(379 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 359.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.12(s, 1H), 7.92(d, 1H), 7.83(d, 1H), 7.55(s, 1H), 7.48(d, 1H), 7.38(dd, 1H), 3.65(s, 3H), -COOH 및 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1132] 실시예 30:

[1133] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드

[1134] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드(9 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 에탄올아민(17 mg), HBTU(114 mg), 및 DIEA(66 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 402.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.35(bs, 1H), 8.36(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.74(s, 1H), 7.63(s, 1H), 7.45(d, 1H), 7.37(dd, 1H), 4.72(t, 1H), 3.63(bs, 3H), 3.52(q, 2H), 3.34(q, 2H).

[1135] 실시예 31:

[1136] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1137] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(51 mg)는

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 2-메톡시에틸아민(21 mg), HBTU(114 mg), 및 DIEA(66 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 416.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.36(bs, 1H), 8.46(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.75(s, 1H), 7.64(s, 1H), 7.46(d, 1H), 7.38(dd, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.50-3.39(m, 4H), 3.27(s, 3H).

실시예 32:

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드

2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(64 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 251 μ L), HBTU(114 mg), 및 DIEA(66 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 386.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.40(s, 1H), 8.05(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.72(d, 1H), 7.57(bs, 1H), 7.44(d, 1H), 7.37(dd, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.30(q, 2H), 1.13(t, 3H).

실시예 33:

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(579 mg)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(650 mg), 2-아미노-5,6-디플루오로벤조티아졸(560 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(715 mg), 및 EDC(865 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 375.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.51(bs, 1H), 8.25(s, 1H), 8.19(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.68(d, 1H), 7.52(d, 1H), 3.86(s, 3H), 3.67(bs, 3H).

실시예 34:

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(265 mg)은 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(579 mg) 및 수산화리튬(260 mg) 으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 361.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.75(bs, 1H), 12.35(bs, 1H), 8.15(s, 1H), 7.96(t, 1H), 7.85(d, 1H), 7.57(s, 1H), 7.48(d, 1H), 3.62(bs, 3H).

실시예 35:

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(55 mg)는 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 250 μ L), HBTU(114 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 388.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.34(bs, 1H), 8.42(s, 1H), 8.04(s, 1H), 7.95(dd, 1H), 7.74(d, 1H), 7.55(s, 1H), 7.45(d, 1H), 3.62(s, 3H), 3.30(q, 2H), 1.13(t, 3H).

실시예 36:

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드

2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드(71 mg)는 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 에탄올아민(17 mg), HBTU(114 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 404.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.34(bs, 1H), 8.38(s, 1H), 8.05(s, 1H), 7.95(t, 1H), 7.76(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.46(d, 1H), 4.72(t, 1H), 3.62(bs, 3H), 3.52(q, 2H), 3.34(q, 2H).

실시예 37:

- [1154] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1155] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(60 mg)는 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(90 mg), 2-메톡시에틸아민(21 mg), HBTU(114 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 418.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.34(bs, 1H), 8.48(t, 1H), 8.05(s, 1H), 7.95(dd, 1H), 7.77(d 1H), 7.58(dd, 1H), 7.47(d, 1H), 3.61(bs, 3H), 3.50-3.39(m, 4H), 3.27(s, 3H).
- [1156] 실시예 38:
- [1157] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1158] 3-메틸아미노-4-니트로-벤조산(1.1 g)은 THF 중의 3-클로로-4-니트로-벤조산(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 8.1 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1159] N-메틸-3-메틸아미노-4-니트로-벤즈아미드(407 mg)는 3-메틸아미노-4-니트로-벤조산(500 mg), DPPA(550 μ L), DIEA(445 μ L), 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 2.55 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 N에 따라 제조하였다.
- [1160] 4-아미노-N-메틸-3-메틸아미노-벤즈아미드(298 mg, 86%)는 N-메틸-3-메틸아미노-4-니트로-벤즈아미드(407 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 40 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 다음 단계에서 바로 사용하였다.
- [1161] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(11 mg)는 4-아미노-N-메틸-3-메틸아미노-벤즈아미드(298 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(303 mg), 1,1'-티오카보닐-디아미다졸(329 mg), 및 EDC(398 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 422.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.39(s, 1H), 8.01(s, 1H), 7.88(s, 1H), 7.69(s, 1H), 7.54(d, 1H), 7.45(s, 1H), 7.33(d, 1H), 6.73(d, 1H), 3.63(bs, 3H), 3.46(s, 3H).
- [1162] 실시예 39:
- [1163] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1164] 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산(750 mg)은 THF 중의 2,4-디플루오로-5-니트로-벤조산(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 2.46 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.
- [1165] 2-플루오로-N-(2-메톡시-에틸)-4-메틸아미노-5-니트로-벤즈아미드는 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산(75 mg), HBTU(159 mg), DIEA(92 μ L), 및 2-메톡시에틸아민(26 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 바로 다음 단계에서 사용하였다.
- [1166] 5-아미노-2-플루오로-N-(2-메톡시-에틸)-4-메틸아미노-벤즈아미드(72 mg)는 2-플루오로-N-(2-메톡시-에틸)-4-메틸아미노-5-니트로-벤즈아미드 및 Pd/C(10 wt%, 10 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1167] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(41 mg)는 5-아미노-2-플루오로-N-(2-메톡시-에틸)-4-메틸아미노-벤즈아미드(72 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(59 mg), 1,1'-티오카보닐디아미다졸(64 mg), 및 EDC(77 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 484.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.35(bs, 1H), 8.16(s, 1H), 7.91(d, 1H), 7.88(s, 1H), 7.73(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.61(bs, 3H), 3.51-3.40(m, 4H), 3.30(s, 3H).
- [1168] 실시예 40:
- [1169] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1170] 2,4-디플루오로-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(440 mg)는 2,4-디플루오로-5-니트로-벤조산(500 mg) 및 염화티

오닐(233 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 K에 따라 제조하였다.

[1171] 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산(375 mg)은 DMF 중의 2,4-디플루오로-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(440 mg) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 1.01 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.

[1172] 5-아미노-2-플루오로-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(115 mg)는 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(150 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 15 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1173] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(140 mg)는 5-아미노-2-플루오로-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(115 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(115 mg), 1,1'-티오카보닐디아미다졸(126 mg), 및 EDC(153 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 441.8.

[1174] 실시예 41:

[1175] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1176] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(121 mg)은 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(140 mg) 및 수산화리튬(53 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 427.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.01(d, 1H), 7.95(s, 1H), 7.61(d, 1H), 7.48(d, 1H), 7.38(d, 1H), 3.65(s, 3H), -COOH 및 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1177] 실시예 42:

[1178] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드

[1179] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(65 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 235 μ L), HBTU(107 mg), 및 DIEA(62 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 454.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.34(bs, 1H), 8.17(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.73(s, 1H), 7.48(s, 1H), 7.36(d, 1H), 3.61(bs, 3H), 3.33-3.21(m, 2H), 1.14(t, 3H).

[1180] 실시예 43:

[1181] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드

[1182] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드(92 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 4-(2-아미노-에틸)모르폴린(36 μ L), HBTU(112 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 521.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.11(s, 1H), 7.95(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.52(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.85-3.48(m, 7H), 2.89(s, 2H), 2.73(s, 2H), 2.51-2.48(m, 4H).

[1183] 실시예 44:

[1184] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-트리플루오로메톡시-에틸)-아미드

[1185] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-트리플루오로메톡시-에틸)-아미드(87 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-(트리플루오로메톡시)에틸아민 염산염(45 mg), HBTU(112 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 520.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.41(bs, 1H), 8.72(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.23(t, 2H), 3.81-3.55(m, 5H).

- [1186] 실시예 45:
- [1187] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-2-메틸-프로필)-아미드
- [1188] 1-아미노-2-메틸-프로판-2-올(244 mg)은 아세톤 시아노히드린(3.34 g) 및 수소화알루미늄하이드라이드(3.13 g)으로부터 시작하는 일반적인 절차 G에 따라 제조하였다.
- [1189] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-2-메틸-프로필)-아미드(97 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 1-아미노-2-메틸-프로판-2-올(24 mg), HBTU(112 mg), 및 DIEA(65 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.18(t, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.60(s, 1H), 3.64(s, 3H), 3.29(d, 2H), 1.14(s, 6H).
- [1190] 실시예 46:
- [1191] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드
- [1192] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(220 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(250 mg), 2-(2-아미노에톡시)에탄올(71 mg), HBTU(279 mg), 및 DIEA(160 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 496.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.47(t, 1H), 8.09(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.61(t, 1H), 3.64(s, 3H), 3.57(t, 2H), 3.51(t, 2H), 3.49-3.41(m, 4H).
- [1193] 실시예 47:
- [1194] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에틸]-아미드
- [1195] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에톡시)-에틸]-아미드(53 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(50 mg) 및 삼불화비스(2-메톡시에틸)아미노황(47 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 H에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 498.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.51(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.86-7.62(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.63-4.46(m, 1H), 3.80-3.69(m, 2H), 3.68-3.52(m, 6H), 3.46(q, 2H).
- [1196] 실시예 48:
- [1197] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (푸란-2-일메틸)-아미드
- [1198] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (푸란-2-일메틸)-아미드(108 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 푸르푸릴아민(26 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 489.0. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.92(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.71(d, 1H), 7.57(s, 1H), 7.47(d, 1H), 7.34(d, 1H), 6.39(dd, 1H), 6.27(d, 1H), 4.48(d, 2H), 3.62(s, 3H).
- [1199] 실시예 49:
- [1200] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ([1,4]디옥산-2-일메틸)-아미드
- [1201] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

([1,4]디옥산-2-일메틸)-아미드(88 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), c-[1,4]디옥산-2-일-메틸아민(32 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 508.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.52(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.87-7.61(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.85-3.21(m, 12H).

[1202] 실시예 50:

[1203] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드

[1204] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-2-히드록시-프로필)-아미드(70 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일-아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), (S)-(+)-1-아미노-2-프로판올(20 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.77(d, 1H), 3.87-3.78(m, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.27-3.20(m, 2H), 1.09(d, 3H).

[1205] 실시예 51:

[1206] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드

[1207] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드(78 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일-아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), (R)-(-)-1-아미노-2-프로판올(20 mg), HBTU(111 mg), 및 DIEA(64 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(s, 1H), 8.36(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.86-7.65(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.77(d, 1H), 3.89-3.77(m, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.26-3.19(m, 2H), 1.09(d, 3H).

[1208] 실시예 52:

[1209] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실)-아미드

[1210] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실)-아미드(42 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 트랜스-4-아미노-시클로헥산올(23 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 506.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.40(s, 1H), 8.17(s, 1H), 8.08(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.82-7.64(m, 2H), 7.47(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.57(d, 1H), 3.81-3.68(m, 1H), 3.64(bs, 3H), 3.46-3.35(m, 1H), 1.92-1.78(m, 4H), 1.39(q, 2H), 1.26(q, 2H).

[1211] 실시예 53:

[1212] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(테트라히드로-푸란-2-일메톡시)-에틸]-아미드

[1213] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(테트라히드로-푸란-2-일메톡시)-에틸]-아미드(21 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-(테트라히드로-푸란-2-일메톡시)-에틸아민(29 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 536.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(s, 1H), 8.46(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.83-7.65(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.98-3.90(m, 1H), 3.79-3.68(m, 2H), 3.64(bs, 3H), 3.61-3.52(m, 2H), 3.49-3.38(m, 5H), 1.94-1.68(m, 2H), 1.60-1.47(m, 1H).

[1214] 실시예 54:

- [1215] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-프로필)-아미드
- [1216] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-프로필)-아미드(31 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-에톡시-프로필아민(21 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.39(s, 1H), 8.43(s, 1H), 8.08(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.83-7.66(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.79-3.43(m, 5H), 3.41-3.30(m, 2H), 3.29-3.18(m, 1H), 1.14-1.08(m, 6H).
- [1217] 실시예 55:
- [1218] 2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-모르폴린-4-카르복시산 tert-부틸 에스테르
- [1219] 2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-모르폴린-4-카르복시산 tert-부틸 에스테르(76 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-아미노메틸)-모르폴린-4-카르복시산 tert-부틸 에스테르(44 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 607.9. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.41(s, 1H), 8.59(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.85-7.63(m, 2H), 7.50(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.95-3.78(m, 2H), 3.76-3.58(m, 5H), 3.56-3.45(m, 1H), 3.44-3.35(m, 4H), 1.22(s, 9H).
- [1220] 실시예 56:
- [1221] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (모르폴린-2-일메틸)-아미드 염산염
- [1222] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (모르폴린-2-일메틸)-아미드 이염산염(57 mg)은 2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-모르폴린-4-카르복시산 tert-부틸 에스테르(63 mg) 및 HCl(디옥산 중의 4 M, 260 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 507.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.37(bs, 2H), 8.68(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.95(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.64(d, 1H), 7.52(d, 1H), 7.38(d, 1H), 4.04-3.86(m, 2H), 3.76(t, 1H), 3.69(s, 3H), 3.52-3.31(m, 2H), 3.28(d, 1H), 3.18(d, 1H), 3.06-2.90(m, 1H), 2.80(q, 1H).
- [1223] 실시예 57:
- [1224] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1225] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(52 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-에톡시에틸아민(17 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(46 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 498.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.35(bs, 1H), 8.14(d, 1H), 7.92(s, 1H), 7.89(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.37(s, 1H), 3.60(bs, 3H), 3.56-3.41(m, 6H), 1.14(t, 3H).
- [1226] 실시예 58:
- [1227] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
- [1228] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(32 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 글리신 디메틸아미드아세테이트(32 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(46 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 511.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.19-

8.00(m, 2H), 7.93(s, 1H), 7.74(d, 1H), 7.54(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.18(d, 2H), 3.61(bs, 3H), 3.01(s, 3H), 2.89(s, 3H).

[1229] 실시예 59:

[1230] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드

[1231] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드(21 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 4-(2-아미노에틸)모르폴린(25 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(46 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 539.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 9.54(s, 1H), 8.41(s, 1H), 7.95(s, 1H), 7.74(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.36(d, 1H), 4.01(d, 2H), 3.80-3.51(m, 7H), 3.25-3.09(m, 2H), 2.53-2.49(m, 4H).

[1232] 실시예 60:

[1233] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드

[1234] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드(52 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 1-아미노-2-프로판올(15 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(46 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 484.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.93(bs, 1H), 12.35(bs, 1H), 8.02(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.73(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.79(s, 1H), 3.86-3.75(m, 1H), 3.61(bs, 3H), 3.29-3.17(m, 2H), 1.10(d, 3H).

[1235] 실시예 61:

[1236] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1237] 2-메톡시-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(120 mg)는 DMF 중의 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(200 mg) 및 나트륨 메톡사이드(190 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.

[1238] 5-아미노-2-메톡시-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(95 mg)는 2-메톡시-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(120 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 12 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1239] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(80 mg)는 5-아미노-2-메톡시-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(95 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(82 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(90 mg), 및 EDC(108 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 453.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.24(s, 1H), 7.97(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.36(d, 1H), 7.24(s, 1H), 3.90(s, 3H), 3.80(s, 3H), 3.64(s, 3H).

[1240] 실시예 62:

[1241] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1242] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(60 mg)은 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(80 mg) 및 수산화리튬(30 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 439.8.

[1243] 실시예 63:

[1244] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

- [1245] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모 일메틸-아미드(37 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(60 mg), 글리신 디메틸아미드아세테이트(25 mg), HBTU(63 mg), 및 DIEA(36 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 523.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.29(bs, 1H), 8.84(t, 1H), 8.26(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.72(d, 1H), 7.35(d, 1H), 7.30(s, 1H), 4.21(d, 2H), 4.04(s, 3H), 3.65(s, 3H), 3.00(s, 3H), 2.91(s, 3H).
- [1246] 실시예 64:
- [1247] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1248] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드 (37 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (75 mg), 에틸아민(THF 중의 2 M, 171 μ L), HBTU(78 mg), 및 DIEA(45 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.25(s, 1H), 8.22(t, 1H), 8.10(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.34(d, 1H), 7.24(s, 1H), 3.98(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.39-3.30(m, 2H), 1.14(t, 3H).
- [1249] 실시예 65:
- [1250] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1251] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(72 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-에톡시에틸아민(17 mg), HBTU(78 mg), 및 DIEA(45 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 510.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.27(s, 1H), 8.34(t, 1H), 8.16(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.35(d, 1H), 7.26(s, 1H), 4.0(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.56-3.43(m, 6H), 1.16(t, 3H).
- [1252] 실시예 66:
- [1253] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드
- [1254] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드(69 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로-메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 4-(2-아미노에틸)모르폴린(25 mg), HBTU(78 mg), 및 DIEA(45 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 551.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.27(bs, 1H), 8.50(bs, 1H), 8.18(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.35(d, 1H), 7.28(s, 1H), 4.02(s, 3H), 3.76-3.55(m, 7H), 3.38-3.27(m, 4H), 2.52-2.49(m, 4H).
- [1255] 실시예 67:
- [1256] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1257] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(55 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로-메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-메톡시-에틸아민(14 mg), HBTU(78 mg), 및 DIEA(45 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 496.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.26(s, 1H), 8.32(s, 1H), 8.15(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.34(s, 1H), 7.26(s, 1H), 4.00(s, 3H), 3.64(s, 3H), 3.51-3.47(m, 4H), 3.31(s, 3H).
- [1258] 실시예 68:

- [1259] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드
- [1260] 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드(56 mg)는 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 1-아미노-2-프로판올(14 mg), HBTU(78 mg), 및 DIEA(45 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 496.6. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.27(s, 1H), 8.32(t, 1H), 8.16(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(d, 1H), 7.35(d, 1H), 7.26(s, 1H), 4.85(d, 1H), 4.00(s, 3H), 3.85-3.76(m, 1H), 3.64(s, 3H), 3.43-3.34(m, 1H), 3.24-3.14(m, 1H), 1.10(d, 3H).
- [1261] 실시예 69:
- [1262] 6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1263] 2-디에틸아미노-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1.2 g)는 DMF 중의 2-플루오로-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1.0 g) 및 디에틸아민(683 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.
- [1264] 5-아미노-2-디에틸아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(1.015 g)는 2-디에틸아미노-4-메틸아미노-5-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1.2 g) 및 Pd/C(10 wt%, 120 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1265] 6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.26 g)는 5-아미노-2-디에틸아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(1.015 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(656 mg), 1,1'-티오카보닐다이이미다졸(714 mg), 및 EDC(865 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.21(bs, 1H), 7.90(s, 1H), 7.80-7.56(m, 2H), 7.34(d, 1H), 7.25(s, 1H), 3.81(s, 3H), 3.62(s, 3H), 3.13-2.97(m, 4H), 0.96(t, 6H).
- [1266] 실시예 70:
- [1267] 6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
- [1268] 6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(175 mg)은 6-디에틸아미노-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(300 mg) 및 수산화리튬(102 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.45(bs, 1H), 8.25(bs, 1H), 7.96(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.80-7.62(m, 1H), 7.38(d, 1H), 3.68(s, 3H), 3.41-3.25(m, 4H), 0.94(t, 6H), -COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1269] 실시예 71:
- [1270] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 에틸 에스테르
- [1271] 6-메틸아미노-5-니트로-니코틴산 에틸 에스테르(911 mg)는 DMF 중의 6-클로로-5-니트로-니코틴산 에틸 에스테르(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 3.25 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.
- [1272] 5-아미노-6-메틸아미노-니코틴산 에틸 에스테르(723 mg)는 6-메틸아미노-5-니트로-니코틴산 에틸 에스테르(911 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 90 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1273] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 에틸 에스테르(560 mg)는 5-아미노-6-메틸아미노-니코틴산 에틸 에스테르(723 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(735 mg), 1,1'-티오카보닐다이이미다졸(802 mg), 및 EDC(969 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제

조하였다. LC/MS: m/z 437.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.44(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.74(s, 1H), 7.52(d, 1H), 7.37(d, 1H), 4.33(q, 2H), 3.65(s, 3H), 1.36(t, 3H).

[1274] 실시예 72:

[1275] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산

[1276] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(58 mg, 62%)은 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 에틸 에스테르(100 mg) 및 수산화리튬(38 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 409.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 13.00(s, 1H), 8.16(s, 1H), 7.95(d, 1H), 7.86(dd, 1H), 7.65(d, 1H), 7.52(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.68(s, 3H).

[1277] 실시예 73:

[1278] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1279] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(38 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(58 mg), 2-메톡시에틸아민(12 mg), HBTU(65 mg), 및 DIEA(37 μL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.49(t, 1H), 8.09(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.64(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.67(s, 3H), 3.54-3.40(m, 4H), 3.29(s, 3H).

[1280] 실시예 74:

[1281] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1282] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(25 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(48 mg), 글리신 디메틸아미드아세테이트(21 mg), HBTU(53 mg), 및 DIEA(31 μL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.46(t, 1H), 8.12(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.81(s, 1H), 7.73(s, 1H), 7.51(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.13(d, 2H), 3.65(bs, 3H), 3.03(s, 3H), 2.87(s, 3H).

[1283] 실시예 75:

[1284] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

[1285] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(52 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(75 mg), 2-에톡시에틸아민(18 mg), HBTU(83 mg), 및 DIEA(48 μL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.41(bs, 1H), 8.47(t, 1H), 8.09(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.76(d, 1H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.66(s, 3H), 3.56-3.39(m, 6H), 1.13(t, 3H).

[1286] 실시예 76:

[1287] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 에틸아미드

[1288] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 에틸아미드(58 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(75 mg), 2-에틸아민(THF 중의 2 M, 183 μL), HBTU(83 mg), 및 DIEA(48 μL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 436.6. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.44(s, 1H), 8.09(s, 1H),

7.92(s, 1H), 7.81-7.65(m, 1H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.64(s, 3H), 3.40-3.23(m, 2H), 1.15(t, 3H).

[1289] 실시예 77:

[1290] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드

[1291] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드(28 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(75 mg), 4-(2-아미노에틸)모르폴린(26 mg), HBTU(83 mg), 및 DIEA(48 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.39(bs, 1H), 8.48(bs, 1H), 8.09(s, 1H), 7.94(d, 1H), 7.81-7.66(m, 1H), 7.51(d, 1H), 7.35(d, 1H), 3.83-3.23(m, 11H), 2.51-2.48(m, 4H).

[1292] 실시예 78:

[1293] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드

[1294] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산 (2-히드록시-프로필)-아미드(56 mg)는 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-이미다조[4,5-b]피리딘-6-카르복시산(75 mg), 1-아미노-2-프로판올(15 mg), HBTU(83 mg), 및 DIEA(48 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.36(s, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.77(d, 1H), 3.89-3.77(m, 1H), 3.64(s, 3H), 3.27-3.16(m, 2H), 1.10(d, 3H).

[1295] 실시예 79:

[1296] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르

[1297] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(36 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 글리신 메틸 에스테르(27 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 481. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.85(br, 1H), 8.08(s, 1H), 7.91(m, 2H), 7.81-7.70(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.35(d, 1H), 4.03(d, 2H), 3.65(s, 3H), 및 3.62(s, 3H).

[1298] 실시예 80:

[1299] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1300] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(41 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(0.33 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.42(t, 1H), 8.09(s, 1H), 7.90(m, 1H), 7.78(br, 1H), 7.72(br, 1H), 7.48(d, 1H), 7.44(d, 1H), 7.34(m, 1H), 4.11(d, 2H), 3.63(s, 3H), 및 3.00(d, 6H).

[1301] 실시예 81:

[1302] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-에틸카바모일-에틸)-아미드

[1303] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-에틸카바모일-에틸)-아미드(37 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), (S)-2-아미노-N-에틸-프로피온아미드(0.37 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인

절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 508. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.38(d, 1H), 8.13(s, 1H), 7.92(s, 2H), 7.86(br, 1H), 7.73(br, 1H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.46(p, 1H), 3.66(s, 3H), 3.12-3.09(m, 2H), 1.34(d, 3H), 및 1.04(t, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1304] 실시예 82:

[1305] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸아미노-에틸)-아미드

[1306] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸아미노-에틸)-아미드(42 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), N,N-디메틸-에틸렌디아민(0.29 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.16(t, 1H), 7.81(s, 1H), 7.61(d, 1H), 7.49(d, 1H), 7.29(d, 1H), 7.15(d, 1H), 7.07(d, 1H), 3.56(s, 3H), 3.32(m, 2H), 2.85(m, 2H), 2.41(t, 1H), 2.17(s, 6H).

[1307] 실시예 83:

[1308] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산

[1309] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(211 mg)은 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(240 mg), 및 LiOH(1.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 467.

[1310] 실시예 84:

[1311] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1312] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(29 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(39 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 407; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.52(d, 1H), 7.93(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.70(d, 1H), 7.54(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.22-7.16(m, 2H), 3.57(s, 3H), 및 2.87(d, 3H).

[1313] 실시예 85:

[1314] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

[1315] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(36 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(39 mg), 2-에톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 465; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.40(t, 1H), 7.99(s, 1H), 7.82(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.44(br, 2H), 7.36(d, 1H), 7.30(dd, 1H), 3.61(s, 3H), 3.46(q, 2H), 3.41(t, 2H), 2.82(m, 2H), 및 1.07(t, 3H).

[1316] 실시예 86:

[1317] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1318] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(26 mg)는 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(36 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 375; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.30(d, 1H), 8.04(s, 1H), 7.93(d, 1H), 7.60(d, 1H), 7.49(m, 2H), 7.29(d, 1H), 3.62(s, 3H), 및 2.80(d, 3H).

[1319] 실시예 87:

- [1320] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1321] 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(31 mg)는 2-(5,6-디플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(36 mg), 2-에톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 433; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.46(m, 1H), 8.21(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.76(m, 1H), 7.65(d, 1H), 7.48(m, 2H), 3.66(s, 3H), 3.47(t, 2H), 2.88(m, 4H), 및 1.09(t, 3H).
- [1322] 실시예 88:
- [1323] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1324] 1-메틸-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(30 mg)는 1-메틸-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(36 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 373; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 9.63(d, 1H), 8.24(d, 1H), 7.84(m, 1H), 7.71(t, 1H) 7.52(d, 1H), 7.22(m 2H), 5.24(m, 1H), 3.65(s, 3H), 및 2.81(d, 3H).
- [1325] 실시예 89:
- [1326] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1327] 1-메틸-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(33 mg)는 1-메틸-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(36 mg), 2-에톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 431; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.26(t, 1H), 7.80(s, 1H), 7.65(t, 1H), 7.56(br, 2H), 7.48(d, 1H), 7.18(m, 1H), 7.14(d, 1H), 3.54(s, 3H), 3.46(q, 2H), 3.38(m 2H), 3.24(t, 2H), 및 1.08(t, 3H).
- [1328] 실시예 90:
- [1329] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아미드
- [1330] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-메탄술포닐-피페리딘-4-일)-아미드(42 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 1-메탄술포닐-피페리딘-4-일아민(60 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 570. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.32(br, 1H), 8.07(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.74(br, 1H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.92(br, 1H), 3.63(s, 3H), 3.58(m, 2H), 2.87(s, 3H), 2.82(m, 2H), 1.83(m, 2H), 및 1.62(m, 2H), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1331] 실시예 91:
- [1332] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 tert-부틸 에스테르
- [1333] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 tert-부틸 에스테르(41 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 글리신-tert-부틸 에스테르(44 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 523. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.76(t, 1H), 8.20(br, 1H), 8.12(m, 1H), 8.05(s, 1H), 7.88(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.46(d, 1H), 7.31(d, 1H), 3.90(d, 2H), 3.65(s, 3H), 및 1.42(s, 9H).
- [1334] 실시예 92:
- [1335] 4-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르

- [1336] 4-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(46 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 4-아미노-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(67 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 592. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.26(d, 1H), 8.08(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.74(br, 1H), 7.47(d, 1H), 7.35(d, 1H), 3.97(br, 1H), 3.91(m, 2H), 3.66(s, 3H), 2.82(m, 2H), 1.81(m, 2H), 1.42(s, 9H), 및 1.41(m, 2H), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1337] 실시예 93:
- [1338] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 염산염
- [1339] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 염산염(15 mg)은 4-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(30 mg), 및 염산(0.1 mL, 디옥산 중의 4.0 N 용액)을 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 492. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.21(br, 1H), 9.00(br, 1H), 8.42(m, 1H), 8.06(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.72(br, 1H), 7.45(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.52(s, 3H), 3.32(m, 4H), 2.92(q, 4H), 및 1.79(m, 2H).
- [1340] 실시예 94:
- [1341] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르
- [1342] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(44 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 3-아미노-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(67 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 592. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.22(m, 1H), 8.06(s, 1H), 7.87(s, 1H), 7.73(br, 1H), 7.53(br, 1H), 7.43(d, 1H), 7.32(d, 1H), 3.82(br, 1H), 3.65(s, 3H), 3.20(m, 2H), 2.80(m, 2H), 1.81(m, 1H), 및 1.39(s, 9H) 및 1.03(d, 4H).
- [1343] 실시예 95:
- [1344] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-3-일아미드 염산염
- [1345] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-3-일아미드 염산염(13 mg)은 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(30 mg), 및 염산(0.1 mL, 디옥산 중의 4.0 N 용액)을 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 492.
- [1346] 실시예 96:
- [1347] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (티아졸-2-일메틸)-아미드
- [1348] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (티아졸-2-일메틸)-아미드(44 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-아미노메틸-티아졸(38 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 506. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.36(br, 1H), 8.13(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.82(br, 1H), 7.75(d, 1H), 7.63(d, 1H), 7.54(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.77(d, 2H), 및 3.67(s, 3H).
- [1349] 실시예 97:
- [1350] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산

메틸 에스테르

- [1351] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(33 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈-이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 3-아미노-프로피온산 메틸 에스테르(35 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 495. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.53(t, 1H), 8.12(br, 1H), 8.08(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.42(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.38(d, 1H), 3.65(s, 3H), 3.62(s, 3H), 3.04(m, 2H), 및 2.62(t, 2H).
- [1352] 실시예 98:
- [1353] 3-([2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산
- [1354] 3-([2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(200 mg)은 3-([2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈-이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(247 mg), 및 LiOH(1.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 481. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.51(t, 1H), 8.10(br, 1H), 8.06(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.75(d, 1H), 7.64(br, 1H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 3.63(s, 3H), 3.46(m, 2H), 및 2.58(t, 2H), -COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1355] 실시예 99:
- [1356] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1357] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1358] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 82 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1359] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.35 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 2-아미노-5-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(1.17 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 424. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.16(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.85(br, 1H), 7.78-7.63(m, 1H), 7.50(d, 1H), 7.36(d, 2H), 3.66(s, 3H), 및 3.58(s, 3H).
- [1360] 실시예 100:
- [1361] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아세틸아미노-에틸)-아미드
- [1362] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아세틸아미노-에틸)-아미드(44 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(41 mg), N-(2-아미노-에틸)-아세트아미드(34 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.40(s, 1H), 7.98(m, 2H), 7.81(s, 1H), 7.64(d, 1H), 7.51(br, 1H), 7.35(m, 1H), 7.25(d, 1H), 3.62(s, 3H), 3.22(t, 4H), 및 1.81(s, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1363] 실시예 101:
- [1364] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드
- [1365] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드(82 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(82

mg), 2-메틸티오-에틸아민(30 mg), HBTU(76 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 483. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.58(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.91(m, 1H), 7.47(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.64(s, 3H), 3.48(q, 2H), 2.68(t, 2H), 및 2.12(s, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1366] 실시예 102:

[1367] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메탄술포닐-에틸)-아미드

[1368] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술포닐-에틸)-아미드(37 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술포닐-에틸)-아미드(48 mg), 및 과아세트산(0.1 mL, 아세트산 중의 32 wt% 용액)을 사용하는 일반적인 절차 M에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 515. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.68(t, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.75(m, 2H), 7.52(d, 1H), 7.44(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.72(m, 2H), 3.63(s, 3H), 3.40(t, 2H), 및 3.06(s, 3H).

[1369] 실시예 103:

[1370] (2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-카르밤산 tert-부틸 에스테르

[1371] (2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-카르밤산 tert-부틸 에스테르(92 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), (2-아미노-에틸)-카르밤산 tert-부틸 에스테르(64 mg), HBTU(76 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 552. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.40(br, 1H), 8.06(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.73(m, 2H), 7.46(d, 1H), 7.34(d, 1H), 6.91(t, 1H), 4.24(t, 2H), 3.64(s, 3H), 3.14-3.09(q, 2H), 및 1.36(s, 9H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1372] 실시예 104:

[1373] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 염산염

[1374] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 염산염(27 mg)은 (2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-카르밤산 tert-부틸 에스테르(55 mg), 및 염산(0.1 mL, 4.0 N 용액디옥산)을 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 452. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.63(br, 1H), 8.42(br, 1H), 8.07(s, 1H), 7.90(s, 1H), 7.71(m, 2H), 7.44(d, 1H), 7.35(d, 1H), 4.19(t, 2H), 3.64(s, 3H), 및 3.08(m, 2H), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1375] 실시예 105:

[1376] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸아미노-에틸)-아미드

[1377] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸아미노-에틸)-아미드(28 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), N-메틸-에틸렌디아민(25 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.43(br, 1H), 8.20(br, 1H), 7.95(s, 1H), 7.88(m, 1H), 7.69(m, 2H), 7.56(d, 1H), 7.38(d, 1H), 7.23(d, 1H), 3.59(s, 3H), 3.44(m, 2H), 2.98(m, 2H), 및 2.70(d, 3H).

[1378] 실시예 106:

- [1379] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 트리메틸히드라지드
- [1380] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 트리메틸히드라지드(33 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), N,N,N'-트리메틸히드라진 이염산염(49 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466.
- [1381] 실시예 107:
- [1382] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에틸술폰과닐-에틸)-아미드
- [1383] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에틸술폰과닐-에틸)-아미드(72 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), 2-에틸티오-에틸아민(34 mg), HBTU(76 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 497.
- [1384] 실시예 108:
- [1385] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메틸술폰과닐-프로필)-아미드
- [1386] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메틸술폰과닐-프로필)-아미드(69 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), 3-메틸티오-프로필아민(38 mg), HBTU(76 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 497.
- [1387] 실시예 109:
- [1388] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에탄술폰과닐-에틸)-아미드
- [1389] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에틸술폰과닐-에틸)-아미드(36 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에틸술폰과닐-에틸)-아미드(50 mg), 및 과아세트산(0.1 mL, 아세트산 중의 32 wt% 용액)을 사용하는 일반적인 절차 M에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 529. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.72(br, 1H), 8.09(d, 1H), 7.92(m, 1H), 7.75(t, 2H), 7.50(m, 1H), 7.37(d, 1H), 3.72(m, 1H), 3.63(s, 3H), 3.50(m, 2H), 3.40(t, 2H), 3.16(q, 2H), 및 1.24(t, 3H).
- [1390] 실시예 110:
- [1391] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메탄술폰과닐-프로필)-아미드
- [1392] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메탄술폰과닐-프로필)-아미드(37 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-메틸술폰과닐-프로필)-아미드(48 mg), 및 과아세트산(0.1 mL, 아세트산 중의 32 wt% 용액)을 사용하는 일반적인 절차 M에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 529. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(br, 1H), 8.56(t, 1H), 8.10(d, 1H), 7.91(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.73(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.64(s, 3H), 3.19(t, 2H), 2.99(s, 3H), 1.99(t, 2H), 및 1.31(t, 2H).
- [1393] 실시예 111:
- [1394] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1395] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF(5 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL, 13.9)을 사용하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

- [1396] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1397] 1-메틸-2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.16 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 2-아미노-5-플루오로-벤조티아졸(0.84 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 358.
- [1398] 실시예 112:
- [1399] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1400] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF(5 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL)을 사용하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1401] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 82 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1402] 1-메틸-2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.26 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 2-아미노-6-플루오로-벤조-티아졸(0.84 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 358.
- [1403] 실시예 113:
- [1404] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1405] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF(5 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL)을 사용하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1406] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 82 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1407] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.64 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 2-아미노-6-메탄술폰닐-벤조티아졸(1.14 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 418.
- [1408] 실시예 114:
- [1409] 1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1410] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF(5 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 6.95 mL)을 사용하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1411] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 82 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1412] 1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.47 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 2-아미노-6-메틸-벤조티아졸(0.82 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 354.
- [1413] 실시예 115:
- [1414] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1415] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(27 mg)는 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈-이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 메틸아민(0.2

mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 423.

- [1416] 실시예 116:
- [1417] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1418] 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(35 mg)는 1-메틸-2-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-메톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 467.
- [1419] 실시예 117:
- [1420] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
- [1421] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(1.53 g)은 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.78 g), 및 LiOH(10.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 344.
- [1422] 실시예 118:
- [1423] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
- [1424] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(1.49 g)은 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.78 g), 및 LiOH(10.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 344.
- [1425] 실시예 119:
- [1426] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
- [1427] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(1.75 g)은 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(2.08 g), 및 LiOH(10.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 404.
- [1428] 실시예 120:
- [1429] 1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산
- [1430] 1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(1.55 g)은 1-메틸-2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.76 g), 및 LiOH(10.0 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 340.
- [1431] 실시예 121:
- [1432] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (1,1-디옥소-테트라히드로-116-티오펜-3-일)-아미드
- [1433] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (1,1-디옥소-테트라히드로-116-티오펜-3-일)-아미드(39 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 1,1-디옥소-테트라히드로-116-티오펜-3-일아민(30 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 527; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.72(br, 1H), 8.09(d, 1H), 7.92(d, 1H), 7.78-7.63(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.72(m, 1H), 3.62(s, 3H), 3.52(m, 1H), 3.38(m, 1H), 3.20(m, 1H), 3.08(m, 1H), 2.43(t, 2H), 및 2.25(m, 1H).
- [1434] 실시예 122:
- [1435] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1436] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(24 mg)는 2-(5-플루오

로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 357.

[1437] 실시예 123:

[1438] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1439] 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(32 mg)는 2-(5-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 2-메톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 401; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.46(t, 1H), 8.05(d, 1H), 7.95(s, 1H), 7.79-7.71(m, 2H), 7.42(d, 1H), 7.30(d, 1H), 6.99(t, 1H), 3.65(s, 3H), 3.51-3.42(m, 2H), .3.36(d, 2H), 및 2.73(s, 3H).

[1440] 실시예 124:

[1441] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1442] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(26 mg)는 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 357. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.31(m, 1H), 7.93(d, 1H), 7.63(d, 2H), 7.50-7.42(m, 1H), 7.38-7.28(m, 1H), 7.12(t, 2H), 3.60(s, 3H), 및 2.78(d, 3H).

[1443] 실시예 125:

[1444] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1445] 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(29 mg)는 2-(6-플루오로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 2-메톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 401; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.44(m, 1H), 8.06(br, 1H), 7.76-7.70(m, 2H), 7.66(br, 1H), 7.45(d, 1H), 7.20(t, 1H), 3.61(s, 3H), 3.44(m, 4H), 및 3.26(s, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1446] 실시예 126:

[1447] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1448] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(34 mg)는 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(40 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 417; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.45(m, 1H), 8.04(br, 1H), 8.00(m, 1H), 7.93(s, 1H), 7.71(t, 2H), 7.43(d, 1H), 7.18(t, 1H), 3.63(s, 3H), 3H), 3.27(s, 3H), 및 2.87(s, 3H).

[1449] 실시예 127:

[1450] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1451] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(33 mg)는 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(40 mg), 2-메톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 461; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.36(t, 1H), 8.14(br, 1H), 7.94(d, 2H), 7.66(d, 1H), 7.59(d, 1H), 7.44(d, 1H), 7.25(d, 1H), 3.61(s, 3H), 3.45(m, 4H), 3.27(s, 3H), 및 2.87(s, 3H).

[1452] 실시예 128:

[1453] 2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1454] 2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(26 mg)는 2-(6-메틸-벤조

티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 2.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 353. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.32(m, 1H), 8.00(br, 1H), 7.66(d, 1H), 7.55(s, 2H), 7.38(m, 2H), 7.14(d, 1H), 3.63(s, 3H), 2.87(d, 3H), 및 2.35(s, 3H).

[1455] 실시예 129:

[1456] 2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1457] 2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(29 mg)는 2-(6-메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(34 mg), 2-메톡시-에틸아민(0.1 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 397.

[1458] 실시예 130:

[1459] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드

[1460] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드(41 mg)는 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(80 mg), 2-메틸티오-에틸아민(0.2 mL), HBTU(76 mg), 및 DIEA(0.2 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 477.

[1461] 실시예 131:

[1462] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드

[1463] 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드(36 mg)는 2-(6-메탄술폰닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술폰과닐-에틸)-아미드(48 mg), 및 과아세트산(0.1 mL, 아세트산 중의 32 wt% 용액)을 사용하는 일반적인 절차 M에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 509. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.68(m, 2H), 8.35(s, 1H), 8.08(br, 1H), 7.93(s, 1H), 7.84(m, 2H), 7.76(br, 1H), 3.70(m, 2H), 3.66(s, 3H), 3.40(t, 2H), 3.20(s, 3H), 및 2.87(d, 3H).

[1464] 실시예 132:

[1465] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸술폰과닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1466] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg)는 DMF(5 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 메틸아민(THF 중의 2.0 M, 6.95 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1467] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(677 mg)는 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(822 mg) 및 Pd/C(10 wt%)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1468] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸술폰과닐-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.43 g)는 3-아미노-4-메틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(0.9 g), 6-트리플루오로메틸술폰과닐-벤조티아졸-2-일아민(1.25 g), 1,1'-티오카보닐다이이미다졸(1.07 g), 및 EDC(1.15 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 440. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.23(s, 2H), 7.89(br, 1H), 7.76(br, 1H), 7.69(d, 2H), 7.54(d, 1H), 3.88(s, 3H), 및 3.68(s, 3H).

[1469] 실시예 133:

[1470] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1471] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(33 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(36 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드 아세테이트 염(48 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 444. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 11.70(br, 1H), 8.44(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.94(m, 1H),

7.80(m, 1H), 7.66(br, 1H), 7.50(d, 1H), 7.38(d, 1H), 4.12(d, 2H), 3.61(s, 3H), 3.03(s, 3H), 및 2.87(s, 3H).

[1472] 실시예 134:

[1473] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1474] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(38 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(39 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드 아세테이트 염(48 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 478. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.49(br, 1H), 8.46(t, 1H), 8.25(s, 1H), 8.14(s, 1H), 7.82(m, 2H), 7.68(m, 1H), 7.53(d, 1H), 4.13(d, 2H), 3.66(s, 3H), 3.04(s, 3H), 및 2.87(s, 3H).

[1475] 실시예 135:

[1476] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드

[1477] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-디메틸카바모일-에틸)-아미드(38 mg)는 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(48 mg), 디메틸아민(0.3 mL, THF 중의 1.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 508. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.41(t, 1H), 8.05(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.73(m, 2H), 7.46(m, 1H), 7.35(d, 1H), 7.34(m, 1H), 3.66(s, 3H), 3.51-3.46(q, 2H), 2.98(s, 3H), 2.84(s, 3H), 및 2.62(t, 2H).

[1478] 실시예 136:

[1479] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 tert-부틸 에스테르

[1480] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 tert-부틸 에스테르(38 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(39 mg), β-알라닌 tert-부틸 에스테르(42 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 537.

[1481] 실시예 137:

[1482] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[1483] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(41 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-아미노-1-(4-메틸-피페라진-1-일)-에탄온(0.30 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 549. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.48(t, 1H), 8.10(s, 1H), 7.96(s, 1H), 7.91(d, 1H), 7.78(d, 1H), 7.64(br, 1H), 7.48(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.14(d, 2H), 3.67(s, 3H), 3.61(m, 2H), 3.48(m, 4H), 2.89(s, 3H), 및 2.32(m, 2H).

[1484] 실시예 138:

[1485] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드

[1486] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드(39 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-아미노-1-모르폴린-4-일-에탄온(0.28 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인

절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 536. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.50(t, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(m, 1H), 7.79(br, 1H), 7.74(br, 1H), 7.50(d, 2H), 7.38(m, 1H), 4.16(d, 2H), 3.66(s, 3H), 3.62(m, 2H), 3.58(t, 2H), 3.52(t, 2H), 및 3.48(t, 2H).

[1487] 실시예 139:

[1488] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸카바모일메틸-아미드

[1489] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 메틸카바모일메틸-아미드(47 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(47 mg), 메틸아민(0.2 mL, THF 중의 1.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 480.

[1490] 실시예 140:

[1491] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디에틸카바모일메틸-아미드

[1492] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 디에틸카바모일메틸-아미드(48 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(47 mg), 디에틸아민(0.2 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 522. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.45(t, 1H), 8.08(s, 1H), 7.90(m, 2H), 7.78(br, 1H), 7.66(br, 1H), 7.48(d, 1H), 7.34(d, 1H), 4.13(d, 2H), 3.66(s, 3H), 3.38-3.28(m, 4H), 및 1.05(t, 6H).

[1493] 실시예 141:

[1494] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-피롤리딘-1-일-에틸)-아미드

[1495] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-피롤리딘-1-일-에틸)-아미드(46 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(47 mg), 피롤리딘(0.14 mL), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 520. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.32(t, 1H), 7.82(s, 1H), 7.61(m, 2H), 7.52(d, 1H), 7.28(m, 1H), 7.17(m, 1H), 7.09(m, 1H), 4.02(d, 2H), 3.57(s, 3H), 3.49(t, 2H), 3.34(m, 2H), 1.91(p, 2H), 및 1.79(p, 2H).

[1496] 실시예 142:

[1497] 4-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피페라진-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르

[1498] 4-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피페라진-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(58 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(47 mg), 피페라진-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(34 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 635.

[1499] 실시예 143:

[1500] (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤즈이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피

온산 메틸 에스테르

- [1501] (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(39 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), L-알라닌 메틸 에스테르 염산염(42 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 495.
- [1502] 실시예 144:
- [1503] 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산 에틸 에스테르
- [1504] 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산 에틸 에스테르(45 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 1-아미노-시클로프로판카르복시산 에틸 에스테르 염산염(50 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 521.
- [1505] 실시예 145:
- [1506] 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르
- [1507] 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(43 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(41 mg), 2-아미노-2-메틸-프로피온산 메틸 에스테르 염산염(46 mg), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 509.
- [1508] 실시예 146:
- [1509] (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산
- [1510] (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(83 mg)은 (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(99 mg), 및 LiOH(0.5 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 481.
- [1511] 실시예 147:
- [1512] 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산
- [1513] 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산(91 mg)은 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산 에틸 에스테르(104 mg), 및 LiOH(0.5 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493.
- [1514] 실시예 148:
- [1515] 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산
- [1516] 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(88 mg)은 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(102 mg), 및 LiOH(0.5 mL, 물 중의 2.0 N 용액)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 495.
- [1517] 실시예 149:
- [1518] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일

-에틸)-아미드

- [1519] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드(46 mg)는 (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(48 mg), 디메틸아민(0.3 mL, THF 중의 1.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 508. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.39(d, 1H), 7.98(s, 1H), 7.95(s, 1H), 7.76(m, 1H), 7.66(m, 1H), 7.45(br, 1H), 7.30(m, 1H), 7.22(d, 1H), 4.93(p, 1H), 3.62(s, 3H), 2.87(d, 6H), 및 1.31(d, 3H).
- [1520] 실시예 150:
- [1521] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-디메틸카바모일-시클로프로필)-아미드
- [1522] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-디메틸카바모일-시클로프로필)-아미드(48 mg)는 1-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-시클로프로판카르복시산(49 mg), 디메틸아민(0.3 mL, THF 중의 1.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 520 [M+2]. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.92(s, 1H), 8.06(s, 1H), 7.91(m, 1H), 7.72(d, 1H), 7.60(br, 1H), 7.46(d, 1H), 7.33(d, 1H), 7.24(m, 1H), 3.66(s, 3H), 2.87(d, 6H), 1.26(t, 2H), 및 1.01(t, 2H).
- [1523] 실시예 151:
- [1524] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-디메틸카바모일-1-메틸-에틸)-아미드
- [1525] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (1-디메틸카바모일-1-메틸-에틸)-아미드(47 mg)는 2-메틸-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(49 mg), 디메틸아민(0.3 mL, THF 중의 1.0 M 용액), HBTU(38 mg), 및 DIEA(0.1 mL)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 0 °C에서 교반하고 있는 반응 혼합물의 마지막에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 작은 변형이 있었다. LC/MS: m/z 522. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.54(s, 1H), 8.09(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.64(br, 1H), 7.47(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.67(s, 3H), 2.87(d, 6H), 및 1.49(s, 6H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1526] 실시예 152:
- [1527] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미드 염산염
- [1528] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-2-피페라진-1-일-에틸)-아미드 이염산염(42 mg)은 4-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피페라진-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(63 mg), 및 염산(0.25 mL, 4.0 N 용액/옥산)을 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 535. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.55(br, 1H), 9.48(br, 1H), 8.64(t, 1H), 8.13(s, 1H), 7.98(s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.66(d, 1H), 7.57(d, 1H), 7.40(d, 1H), 4.21(d, 2H), 3.79(m, 2H), 3.73(m, 2H), 3.71(s, 3H), 3.16(m, 2H), 및 3.07(m, 2H).
- [1529] 실시예 153:
- [1530] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르
- [1531] 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(4.0 g)는 에틸아민(THF 중의 2.0 M, 50 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(5.0 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없

이 다음 단계에 사용하였다.

- [1532] 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(3.2 g)는 MeOH:EtOAc(1:1, 30.0 mL) 중의 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(4.0 g) 및 Pd/C(20 wt%, 800.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1533] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(3.70 g)는 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(3.0 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(4.4 g), 1,1'-티오카보닐다이미다졸(3.5 g), 및 EDC(3.6 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 438; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.25 및 8.05(0.59 및 0.53, 1H, m), 7.93(2H, m), 7.75(1H, m), 7.59(1H, m), 7.38-7.37(1H, m), 4.25-4.23(2H, m), 3.88(3H, s), 1.35-1.31(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1534] 실시예 154:
- [1535] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
- [1536] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(2.1 g)은 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(3.5 g) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 8.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 424; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.17(1H, m), 7.96(1H, m), 7.75(1H, m), 7.88-7.85(1H, m), 7.65-7.63(1H, m), 7.59-7.57(1H, m), 7.40-7.37(1H, m), 4.26-4.25(2H, q), 1.35-1.32(3H, t), -COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1537] 실시예 155:
- [1538] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1539] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(50.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1 mL), DPPA(82.0 mg), 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 437; 및 ^1H NMR(CD $_3$ OD, 400 MHz): δ 7.93(1H, d), 7.73-7.70(2H, m), 7.64-7.63(1H, d), 7.40-7.38(1H, m), 7.25-7.22(1H, m), 4.25-4.23(2H, q), 2.95(3H, s), 1.41-1.38(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1540] 실시예 156:
- [1541] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1542] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(53.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 에틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1 mL), DPPA(85.0 mg), 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 451; 및 ^1H NMR(CD $_3$ OD, 400 MHz): δ 7.95(1H, d), 7.75-7.73(2H, m), 7.65-7.64(1H, d), 7.42-7.40(1H, m), 7.26-7.24(1H, m), 4.27-4.25(2H, q), 3.47-3.42(2H, q), 1.42-1.39(3H, t), 1.27-1.24(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1543] 실시예 157:
- [1544] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1545] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(60.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-에톡시-에틸아민(30.0 mg), DPPA(85.0 mg), 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 495; 및 ^1H NMR(CD $_3$ OD, 400 MHz): δ 7.96(1H, d), 7.77-7.75(2H, m), 7.65(1H, d), 7.43-7.41(1H, m), 7.26-7.24(1H, m), 4.27-4.26(2H, q), 3.66-3.64(2H, m), 3.59-3.55(4H,

m), 1.43-1.39(3H, t), 1.23-1.20(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1546] 실시예 158:

[1547] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

[1548] 4-이소프로필아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(900.0 mg)는 DMF(10.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 이소프로필아민(325.0 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1549] 3-아미노-4-이소프로필아미노-벤조산 메틸 에스테르(700.0 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 10.0 mL) 중의 4-이소프로필아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(900.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 180.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1550] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(580.0 mg)는 DMF(8.0 mL) 중의 3-아미노-4-이소프로필아미노-벤조산 메틸 에스테르(700.0 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(930.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(700.0 mg), 및 EDC(770.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 452; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.27 및 8.05(0.6 및 0.47, 1H, m), 7.93(1H, m), 7.84(1H, m), 7.73(2H, m), 7.37(1H, m), 5.15(1H, m), 3.88(3H, s), 1.58-1.57(6H, d), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1551] 실시예 159:

[1552] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산

[1553] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(500.0 mg)은 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(580.0 mg) 및 수산화리튬(2.0 N 용액, 3.0 mL), MeOH(2.0 mL) 및 THF(2.0 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 438; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.17(1H, m), 7.96(1H, m), 7.84-7.82(1H, m), 7.72-7.70(1H, m), 7.64-7.61(1H, m), 7.40-7.37(1H, m), 5.16-5.13(1H, m), 1.59-1.58(6H, d), -NH프로톤 및 -COOH신호가 관찰되지 않음.

[1554] 실시예 160:

[1555] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1556] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(44.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 451; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.40(1H, m), 8.10(1H, m), 7.92(1H, m), 7.75-7.68(2H, m), 7.37-7.35(1H, m), 5.17-5.12(1H, m), 2.82-2.80(3H, s), 1.58-1.57(6H, d), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1557] 실시예 161:

[1558] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드

[1559] 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(50.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-이소프로필-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 에틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 465; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.43(1H, m), 8.11(1H, m), 7.92(1H, m), 7.71-7.67(2H, m), 7.36-7.35(1H, m), 5.15-5.12(1H, m), 3.32(2H, m), 1.58-1.57(6H, d), 1.16-1.13(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1560] 실시예 162:

[1561] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르

- [1562] 4-이소부틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(950.0 mg)는 DMF(10.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 이소부틸아민(402.0 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1563] 3-아미노-4-이소부틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(790.0 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 10.0 mL) 중의 4-이소부틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(950.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 190.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1564] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(660.0 mg)는 DMF(8.0 mL) 중의 3-아미노-4-이소부틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(790.0 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(930.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(700.0 mg), 및 EDC(770.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 466; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.25 및 8.05(0.6 및 0.46, 1H, m), 7.98-7.88(2H, m), 7.75-7.73(1H, m), 7.60-7.58(1H, m), 7.38-7.37(1H, m), 4.00-3.98(2H, m), 3.88(3H, s), 2.29-2.28(1H, m), 0.92-0.86(6H, m), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1565] 실시예 163:
- [1566] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
- [1567] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(570.0 mg)은 MeOH(1.0 mL) 및 THF(3.0 mL) 중의 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(660.0 mg) 및 수산화리튬(2.0 N 용액, 3.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 452; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.16(1H, m), 7.97-7.94(1H, m), 7.85-7.82(1H, m), 7.57-7.55(2H, m), 7.39-7.37(1H, m), 4.03-4.01(2H, d), 2.29-2.24(1H, m), 0.93-0.91(6H, d), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1568] 실시예 164:
- [1569] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1570] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(40.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 465; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.40(1H, m), 8.09(1H, m), 7.91(1H, m), 7.72(1H, m), 7.54(1H, m), 7.35(1H, m), 4.00-3.99(2H, m), 2.81-2.80(3H, d), 1.23(1H, m), 0.95-0.92(6H, m), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1571] 실시예 165:
- [1572] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1573] 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(47.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-이소부틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 에틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 479 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.43(1H, m), 8.09(1H, m), 7.91(1H, m), 7.73(1H, m), 7.54(1H, m), 7.37-7.35(1H, m), 4.04-4.00(2H, m), 3.32(2H, m), 2.28(1H, m), 1.16-1.13(3H, t), 0.95-0.91(6H, m), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1574] 실시예 166:
- [1575] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산
- [1576] 4-(2-메톡시-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(960.0 mg)는 DMF(10.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g) 및 2-메톡시-에틸아민(413.0 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1577] 3-아미노-4-(2-메톡시-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(800.0 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 10.0 mL) 중의 4-(2-메

톡시-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(960.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 190.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1578] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(829.0 mg)는 DMF(8.0 mL) 중의 3-아미노-4-(2-메톡시-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(800.0 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(930.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(700.0 mg), 및 EDC(770.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.

[1579] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(723.0 mg)은 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(829.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 3.0 mL) MeOH(1.0 mL) 및 THF(3.0 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 454; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.14(1H, s), 7.95(1H, m), 7.84-7.82(1H, m), 7.63(1H, br. m), 7.51(1H, m), 7.55-7.52(1H, m), 7.39-7.36(1H, m), 4.39-4.36(2H, t), 3.74-3.71(2H, t), 3.24(3H, s), -COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1580] 실시예 167:

[1581] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1582] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(46.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 467; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.39(1H, br. s), 8.07(1H, br. s), 7.92(1H, br. s), 7.74-7.72(1H, br. m), 7.51-7.49(1H, m), 7.37-7.35(1H, m), 4.35(4H, br. s), 3.73-3.72(2H, br. t), 3.24(3H, s), 2.82-2.80(3H, d).

[1583] 실시예 168:

[1584] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1585] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(42.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(26.0 mg), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 511; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.47(1H, br. s), 8.08(1H, br. s), 7.93(1H, br. s), 7.74-7.72(1H, br. m), 7.51(1H, m), 7.37-7.35(1H, m), 4.35(2H, br. s), 3.73-3.72(2H, br. t), 3.53-3.43(4H, m), 3.29(3H, s), 3.24(3H, s), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1586] 실시예 169:

[1587] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1588] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(49.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(30.0 mg), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 525; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.44(1H, br. s), 8.06(1H, br. s), 7.91(1H, br. s), 7.71(1H, br. m), 7.49-7.47(1H, m), 7.35-7.34(1H, m), 4.34(2H, br. s), 3.72-3.69(2H, br. t), 3.52-3.40(6H, m), 3.22(3H, s), 1.13-1.09(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1589] 실시예 170:

[1590] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

- [1591] 4-(2-플루오로-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(854.0 mg)는 DMF(10.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(1.0 g), DIEA(2.0 mL) 및 2-플루오로-에틸아민(335.0 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1592] 3-아미노-4-(2-플루오로-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(657.0 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 10.0 mL) 중의 4-(2-플루오로-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(854.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 170.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1593] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(550.0 mg)는 DMF(6.0 mL) 중의 3-아미노-4-(2-플루오로-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(657.0 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(819.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(623.0 mg), 및 EDC(670.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1594] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(475.0 mg)은 MeOH(1.0 mL) 및 THF(3.0 mL) 중의 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(550.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 3.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 441(M+2)⁺ 및 ¹H NMR(CD₃OD, 400 MHz): δ 8.16(1H, m), 8.06-8.03(1H, m), 7.96(1H, m), 7.86-7.84(1H, m), 7.57-7.52(1H, m), 7.44-7.37(2H, m), 4.89-4.75(2H, m), 4.59-4.51(2H, m)(-COOH 프로톤 신호가 관찰되지 않음).
- [1595] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(39.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 455; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.35-8.34(1H, m), 8.13-8.08(1H, m), 8.02-8.01(1H, m), 7.90-7.80(1H, m), 7.74-7.68(1H, m), 7.51-7.36(2H, m), 4.87-4.83(1H, m), 4.51-4.45(1H, m), 3.30(3H, s), 2.80-2.79(2H, d), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1596] 실시예 171:
- [1597] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1598] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(49.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(26.0 mg), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 499.
- [1599] 실시예 172:
- [1600] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1601] 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조-이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(50.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-플루오로-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-에톡시-에틸아민(31.0 mg), HBTU(130.0 mg) 및 DIEA(0.1 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 513.
- [1602] 실시예 173:
- [1603] 1-(2-아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드 염산염
- [1604] 4-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(650.0 mg)는 DMF(3.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(542.0 mg) 및 (2-아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(500.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

- [1605] 3-아미노-4-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(525.0 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 6.0 mL) 중의 4-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸아미노)-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(650.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 130.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1606] 1-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(374.0 mg)는 DMF(2.0 mL) 중의 3-아미노-4-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸아미노)-벤조산 메틸 에스테르(525.0 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(585.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(445.0 mg), 및 EDC(480.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1607] 1-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(327.0 mg)은 1-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(374.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 1.0 mL), MeOH(0.5 mL), 및 THF(2.0 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1608] {2-[5-메틸카바모일-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-벤조이미다졸-1-일]-에틸}-카르복시산 tert-부틸 에스테르(39.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-tert-부톡시카보닐아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 0.5 mL), HBTU(80.0 mg) 및 DIEA(0.05 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1609] 1-(2-아미노-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드 염산염(16.0 mg)은 4.0 M HCl-디옥산:DCM(2:1, 1.0 mL)을 사용하여 제조하였다. LC/MS: m/z 452; 및 ¹H NMR(CD₃OD, 400 MHz): δ 8.35-8.34(1H, m), 8.06-8.05(1H, m), 7.89-7.62(5H, m), 7.42-7.37(2H, m), 4.63-4.60(2H, m), 3.50(1H, m), 2.98-2.96(3H, d), 2.89-2.85(2H, m).
- [1610] 실시예 174:
- [1611] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드
- [1612] 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(8.3 g)는 DMF(50.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(10.0 g), DIEA(1.6 mL) 및 에틸아민 염산염(4.5 g)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1613] 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(6.4 g)는 MeOH:EtOAc(1:1, 50.0 mL) 중의 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(8.3 g) 및 Pd/C(20 wt%, 170 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1614] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(926.0 mg)는 DMF(5.0 mL) 중의 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(1.06 g), 2-아미노-6-클로로-벤조티아졸(1.0 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(979.0 mg), 및 EDC(1.05 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1615] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(803.0 mg)은 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(926.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 2.0 mL), MeOH(1.0 mL), 및 THF(2.0 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1616] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(77.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1.0 mL), HBTU(190 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 387; 및 ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.40(1H, br. s), 8.08(1H, br. s), 7.95(1H, m), 7.73(2H, m), 7.51(1H, m), 7.41-7.38(1H, m), 4.21(1H, bs. s), 2.82-2.80(3H, d), 1.34-1.30(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1617] 실시예 175:
- [1618] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1619] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(70.0 mg)는 DMF(1.0 mL)

중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 에틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1.0 mL), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 401; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.44(1H, m), 8.08(1H, m), 7.95-7.92(1H, m), 7.75-7.64(2H, m), 7.53-7.51(1H, m), 7.41-7.38(1H, m), 4.21-4.19(2H, m), 3.32-3.28(2H, m), 1.34-1.32(3H, t), 1.17-1.13(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1620] 실시예 176:

[1621] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드

[1622] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-플루오로-에틸)-아미드(75.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-플루오로-에틸아민(38.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 419⁺.

[1623] 실시예 177:

[1624] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드

[1625] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(68.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(45.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 431; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.46(1H, br. s), 8.08(1H, br. s), 7.92(1H, br. s), 7.76-7.65(2H, m), 7.51(1H, m), 7.40-7.38(1H, m), 4.22(2H, br. s), 3.50-3.43(4H, m), 3.29(3H, s), 1.33-1.30(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1626] 실시예 178:

[1627] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드

[1628] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드(73.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-메톡시-2-메틸-프로필아민(61.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 459; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.18-8.16(1H, m), 8.08(1H, m), 7.92-7.91(1H, m), 7.79-7.77(1H, m), 7.67-7.65(1H, m), 7.54-7.52(1H, m), 7.40-7.37(1H, m), 4.21-4.20(2H, m), 3.37-3.35(2H, d), 3.18(3H, s), 1.34-1.30(3H, t), 1.14(6H, s), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1629] 실시예 179:

[1630] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드

[1631] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(79.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-에틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-에톡시-에틸아민(53.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 445; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.47(1H, br. s), 8.08(1H, br. s), 7.92(1H, br. s), 7.76-7.63(2H, m), 7.52(1H, m), 7.40-7.38(1H, m), 4.22(2H, m), 3.53-3.41(6H, m), 1.34-1.30(3H, t), 1.14-1.11(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1632] 실시예 180:

[1633] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드

[1634] 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(8.3 g)는 DMF(50.0 mL) 중의 메틸 4-클로로-3-니트로벤조에이트(10.0 g), DIEA(1.6 mL) 및 에틸아민 염산염(4.5 g)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

- [1635] 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(6.4 g)는 MeOH:EtOAc(1:1, 50.0 mL) 중의 4-에틸아미노-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(8.3 g) 및 Pd/C(20 wt%, 170 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1636] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(840.0 mg)는 DMF(5.0 mL) 중의 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(970.0 mg), 6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아민(1.0 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(890.0 mg), 및 EDC(970.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1637] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(770.0 mg)은 MeOH(1.0 mL) 및 THF(2.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(840.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 2.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1638] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸아미드(75.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 메틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1.0 mL), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 421.
- [1639] 실시예 181:
- [1640] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드
- [1641] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸아미드(70.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 에틸아민(THF 중의 2.0 M 용액, 1.0 mL), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 435; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.45-8.39(1H, m), 8.29-8.25(1H, m), 8.12-8.08(1H, m), 7.82-7.67(3H, m), 7.57-7.50(1H, m), 4.26-4.22(2H, m), 3.31-3.29(2H, m), 1.35-1.32(3H, t), 1.17-1.13(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1642] 실시예 182:
- [1643] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1644] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(64.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(38.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 465; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.50(1H, m), 8.25(1H, br. s), 8.12(1H, br., s), 7.82-7.78(2H, m), 7.70-7.68(1H, m), 7.57-7.54(1H, m), 4.24(2H, m), 3.51-3.43(4H, m), 3.29(3H, s), 1.35-1.31(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1645] 실시예 183:
- [1646] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드
- [1647] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-에톡시-에틸)-아미드(66.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-에톡시-에틸아민(45.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 479.
- [1648] 실시예 184:
- [1649] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드
- [1650] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-2-메틸-프로필)-아미드(78.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-메톡시-2-메틸-프로필아민(50.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및

DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.25(1H, br. s), 8.20-8.17(1H, m), 8.11(1H, br., s), 7.81(1H, m), 7.70(1H, m), 7.57(1H, m), 4.25(2H, m), 3.37-3.35(2H, d), 3.32(2H, s), 3.18(3H, s), 1.35-1.32(3H, t), 1.14(6H, s).

[1651] 실시예 185:

[1652] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술팜닐-에틸)-아미드

[1653] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메틸술팜닐-에틸)-아미드(67.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150.0 mg), 2-메틸술팜닐-에틸아민(45.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 481; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.59(1H, br. s), 8.26(1H, br. s), 8.11(1H, br., s), 7.76-7.68(2H, m), 7.56(1H, m), 4.25(2H, bs. s), 3.51-3.46(2H, q), 3.32(2H, s), 2.70-2.66(2H, t), 2.12(3H, s), 1.35-1.32(3H, t).

[1654] 실시예 186:

[1655] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1656] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(45.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(25.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 508; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.19(1H, br. s), 7.88(1H, br. s), 7.68(1H, br., s), 7.55(1H, br., s), 7.34-7.24(2H, m), 7.13(1H, m), 4.19-4.16(2H, m), 4.12-4.10(2H, d), 3.03(3H, s), 2.88(3H, s), 1.31-1.27(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1657] 실시예 187:

[1658] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1659] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(40.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(25.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 492; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.25(1H, m), 7.88-7.84(2H, m), 7.51-7.49(1H, m), 7.37-7.28(2H, m), 7.19-7.18(1H, m), 4.18-4.15(2H, m), 4.11-4.09(2H, m), 3.03(3H, s), 2.87(3H, s), 1.29-1.23(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1660] 실시예 188:

[1661] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드

[1662] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(35.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(25.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 537.6; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.59(1H, m), 7.90(1H, br. s), 7.72(1H, br., s), 7.56-7.54(1H, m), 7.38-7.31(2H, m), 7.18(1H, m), 4.30-4.27(2H, t), 4.11-4.10(2H, d), 3.70-3.67(2H, t), 3.25(3H, s), 3.03(3H, s), 2.87(3H, s), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1663] 실시예 189:

[1664] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸

-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

- [1665] 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(45.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-(2-메톡시-에틸)-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-아미노-1-(4-메틸-피페라진-1-일)-에탄온(40.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 593; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.49-8.46(1H, m), 8.09(1H, br. s), 7.95-7.93(2H, m), 7.74(1H, m), 7.53-7.50(1H, m), 7.37-7.34(1H, m), 4.37-4.36(2H, m), 4.16-4.14(2H, d), 3.74-3.71(2H, t), 3.48-3.46(4H, m), 3.24(3H, s), 2.36-2.28(4H, m), 2.20(3H, s), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1666] 실시예 190:
- [1667] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
- [1668] 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(50.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 2-아미노-1-(4-메틸-피페라진-1-일)-에탄온(40.0 mg), HBTU(190.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 563; 및 ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.51-8.48(1H, m), 8.12(1H, br. s), 7.93(1H, br., s), 7.74-7.71(2H, m), 7.55(1H, m), 7.37(1H, m), 4.26(2H, bs. s), 4.16-4.15(2H, m), 3.51-3.50(4H, m), 2.40-2.33(4H, m), 2.24(3H, s), 1.35-1.31(3H, t), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1669] 실시예 191:
- [1670] 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드
- [1671] 6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아민(2.1 g)은 아세트산(45.0 mL) 중의 4-(피리딘-3-일옥시)-페닐아민(2.0 g) 및 KCNS(3.3 g)를 사용하여 제조하였다. 반응물을 실온에서 20분 동안 교반하였다. 3.0 mL 아세트산 중의 브롬(0.3 mL)을 천천히 첨가하고, 반응물을 실온에서 8-10시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 물(100.0 mL)에 희석시키고, 침전물을 여과하고 건조하였다. 침전물을 포화 중탄산나트륨 용액으로 세척하고, 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1672] 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(155.0 mg)는 DMF(2.0 mL) 중의 3-아미노-4-에틸아미노-벤조산 메틸 에스테르(160.0 mg), 6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아민(200.0 mg), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(200.0 mg), 및 EDC(200.0 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1673] 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(133.0 mg)은 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(155.0 mg) 및 수산화나트륨(2.0 N 용액, 1.0 mL) MeOH(0.5 mL) 및 THF(1.0 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1674] 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메톡시-에틸)-아미드(61.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-에틸-2-[6-(피리딘-3-일옥시)-벤조티아졸-2-일아미노]-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(133.0 mg), 2-메톡시-에틸아민(38.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 490. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.44(1H, m), 8.38-8.32(2H, m), 8.07(1H, m), 7.76-7.68(2H, m), 7.51-7.45(1H, m), 7.40-7.39(2H, m), 7.12-7.10(1H, m), 4.20-4.17(2H, m), 3.48-3.42(3H, m), 3.26(3H, s), 1.48-1.46(1H, m), 1.32-1.28(3H, t), 2 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1675] 실시예 192:
- [1676] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드
- [1677] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리

딘-1-일)-에틸]-아미드(50.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 1-(2-아미노-에틸)-피페리딘-4-올(72.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 421. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.00(1H, m), 7.80-7.77(1H, m), 7.65(1H, m), 7.41-7.39(1H, m), 7.26-7.24(1H, m), 3.90(1H, m), 3.75-3.72(2H, t), 3.69(3H, s), 3.37(1H, m), 3.18(2H, m), 2.07-2.02(2H, m), 1.83-1.78(2H, m), 1.32-1.29(2H, m), 0.90-0.87(2H, m), 2 -NH 및 -OH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1678] 실시예 193:

[1679] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드

[1680] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드(38.0 mg)는 DMF(1.0 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조-티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100.0 mg), 1-(2-아미노-에틸)-피페리딘-3-올(72.0 mg), HBTU(200.0 mg) 및 DIEA(0.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 536. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 7.90(1H, m), 7.72-7.65(2H, m), 7.61(1H, m), 7.33-7.30(1H, m), 7.23-7.21(1H, m), 3.78-3.74(1H, m), 3.64(3H, s), 3.60-3.56(2H, t), 2.99-2.96(1H, m), 2.81-2.78(1H, m), 2.72-2.69(2H, t), 2.30-2.22(2H, m), 1.92-1.83(2H, m), 1.63-1.58(1H, m), 1.37-1.34(1H, m), 2 -NH 및 -OH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1681] 실시예 194:

[1682] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르보니트릴

[1683] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조니트릴(1.69 mg)은 DMF 중의 메틸 4-플루오로-3-니트로벤조니트릴(1.66 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 10.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1684] 3-아미노-4-메틸아미노-벤조니트릴(1.23 mg)은 4-메틸아미노-3-니트로-벤조니트릴(1.33 g) 및 Pd/C(10 wt%, 133 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1685] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르보니트릴(2.12 g)은 3-아미노-4-메틸아미노-벤조니트릴(1.1 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(1.75 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.78 g), 및 EDC(1.9 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 391. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 7.97(s, 1H), 7.89(s, 1H), 7.78(br, 1H), 7.60(d, 2H), 7.55(br, 1H), 7.39(d, 1H), 및 3.72(s, 3H).

[1686] 실시예 195:

[1687] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-6-카르보니트릴

[1688] 3-메틸아미노-4-니트로-벤조니트릴(1.58 mg)은 DMF 중의 메틸 3-플루오로-4-니트로벤조니트릴(1.66 g) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 10.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1689] 4-아미노-3-메틸아미노-벤조니트릴(1.17 mg)은 3-메틸아미노-4-니트로-벤조니트릴(1.33 g) 및 Pd/C(10 wt%, 133 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

[1690] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-6-카르보니트릴(2.27 g)은 4-아미노-3-메틸아미노-벤조니트릴(1.1 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(1.75 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.78 g), 및 EDC(1.9 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 391.

[1691] 실시예 196:

[1692] [5-(1H-이미다졸-2-일)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-2-일]-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민

- [1693] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르보니트릴(2.27 g)은 4-아미노-3-메틸아미노-벤조니트릴(1.1 g), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)벤조티아졸(1.75 g), 1,1'-티오카보닐디이미다졸(1.78 g), 및 EDC(1.9 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. 이 생성물은 DCM-메탄올(9:1)로 분쇄한 후, 다음 단계에 사용하였다.
- [1694] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시미드산 에틸 에스테르(630 mg)는 일반적인 절차 I의 단계 1에 따라 1-메틸-2-(6-트리플루오로-메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르보니트릴(778 mg) 및 아미노아세트알데히드디에틸아세탈(0.53 mL) 및 AcOH(0.6 mL)로부터 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1695] [5-(1H-이미다졸-2-일)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-2-일]-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민(316 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시미드산 에틸 에스테르(435 mg), AcOH(0.5 mL), 및 묽은 염산(5.0 mL, 물 중의 1.0 N 용액)으로부터 시작하는 일반적인 절차 I의 단계 2에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 432.
- [1696] 실시예 197:
- [1697] [1-메틸-6-(1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1H-벤조이미다졸-2-일]-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민
- [1698] [1-메틸-6-(1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1H-벤조이미다졸-2-일]-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민(106 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시미드산 에틸 에스테르(218 mg) 및 포름산 히드라지드(18 mg)를 사용하는 일반적인 절차 J의 방법 B에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 433. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.06(br, 1H), 8.12(s, 1H), 7.99(m, 2H), 7.88(d, 2H), 7.46(d, 1H), 4.48(br, 1H), 및 3.63(s, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1699] 실시예 198:
- [1700] [1-메틸-6-(5-메틸-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1H-벤조이미다졸-2-일]-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민
- [1701] [1-메틸-6-(5-메틸-1H-1,2,4-트리아졸-3-일)-1H-벤조이미다졸-2-일]-(5-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민(112 mg)은 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시미드산 에틸 에스테르(218 mg) 및 아세트산 히드라지드(18 mg)를 사용하는 일반적인 절차 J의 방법 B에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 447. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 9.86(br, 1H), 9.65(s, 2H), 9.05(br, 1H), 8.92(m, 1H), 7.99(d, 1H), 7.88(s, 2H), 3.42(s, 3H), 및 1.81(s, 3H).
- [1702] 실시예 199:
- [1703] (1-에틸-5-트리플루오로메탄술포닐-1H-벤조이미다졸-2-일)-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민
- [1704] (1-에틸-5-트리플루오로메탄술포닐-1H-벤조이미다졸-2-일)-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민(399 mg)은 N1-에틸-4-트리플루오로메탄술포닐-벤젠-1,2-디아민(187 mg), 6-트리플루오로-메톡시-2-아미노-벤조티아졸(234 mg), 1,1'-티오카보닐-디이미다졸(213 mg), 및 EDC(287 mg)를 사용하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 512. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.12(br, 1H), 7.98(s, 1H), 7.88(m, 1H), 7.85(s, 1H), 7.46(br, 1H), 7.40(d, 2H), 4.12(q, 2H), 및 1.34(t, 3H).
- [1705] 실시예 200:
- [1706] 1-[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-에탄올
- [1707] 1-(4-메틸아미노-3-니트로-페닐)-에탄올(153 mg)은 DMF(5 mL) 중의 메틸 1-(4-플루오로-3-니트로-페닐)-에탄올(183 mg) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 1.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1708] 1-(3-아미노-4-메틸아미노-페닐)-에탄올(66 mg)은 1-(4-메틸아미노-3-니트로-페닐)-에탄올(97 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 10 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.

- [1709] 1-[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-일]-에탄온(69 mg)은 1-(3-아미노-4-메틸아미노-페닐)-에탄온(41 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(59 mg), 1,1'-티오카보닐다이미다졸(44 mg), 및 EDC(48 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 408.
- [1710] 실시예 201:
- [1711] (5-메탄술포닐-1-메틸-1H-벤조이미다졸-2-일)-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민
- [1712] (4-메탄술포닐-2-니트로-페닐)-메틸-아민(182 mg)은 DMF(5 mL) 중의 1-플루오로-4-메탄술포닐-2-니트로-벤젠(219 mg) 및 메틸아민(THF 중의 2 M, 1.0 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1713] 4-메탄술포닐-N1-메틸-벤젠-1,2-디아민(76 mg)은 (4-메탄술포닐-2-니트로-페닐)-메틸-아민(115 mg) 및 Pd/C(10 wt%, 10 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1714] (5-메탄술포닐-1-메틸-1H-벤조이미다졸-2-일)-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일)-아민(72 mg)은 4-메탄술포닐-N1-메틸-벤젠-1,2-디아민(50 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(59 mg), 1,1'-티오카보닐다이미다졸(44 mg), 및 EDC(48 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 444.
- [1715] 실시예 202:
- [1716] 2-[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-6-일]-아세트아미드
- [1717] 2-(3-메틸아미노-4-니트로-페닐)-아세트아미드(727.0 mg)는 메틸아민(THF 중의 2.0 M, 20 mL) 중의 2-(3-클로로-4-니트로-페닐)-아세트아미드(1.0 g)로 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1718] 2-(4-아미노-3-메틸아미노-페닐)-아세트아미드(554 mg)는 MeOH:EtOAc(1:1, 10.0 mL) 중의 2-(3-메틸아미노-4-니트로-페닐)-아세트아미드(727.0 mg) 및 Pd/C(20 wt%, 140.0 mg)로 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1719] 2-[3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-일]-아세트아미드(240 mg)는 DMF(6.0 mL) 중의 2-(4-아미노-3-메틸아미노-페닐)-아세트아미드(554 mg), 2-아미노-6-(트리플루오로메톡시)-벤조티아졸(600.0 mg), 1,1'-티오카보닐다이미다졸(600.0 mg), 및 EDC(600.0 mg)로 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 423.
- [1720] 표 1에 나타낸, 실시예 203 및 204는 하기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 203: 415.8. 실시예 204: 415.8.
- [1721] 실시예 205:
- [1722] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드
- [1723] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-2-히드록시-프로필)-아미드(30 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), (R)-1-아미노-프로판-2-올(70 mg), HBTU(200 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 449.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.44-8.41(t, 1H), 8.29(s, 1H), 8.12(s, 1H), 7.83-7.80(d, 1H), 7.71(s, 2H), 7.54-7.52(d, 1H), 3.84-3.80(m, 1H), 3.70(s, 3H), 3.25-3.22(m, 2H), 1.10-1.08(d, 3H), -NH 및 -OH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1724] 표 1에 나타낸, 실시예 206 내지 213는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 206: 449.7. 실시예 207: 443.8. 실시예 208: 477.7. 실시예 209: 403.7. 실시예 210: 437.7. 실시예 211: 446.4. 실시예 212: 460.0. 실시예 213: 412.0.
- [1725] 실시예 214:
- [1726] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-프로필)-아미드

- [1727] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (3-히드록시-프로필)-아미드(136 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(179 mg), 3-아미노-프로판-1-올(40 mg), HBTU(209 mg), 및 DIEA(200 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 415.5.
- [1728] 표 1에 나타낸, 실시예 215 내지 219는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 215: 429.9. 실시예 216: 465.7. 실시예 217: 495.0. 실시예 218: 444.9. 실시예 219: 479.6.
- [1729] 실시예 220:
- [1730] 2-(6-클로로-1H-벤조이미다졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
- [1731] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드(37 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), 4-아미노-부탄-1-올(20 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 429.6.
- [1732] 표 1에 나타낸, 실시예 221은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 463.8이다.
- [1733] 실시예 222:
- [1734] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드
- [1735] 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (4-히드록시-부틸)-아미드(44 mg)는 6-플루오로-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(50 mg), 4-아미노-1-부탄올(12 mg), HBTU(53 mg), 및 DIEA(31 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 의해 제조하였다. LC/MS: m/z 497.1. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.34(bs, 1H), 8.19(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.89-7.59(m, 2H), 7.58-7.40(m, 1H), 7.36(d, 1H), 4.44(s, 1H), 3.62(s, 3H), 3.49-3.39(m, 2H), 3.32-3.20(m, 2H), 1.67-1.36(m, 4H).
- [1736] 실시예 223:
- [1737] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-4-히드록시-3-메틸-부틸)-아미드
- [1738] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-4-히드록시-3-메틸-부틸)-아미드(45 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(80 mg), (R)-4-아미노-2-메틸-부탄-1-올(25 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493.6.
- [1739] 표 1에 나타낸, 실시예 224 및 225는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 224: 443.9. 실시예 225: 455.8.
- [1740] 실시예 226:
- [1741] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-펜틸)-아미드
- [1742] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (5-히드록시-펜틸)-아미드(59 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 5-아미노-1-펜타놀(21 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS m/z 495.0. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz) δ 12.38(bs, 1H), 8.53-8.33(m, 1H), 8.09(s, 1H), 7.91(s, 1H), 7.83-7.66(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.38(s, 1H), 3.64(s, 3H), 3.41(q, 2H), 3.27(q, 2H), 1.63-1.41(m, 4H), 1.41-1.28(m, 2H).
- [1743] 표 1에 나타낸, 실시예 227 내지 231은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의

관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 227: 443.8. 실시예 228: 477.9. 실시예 229: 523.1. 실시예 230: 513.5. 실시예 231: 543.6.

[1744] 실시예 232: 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실메틸)-아미드

[1745] 트랜스-4-아미노메틸-시클로헥산을 염산염(342 mg)은 트랜스-N-Boc-4-아미노메틸-시클로헥산을(500 mg) 및 염화수소(5.45 mL, 1,4-디옥산 중의 4.0 M 용액)를 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1746] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (트랜스-4-히드록시-시클로헥실메틸)-아미드(60 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 트랜스-4-아미노메틸-시클로헥산을 염산염(34 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 521.0. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.47-8.35(m, 1H), 8.08(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.80-7.65(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.49(s, 1H), 3.63(s, 3H), 3.11(t, 2H), 1.92-1.68(m, 3H), 1.66-1.18(m, 4H), 1.17-0.88(m, 3H).

[1747] 표 1에 나타낸, 실시예 233 및 234는 상기 기술된 실시예 232와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 233: 469.9. 실시예 234: 503.8.

[1748] 실시예 235:

[1749] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

[1750] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(72 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(92 mg), 2-(2-아미노에톡시)-에탄올(30 mg), HBTU(116 mg), 및 DIEA(67 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 446.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.47(t, 1H), 8.08(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.84-7.58(m, 2H), 7.48(d, 1H), 7.40(d, 1H), 4.63(t, 1H), 3.64(s, 3H), 3.56(t, 2H), 3.51(t, 2H), 3.49-3.41(m, 4H).

[1751] 실시예 236:

[1752] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

[1753] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(87 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-(2-아미노에톡시)-에탄올(30 mg), HBTU(116 mg), 및 DIEA(67 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 480.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.48(bs, 1H), 8.48(t, 1H), 8.27(s, 1H), 8.11(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.69(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.68(s, 3H), 3.57(t, 2H), 3.52(t, 2H), 3.49-3.41(m, 4H), -OH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1754] 표 1에 나타낸, 실시예 237 및 238은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 237: 514.7. 실시예 238: 496.7.

[1755] 표 1에 나타낸, 실시예 239는 하기 기술된 실시예 240과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 538.8이다.

[1756] 실시예 240:

[1757] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드 염산염

[1758] (2-{2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-5-[2-(2-히드록시-에톡시)-에틸카바모일]-벤조이미다졸-1-일}-에틸)-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(73 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸]-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(145 mg), 2-(2-아미노-에톡시)-에탄올(35

mg), HBTU(125 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

- [1759] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드 이염산염(60 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 (2-{2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-5-[2-(2-히드록시-에톡시)-에틸카바모일]-벤조이미다졸-1-일}-에틸)-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(73 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 488.5.
- [1760] 표 1에 나타낸, 실시예 241 내지 243은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 241: 539.4. 실시예 242: 510.0. 실시예 243: 459.9.
- [1761] 표 1에 나타낸, 실시예 244는 하기 기술된 실시예 245와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 510.7이다.
- [1762] 실시예 245:
- [1763] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-2-메틸-프로폭시)-에틸]-아미드
- [1764] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-2-메틸-프로폭시)-에틸]-아미드(5 mg)는 DMF 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-히드록시-에틸)-아미드(100 mg), 1,2-에폭시-2-메틸-프로판(19 mg), 및 KOH(19 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 X에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 524.7.
- [1765] 실시예 246:
- [1766] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-프로폭시)-에틸]-아미드
- [1767] 톨루엔-4-술폰산 3-벤질옥시-프로필에스테르(14.4 g)는 3-벤질옥시-1-프로판올(8.4 g), p-톨루엔염화술폰닐(12.52 g), 및 DMAP(84 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 V에 따라 제조하였다.
- [1768] 디벤질-[2-(3-벤질옥시-프로폭시)-에틸]-아민(860 mg)은 톨루엔-4-술폰산 3-벤질옥시-프로필에스테르(1.33 g), N,N-디벤질-2-아미노에탄올(1.0 g), 50% 수성 수산화나트륨 용액(1.66 mL 물 중의 1.66 g), 및 테트라부틸암모늄 수소 설페이트(141 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 W에 따라 제조하였다.
- [1769] 3-(2-아미노-에톡시)-프로판-1-올(229 mg)은 디벤질-[2-(3-벤질옥시-프로폭시)-에틸]-아민(860 mg) 및 Pd/C(86 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다.
- [1770] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-프로폭시)-에틸]-아미드(85 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), 3-(2-아미노-에톡시)-프로판-1-올(48 mg), HBTU(91 mg), 및 DIEA(52 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 510.0.
- [1771] 표 1에 나타낸, 실시예 247은 하기 기술된 실시예 249와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 513.1이다.
- [1772] 표 1에 나타낸, 실시예 248은 상기 기술된 실시예 246과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 459.9이다.
- [1773] 실시예 249:
- [1774] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸]-아미드
- [1775] 디벤질-[2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸]-아민(770 mg)은 디옥산(4.25 mL) 중의 디벤질-(2-클로로-에틸)-아민(1 g), 3-플루오로-프로판-1-올(295 mg), 50%(w/w) KOH 용액(4.25 mL) 및 브롬화테트라부틸암모늄(130 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 S에 따라 제조하였다.
- [1776] 2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸아민(94 mg)은 메탄올(1.5 mL) 중의 디벤질-[2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸]-아민(450 mg) 및 Pd-C(90 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 T에 따라 제조하였다.

- [1777] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸]-아미드(12 mg)는 DMF(800 μ L) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(55 mg), 2-(3-플루오로-프로폭시)-에틸아민(50 mg), HBTU(60 mg), 및 DIEA(50 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 463.0.
- [1778] 실시예 250:
- [1779] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [3-(2-히드록시-에톡시)-프로필]-아미드
- [1780] 톨루엔-4-술폰산 2-벤질옥시-에틸 에스테르(11.3 g)는 2-벤질옥시에탄올(9.57 g), p-톨루엔염화술포닐(16.73 g), 및 DMAP(96 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 V에 따라 제조하였다.
- [1781] 디벤질-[3-(2-벤질옥시-에톡시)-프로필]-아민(378 mg)은 톨루엔-4-술폰산 2-벤질옥시-에틸 에스테르(1.0 g), 3-디벤즈일아미노-프로판-1-올(1.08 g), 50% 수성 수산화나트륨 용액(1.3 mL 물 중의 1.3 g), 및 테트라부틸암모늄 수소 설페이트(111 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 W에 따라 제조하였다.
- [1782] 2-(3-아미노-프로폭시)-에탄올(49 mg)은 디벤질-[3-(2-벤질옥시-에톡시)-프로필]-아민(378 mg) 및 Pd/C(38 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다.
- [1783] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [3-(2-히드록시-에톡시)-프로필]-아미드(41 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), 2-(3-아미노-프로폭시)-에탄올(49 mg), HBTU(91 mg), 및 DIEA(52 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 509.8.
- [1784] 표 1에 나타낸, 실시예 251 내지 256은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 251: 528.9. 실시예 252: 529.0. 실시예 253: 535.0. 실시예 254: 535.1. 실시예 255: 485.0. 실시예 256: 539.5.
- [1785] 표 1에 나타낸, 실시예 257은 상기 기술된 실시예 47과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 481.8이다.
- [1786] 표 1에 나타낸, 실시예 258 및 259는 상기 기술된 실시예 249와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 258: 516.8. 실시예 259: 465.8.
- [1787] 실시예 260:
- [1788] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드
- [1789] 1-아지도-2-(2-메톡시-에톡시)-에탄(607 mg)은 1-브로모-2-(2-메톡시-에톡시)-에탄(1.0 g) 및 나트륨 아지드(1.07 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 U에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1790] 2-(2-메톡시-에톡시)-에틸아민(425 mg)은 1-아지도-2-(2-메톡시-에톡시)-에탄(607 mg) 및 10% Pd/C(60 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다. 미정제 생성물은 추가 정제 없이 다음 단계에 사용하였다.
- [1791] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메톡시-에톡시)-에틸]-아미드(44 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(75 mg), 2-(2-메톡시-에톡시)-에틸아민(24 mg), HBTU(84 mg), 및 DIEA(48 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 511.0. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.50(t, 1H), 8.10(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.74(d, 1H), 7.50(d, 1H), 7.36(d, 1H), 3.64(s, 3H), 3.59-3.53(m, 4H), 3.49-3.41(m, 4H), 3.25(s, 3H).
- [1792] 표 1에 나타낸, 실시예 261 및 262는 상기 기술된 실시예 260과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 261: 461.0. 실시예 262: 493.7.
- [1793] 표 1에 나타낸, 실시예 263 및 264는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 263: 520.8. 실시예 264: 520.8.

- [1794] 실시예 265:
- [1795] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1796] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-아미드(54 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), 3-(2-아미노-에톡시)-프로피오니트릴 염산염(60 mg), HBTU(91 mg), 및 DIEA(52 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 506.0.
- [1797] 실시예 266:
- [1798] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1799] [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-카르복산 tert-부틸 에스테르(430 mg)는 아크틸로니트릴(1.5 mL) 중의 (2-히드록시-에틸)-카르복산 tert-부틸 에스테르(320 mg)로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 50 $^{\circ}$ C에서 1시간 동안 가열하였다. 반응물을 에틸 아세테이트(20 mL) 및 물(20 mL)에 첨가하였다. 상을 분리하고, 수상을 에틸 아세테이트로 2번 추출하였다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과하였다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 헥산:에틸 아세테이트 구배를 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제하였다.
- [1800] 3-(2-아미노-에톡시)-프로피오니트릴 염산염(300 mg)은 에테르의 2M HCl (2 mL) 중의 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-카르복산 tert-부틸 에스테르(430 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.
- [1801] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-시아노-에톡시)-에틸]-아미드(60 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), 3-(2-아미노-에톡시)-프로피오니트릴 염산염(100 mg), HBTU(85 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 456.0.
- [1802] 실시예 267:
- [1803] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-카바모일메톡시-에틸)-아미드
- [1804] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-카바모일메톡시-에틸)-아미드(20 mg)는 DMF(20 mL) 중의 [2-(9H-플루오렌-9-일메톡시카보닐아미노)-에톡시]-아세트산(204 mg), HBTU(230 mg), DIEA(100 μ L) 및 Rink 아미드 수지(320 mg)로부터 시작하는 고체상 상에서 제조하였다. 반응물을 실온에서 1시간 동안 교반하고, 그 다음 DMF(3 \times 각각 20 mL)로 세척하였다. 그 다음 반응물을 DMF 중의 20%(v/v) 피페리딘(10 mL)과 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 DMF(3 \times 각각 20 mL)로 세척하였다. 다음 단계에서 반응물을 DMF(10 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(244 mg), HBTU(230 mg) 및 DIEA(100 μ L)와 실온에서 2시간 동안 교반하고, DMF(3 \times 각각 20 mL)로 세척하였다. 마지막 단계에서 반응물을 TFA(10 mL)와 30분 동안 교반하고, 그 다음 여과하였다. 여과액을 증발시키고, 미정제 화합물을 DCM 구배에서 DCM:10% 메탄올을 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제하였다. LC/MS: m/z 508.6.
- [1805] 실시예 268:
- [1806] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1807] [2-(2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-에톡시)-에틸]-카르복산 9H-플루오렌-9-일메틸 에스테르(106 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(80 mg), [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-카르복산 9H-플루오렌-9-일메틸 에스테르(80 mg), HBTU(95 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1808] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-아미드(70 mg)는 DMF(1.5 mL) 중의 [2-(2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-에톡시)-에틸]-카르복산 9H-플루오렌-9-일메틸 에스테르(106 mg), 20%(v/v)

피페리딘으로부터 시작하는 일반적인 절차 0에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 494.5.

- [1809] 표 1에 나타낸, 실시예 269 및 270은 상기 기술된 실시예 268과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 269: 444.7. 실시예 270: 445.7.
- [1810] 실시예 271:
- [1811] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드 염산염
- [1812] [2-(2-디벤즈일아미노-에톡시)-에틸]-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(200 mg)는 디옥산(1.8 mL) 중의 디벤질-(2-클로로-에틸)-아민(400 mg), (2-히드록시-에틸)-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(525 mg), 50%(w/w) KOH 용액(1.8 mL) 및 브롬화테트라부틸암모늄(57.7 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 S에 따라 제조하였다.
- [1813] [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(100 mg)는 메탄올(1.5 mL) 중의 [2-(2-디벤즈일아미노-에톡시)-에틸]-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(200 mg) 및 Pd-C(40 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 T에 따라 제조하였다.
- [1814] 메틸-[2-(2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-에톡시)-에틸]-카르바산 tert-부틸 에스테르(69 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(82 mg), [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(87 mg), HBTU(91 mg), 및 DIEA(52 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1815] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드 이염산염(53 mg)은 메틸-[2-(2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-에톡시)-에틸]-카르바산 tert-부틸 에스테르(60 mg) 및 염화수소(250 uL, 1,4-디옥산 중의 4.0 M 용액)를 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 509.0.
- [1816] 표 1에 나타낸, 실시예 272는 상기 기술된 실시예 271과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 458.9이다.
- [1817] 실시예 273:
- [1818] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1819] [2-(2-디벤즈일아미노-에톡시)-에틸]-디메틸-아민은 디옥산(3 mL) 중의 디벤질-(2-클로로-에틸)-아민(640 mg), 2-디메틸아미노-에탄올(325 mg), 50%(w/w) KOH 용액(3 mL) 및 브롬화테트라부틸암모늄(95 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 S에 따라 제조하였다.
- [1820] [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-디메틸-아민(100 mg)은 메탄올(1 mL) 중의 [2-(2-디벤즈일아미노-에톡시)-에틸]-디메틸-아민(430 mg) 및 Pd-C(86 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 T에 따라 제조하였다.
- [1821] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드(25 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(93 mg), [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-디메틸-아민(60 mg), HBTU(103 mg), 및 DIEA(59 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 523.0.
- [1822] 표 1에 나타낸, 실시예 274는 상기 기술된 실시예 273과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 473.0이다.
- [1823] 실시예 275:
- [1824] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아세틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1825] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아세틸아미노-에톡시)-에틸]-아미드(25 mg)는 DCM(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-아미드(50 mg), 염화아세틸(1-2 방울) 및 트리에틸아민(30 uL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 R에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 536.5.

- [1826] 실시예 276:
- [1827] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메탄술폰닐아미노-에톡시)-에틸]-아미드
- [1828] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-메탄술폰닐아미노-에톡시)-에틸]-아미드(22 mg)는 DCM(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-아미노-에톡시)-에틸]-아미드(50 mg), 메탄염화술폰(1-2 방울) 및 트리에틸아민(30 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 Q에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 572.4.
- [1829] 표 1에 나타낸, 실시예 277은 하기 기술된 실시예 278과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 477.7이다.
- [1830] 실시예 278:
- [1831] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에탄술폰닐)-에틸]-아미드
- [1832] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에틸술폰과닐)-에틸]-아미드(70 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), 2-(2-아미노-에틸술폰과닐)-에탄올(50 mg), HBTU(150 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1833] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에탄술폰닐)-에틸]-아미드(40 mg)는 DCM(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에틸술폰과닐)-에틸]-아미드(60 mg) 및 32 wt% 과아세트산 용액(100 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 M에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 493.8.
- [1834] 실시예 279:
- [1835] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에틸아미노)-에틸]-아미드 염산염
- [1836] N,N-디벤질-N'-(2-플루오로-에틸)-에탄-1,2-디아민(160 mg)은 DMF(2 mL) 중의 디벤질-(2-클로로-에틸)-아민(520 mg), 2-플루오로-에틸아민 염산염(250 mg), DIEA(900 μ L) 및 브롬화테트라부틸암모늄(60 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 S에 따라 제조하였다.
- [1837] (2-디벤즈일아미노-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(216 mg)는 DCM(1 mL) 중의 N,N-디벤질-N'-(2-플루오로-에틸)-에탄-1,2-디아민(160 mg), Boc₂O(146mg) 및 트리에틸아민(170 μ L)으로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 DCM 및 포화 중탄산나트륨 용액에 첨가하였다. 상을 분리하고, 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과하였다. 여과액을 증발시키고, 화합물을 추가 정제 없이 분리하였다.
- [1838] (2-아미노-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(95 mg)는 메탄올(1 mL) 중의 (2-디벤즈일아미노-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(216 mg) 및 Pd-C(40 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 T에 따라 제조하였다.
- [1839] (2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(70 mg)는 DMF(1.5 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), (2-아미노-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(90 mg), HBTU(100 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1840] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-플루오로-에틸아미노)-에틸]-아미드 이염산염(65 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 (2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-(2-플루오로-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(70 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 446.6.
- [1841] 표 1에 나타낸, 실시예 280 내지 284는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 280: 482.9. 실시예 281: 481.5. 실시예 282: 539.0. 실시예 283:

570.8. 실시예 284: 496.9.

[1842] 표 1에 나타낸, 실시예 285는 하기 기술된 실시예 286과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 479.6이다.

[1843] 실시예 286:

[1844] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

[1845] 3-메틸아미노-4-니트로-벤조산 에틸 에스테르(2.8 g)는 THF(15 mL) 및 DMF(15 mL) 중의 3-플루오로-4-니트로-벤조산 에틸 에스테르(3 g) 및 2 M 메틸아민으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.

[1846] 4-아미노-3-메틸아미노-벤조산 에틸 에스테르(2.1 g)는 메탄올(25 mL) 중의 3-메틸아미노-4-니트로-벤조산 에틸 에스테르(2.8 g) 및 Pd-C(560 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다.

[1847] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸 에스테르(2.8 g)는 DMF(30 mL) 중의 6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아민(2.9 g), 4-아미노-3-메틸아미노-벤조산 에틸 에스테르(2.1 g), thioCDI(2.2 g) 및 EDC(2.4 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.

[1848] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산(2.5 g)은 메탄올:THF(1:1, 12 mL) 중의 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸 에스테르(2.8 g) 및 2 N NaOH(6 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

[1849] 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(50 mg)는 DMF(1 mL) 중의 3-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산(80 mg), 2-(2-아미노-에톡시)-에탄올(24 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 495.5.

[1850] 표 1에 나타낸, 실시예 287은 하기 기술된 실시예 288과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 429.6이다.

[1851] 실시예 288:

[1852] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드

[1853] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸 에스테르(1.2 g)는 DMF(20 mL) 중의 6-클로로-벤조티아졸-2-일아민(1.2 g), 4-아미노-3-메틸아미노-벤조산 에틸 에스테르(1.2 g), thioCDI(1 g) 및 EDC(1.1 g)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.

[1854] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산(1 g)은 메탄올:THF(1:1, 20 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 에틸 에스테르(1.2 g) 및 2 N NaOH(5 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

[1855] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-히드록시-에톡시)-에틸]-아미드(40 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-3-메틸-3H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), 2-(2-아미노-에톡시)-에탄올(23 mg), HBTU(80 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 445.6.

[1856] 표 1에 나타낸, 실시예 289 내지 291은 상기 기술된 실시예 55와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 289: 476.6. 실시예 290: 426.6. 실시예 291: 426.5.

[1857] 실시예 292:

[1858] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-(2-히드록시-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1859] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-(2-히드록시-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드(25 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (R)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염(200 mg), 2-브로모-에탄올(50 μ L) 및 Cs₂CO₃(300mg)로부터 시작하여 제

조하였다. 반응물을 50 ℃에서 8시간 교반하였다. 반응물을 여과하고, 용리 시스템으로서 DCM:DCM 중의 10% 메탄올(100:0 내지 0:100)을 사용한 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여, 순수 생성물을 얻었다. LC/MS: m/z 470.6.

[1860] 실시예 293:

[1861] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(S)-1-(2-히드록시-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1862] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(S)-1-(2-히드록시-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드(20 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (S)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염(200 mg), 2-브로모-에탄올(50 μ L) 및 Cs_2CO_3 (300mg)로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 50 ℃에서 8시간 동안 가열하였다. 반응물을 여과하고, 용리 시스템으로서 DCM:DCM 중의 10% 메탄올(100:0 내지 0:100)을 사용한 실리카겔 크로마토그래피로 정제하여, 순수 생성물을 얻었다. LC/MS: m/z 470.8.

[1863] 실시예 294:

[1864] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1865] 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(400 mg)는 DMF(3 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(408 mg), 3-아미노-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(220 mg), HBTU(457 mg), 및 DIEA(350 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[1866] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피롤리딘-3-일아미드 이염산염(330 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(2 mL) 중의 3-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(400 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1867] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드(15 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피롤리딘-3-일아미드 이염산염(47 mg), (R)-2-메틸-옥시란(과량) 및 DIEA(35 μ L)를 사용하여 제조하였다. 반응물을 80 ℃에서 밤새도록 교반하였다. 순수 생성물을 용리 시스템으로서 DCM:DCM 중의 (10%) 메탄올(100:0 내지 0:100)을 사용한 실리카겔 크로마토그래피를 통해 분리하였다. LC/MS: m/z 534.6.

[1868] 실시예 295:

[1869] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로피오닐)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1870] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로피오닐)-피롤리딘-3-일]-아미드(20 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(50 mg), (R)-1-((R)-3-아미노-피롤리딘-1-일)-2-히드록시-프로판-1-온(100 mg), HBTU(150 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 498.6.

[1871] 실시예 296:

[1872] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1873] [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로피오닐)-피롤리딘-3-일]-카르바산 tert-부틸 에스테르(500 mg)는 DMF(4 mL) 중의 (R)-2-히드록시-프로피온산(200 mg), (R)-피롤리딘-3-일-카르바산 tert-부틸 에스테르(372 mg), HBTU(800 mg), 및 DIEA(400 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[1874] [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-카르바산 tert-부틸 에스테르(244 mg)는 THF(6 mL) 중의

[(R)-1-((R)-2-히드록시-프로피오닐)-피롤리딘-3-일]-카르복산 tert-부틸 에스테르(500 mg) 및 1 M 보란으로부터 제조하였다. 반응물을 실온에서 30분 동안 교반하고, 그 다음 50 °C에서 8시간 동안 교반하였다. 반응물을 메탄올(20 mL)에 첨가하였다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 DCM:메탄올 구배를 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제하였다.

[1875] (R)-1-((R)-3-아미노-피롤리딘-1-일)-프로판-2-올 이염산염(140 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(2 mL) 중의 [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-카르복산 tert-부틸 에스테르(244 mg) 및 DCM(2 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1876] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-((R)-2-히드록시-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드(20 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(60 mg), (R)-1-((R)-3-아미노-피롤리딘-1-일)-프로판-2-올(100 mg), HBTU(180 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 484.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.43(m, 1H), 8.08(s, 1H), 7.93-7.92(d, 1H), 7.75(br.m, 1H), 7.47-7.45(br.d, 1H), 7.40-7.37(m, 1H), 4.52-4.42(m, 2H), 3.77-3.73(m, 1H), 3.66(s, 3H), 2.92-2.78(m, 2H), 2.63-2.60(m, 2H), 2.46-2.43(m, 2H), 2.19-2.14(m, 1H), 1.86-1.78(m, 1H) 1.07-1.06(d, 3H), -NH 및 -OH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1877] 표 1에 나타낸, 실시예 297은 상기 기술된 실시예 296과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 518.7이다.

[1878] 실시예 298:

[1879] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-2-메틸-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1880] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-2-메틸-프로필)-피롤리딘-3-일]-아미드(16 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피롤리딘-3-일아미드 이염산염(47 mg), 2,2-디메틸-옥시란(과량) 및 DIEA(70 μ L)를 사용하여 제조하였다. 반응물을 80 °C에서 밤새도록 교반하였다. 순수 생성물을 용리 시스템으로서 DCM:DCM 중의 (10%) 메탄올(100:0 내지 0:100)을 사용한 실리카겔 크로마토그래피를 통해 분리하였다. LC/MS: m/z 548.7.

[1881] 표 1에 나타낸, 실시예 299는 상기 기술된 실시예 266과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 498.5이다.

[1882] 실시예 300:

[1883] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-메탄술폰닐아미노-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드

[1884] [2-(3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-일)-에틸]-카르복산 tert-부틸 에스테르(56 mg)는 DCM(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피롤리딘-3-일아미드 이염산염(84 mg), (2-옥소-에틸)-카르복산 tert-부틸 에스테르(40 mg), 및 Na(OAc) $_3$ BH(65mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다.

[1885] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-아미노-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드 삼염산염(46 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 [2-(3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-일)-에틸]-카르복산 tert-부틸 에스테르(56 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1886] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-메탄술폰닐아미노-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드(15 mg)는 DCM(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-아미노-에틸)-피롤리딘-3-일]-아미드 이염산염(46 mg), 메탄염화술폰(1-2 방울) 및 트리에틸아민(30 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 Q에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 547.6.

[1887] 실시예 301:

[1888] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-

피페리딘-4-일]-아미드

- [1889] 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(160 mg)는 DMF(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(180 mg), 4-아미노-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(150 mg), HBTU(200 mg), 및 DIEA(1.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1890] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 이염산염(150 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(2 mL) 중의 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(160 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.
- [1891] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페리딘-4-일]-아미드(52 mg)는 DCM(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 이염산염(145 mg), [1,4]디옥산-2,5-디올(55 mg), 및 Na(OAc)₃BH(95mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 528.6.
- [1892] 표 1에 나타낸, 실시예 302는 상기 기술된 실시예 55와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 454.5이다.
- [1893] 실시예 303:
- [1894] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페리딘-4-일메틸]-아미드
- [1895] 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(155 mg)는 DMF(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(150 mg), 4-아미노메틸-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(100 mg), HBTU(200 mg), 및 DIEA(1.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1896] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (피페리딘-4-일메틸)-아미드 이염산염(150 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(2 mL) 중의 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(155 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.
- [1897] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페리딘-4-일메틸]-아미드(35 mg)는 DCM(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (피페리딘-4-일메틸)-아미드 이염산염(135 mg), [1,4]디옥산-2,5-디올(65 mg), 및 Na(OAc)₃BH(95mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 498.5.
- [1898] 실시예 304:
- [1899] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페리딘-4-일메틸]-아미드
- [1900] 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(160 mg)는 DMF(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(180 mg), 4-아미노메틸-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(150 mg), HBTU(200 mg), 및 DIEA(1.2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1901] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (피페리딘-4-일메틸)-아미드 이염산염(145 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(2 mL) 중의 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-메틸)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(160 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.
- [1902] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-히드록시-에틸)-피페리딘-4-일메틸]-아미드(45 mg)는 DCM(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (피페리딘-4-일메틸)-아미드 이염산염(136 mg), [1,4]디옥산-2,5-디올(54 mg),

및 Na(OAc)₃BH(95mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 542.7.

[1903] 표 1에 나타낸, 실시예 305는 하기 기술된 실시예 306과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 520.6이다.

[1904] 실시예 306:

[1905] [2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-일]-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-메탄올

[1906] [2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-일]-[4-(2-히드록시-에틸)-피페라진-1-일]-메탄올(315 mg)은 DMF(3 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(358 mg), 2-피페라진-1-일-에탄올(143 mg), HBTU(419 mg), 및 DIEA(350 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 470.6.

[1907] 표 1에 나타낸, 실시예 307는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 533.5이다.

[1908] 표 1에 나타낸, 실시예 308는 하기 기술된 실시예 313과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 511.5이다.

[1909] 표 1에 나타낸, 실시예 309 및 310는 상기 기술된 실시예 55와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 309: 441.6. 실시예 310: 441.8.

[1910] 표 1에 나타낸, 실시예 311 및 312는 하기 기술된 실시예 313과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 311: 526.9. 실시예 312: 526.7.

[1911] 실시예 313:

[1912] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-디메틸아미노-아세틸)-피페리딘-4-일]-아미드

[1913] 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(800 mg)는 DMF(5 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(716 mg), 4-아미노-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(500 mg), HBTU(952 mg), 및 DIEA(700 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[1914] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 이염산염(750 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(5 mL) 중의 4-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피페리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(800 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1915] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [1-(2-디메틸아미노-아세틸)-피페리딘-4-일]-아미드(52 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 피페리딘-4-일아미드 이염산염(88 mg), 디메틸아미노-아세트산(26 mg), HBTU(95 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 525.5. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.40-8.38(d, 1H), 8.11(s, 1H), 7.96(m, 1H), 7.80-7.78(d, 1H), 7.55-7.50(m, 2H), 7.43-7.40(d, 1H), 4.43-4.25(m, 2H), 4.09-4.08(br.m, 1H), 3.68(s, 3H), 3.67-3.65(m, 1H), 3.57-3.50(m, 1H), 3.22-3.17(m, 1H), 2.93-2.82(m, 6H), 1.96-1.89(m, 2H), 1.59-1.46(m, 2H), 1.30-1.25(m, 1H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[1916] 표 1에 나타낸, 실시예 314 및 315는 상기 기술된 실시예 313과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 314: 539.7. 실시예 315: 583.7.

[1917] 실시예 316:

[1918] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-메틸-피롤리딘-3-일)-아미드

[1919] (R)-3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(55 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-

5-카르복시산(70 mg), (R)-3-아미노-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(45 mg), HBTU(95 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[1920] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (R)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염 (45 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 (R)-3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(55 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1921] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((R)-1-메틸-피롤리딘-3-일)-아미드 (42 mg)는 DCM(500 μ L) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (R)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염(51 mg), 37% 포름알데히드(500 μ L), 및 Na(OAc)₃BH(40mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 440.5.

[1922] 실시예 317:

[1923] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-피롤리딘-3-일)-아미드

[1924] (S)-3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(65 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(70 mg), (S)-3-아미노-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(46 mg), HBTU(95 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[1925] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (S)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염 (51 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 (S)-3-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-피롤리딘-1-카르복시산 tert-부틸 에스테르(65 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.

[1926] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-메틸-피롤리딘-3-일)-아미드 (35 mg)는 DCM(500 μ L) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (S)-피롤리딘-3-일아미드 이염산염(45 mg), 37% 포름알데히드(500 μ L), 및 Na(OAc)₃BH(32mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 440.7.

[1927] 표 1에 나타낸, 실시예 318 내지 321는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 318: 469.8. 실시예 319: 455.8. 실시예 320: 519.6. 실시예 321: 442.8.

[1928] 실시예 322:

[1929] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메탄술폰닐아미노-에틸)-아미드

[1930] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-메탄술폰닐아미노-에틸)-아미드(57 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 이염산염(75 mg), 메탄염화술폰(16 mg), 및 트리에틸아민(62 μ L)으로부터 시작하는 일반적인 절차 Q에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 529.6.

[1931] 실시예 323:

[1932] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드

[1933] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드(62 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 이염산염(60 mg), N,N-디메틸글리신 염산염(18 mg), HBTU(57 mg), 및 DIEA(33 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 536.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.37(bs, 1H), 8.48(s, 1H), 8.08(s, 1H), 8.04(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.80-7.65(m, 2H), 7.49(d, 1H), 7.37(d, 1H), 3.76-3.46(m, 5H), 2.97(s, 2H), 2.89(s, 2H), 2.25(s, 6H).

- [1934] 실시예 324:
- [1935] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드
- [1936] (2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(290 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(300 mg), (2-아미노-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(147 mg), HBTU(380 mg), 및 DIEA(219 μ L)를 사용하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1937] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 이염산염 (225 mg)은 (2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-에틸)-카르바산 tert-부틸 에스테르(250 mg) 및 염화수소(1.25 mL, 1,4-디옥산 중의 4.0 M 용액)를 사용하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다.
- [1938] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(2-디메틸아미노-아세틸아미노)-에틸]-아미드(64 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-아미노-에틸)-아미드 이염산염(75 mg), N,N-디메틸글리신 염산염(24 mg), HBTU(79 mg), 및 DIEA(46 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 486.9. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.64-8.44(m, 1H), 8.22(bs, 1H), 8.08(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.83-7.59(m, 2H), 7.55-7.45(m, 1H), 7.41(d, 1H), 3.79-3.56(m, 5H), 3.44-3.34(m, 2H), 3.20-3.09(m, 2H), 2.71(s, 6H).
- [1939] 표 1에 나타낸, 실시예 325 및 326은 상기 기술된 실시예 313과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 325: 508.0. 실시예 326: 524.0.
- [1940] 표 1에 나타낸, 실시예 327 내지 334는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 327: 502.9. 실시예 328: 501.5. 실시예 329: 518.5. 실시예 330: 519.6. 실시예 331: 483.7. 실시예 332: 527.7. 실시예 333: 519.0. 실시예 334: 468.9.
- [1941] 실시예 335:
- [1942] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4,4-디플루오로-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드
- [1943] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2,2-디메톡시-에틸)-아미드(700 mg)는 DMF(5 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(716 mg), 2,2-디메톡시-에틸아민(265 mg), HBTU(952 mg), 및 DIEA(700 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1944] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-에틸)-아미드(574 mg)는 4M HCl-디옥산(3 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2,2-디메톡시-에틸)-아미드(700 mg)로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 50 $^{\circ}\text{C}$ 에서 5시간 동안 가열하였다. 용매를 증발시켜, 미정제 생성물을 얻었다.
- [1945] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2(4,4-디플루오로-피페리딘-1-일)-에틸]-아미드(45 mg)는 DCM(2 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-옥소-에틸)-아미드(80 mg), 4,4-디플루오로-피페리딘(36 mg), 및 Na(OAc) $_3$ BH(65mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 504.5. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.97-8.88(m, 1H), 8.14-8.12(m, 1H), 7.97-7.96(m, 1H), 7.88-7.80(m, 1H), 7.56-7.52(m, 2H), 7.43-7.40(m, 1H), 4.08-4.05(m, 1H), 3.74-3.69(m, 7H), 3.57-3.47(m, 1H), 3.46-3.17(m, 3H), 2.46-2.43(m, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1946] 표 1에 나타낸, 실시예 336은 상기 기술된 실시예 335와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 504.7이다.
- [1947] 표 1에 나타낸, 실시예 337 및 338은 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관

찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 337: 534.0. 실시예 338: 483.8.

- [1948] 표 1에 나타낸, 실시예 339는 상기 기술된 실시예 55와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 469.9이다.
- [1949] 표 1에 나타낸, 실시예 340 내지 342는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 340: 470.8. 실시예 341: 504.7. 실시예 342: 568.8.
- [1950] 표 1에 나타낸, 실시예 343 내지 347은 상기 기술된 실시예 104와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 343: 401.8. 실시예 344: 464.9. 실시예 345: 414.8. 실시예 346: 478.9. 실시예 347: 428.8.
- [1951] 표 1에 나타낸, 실시예 348 내지 362는 상기 기술된 실시예 205와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 348: 492.4. 실시예 349: 442.6. 실시예 350: 476.6. 실시예 351: 520.5. 실시예 352: 470.5. 실시예 353: 504.5. 실시예 354: 468.5. 실시예 355: 547.5. 실시예 356: 497.5. 실시예 357: 531.4. 실시예 358: 534.9. 실시예 359: 484.9. 실시예 360: 534.4. 실시예 361: 564.8. 실시예 362: 593.0.
- [1952] 표 1에 나타낸, 실시예 363은 하기 기술된 실시예 364와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 422.7이다.
- [1953] 실시예 364:
- [1954] 2-(6-에톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
- [1955] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산(25 g)은 THF(100 mL) 중의 4-플루오로-3-니트로-벤조산(25 g) 및 2 M 메틸아민으로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.
- [1956] 4-메틸아미노-3-니트로-벤조일 클로라이드(4.3 g)는 염화티오닐(20 mL) 중의 4-메틸아미노-3-니트로-벤조산(4 g)으로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 80 °C에서 8시간 동안 가열하였다. 용매를 증발시켜 추가 정제 없이 순수 화합물을 분리하였다.
- [1957] (4-메틸아미노-3-니트로-벤조일아미노)-아세트산 tert-부틸 에스테르(1.2 g)는 DCM(10 mL) 중의 4-메틸아미노-3-니트로-벤조일 클로라이드(1 g), 아미노-아세트산 tert-부틸 에스테르(721 mg), 트리에틸아민(1.4 mL)으로부터 시작하여 제조하였다. 반응물을 0 °C에서 1시간 동안 교반하였다. 반응물을 DCM(50 mL) 및 포화 중탄산나트륨 용액(50 mL)에 첨가하였다. 상을 분리하고, 수상을 DCM으로 2번 추출하였다. 조합된 유기물을 황산나트륨으로 건조시키고, 그 다음 여과하였다. 용매를 증발시키고, 미정제 화합물을 DCM:메탄올 구배를 사용한 플래쉬 크로마토그래피에 의해 정제하였다.
- [1958] (4-메틸아미노-3-니트로-벤조일아미노)-아세트산(800 mg)은 4 M HCl-디옥산(2 mL) 및 DCM(2 mL) 중의 (4-메틸아미노-3-니트로-벤조일아미노)-아세트산 tert-부틸 에스테르(1.2 g)로부터 제조하였다. 반응물을 실온에서 8시간 동안 교반하였다. 용매를 증발시켜 어떤 추가 정제 없이 화합물을 분리하였다.
- [1959] N-디메틸카바모일메틸-4-메틸아미노-3-니트로-벤즈아미드(800 mg)는 DMF(2 mL) 중의 (4-메틸아미노-3-니트로-벤조일아미노)-아세트산(800 mg), THF 중의 2 M 디메틸아민(3 mL), HBTU(1.5 g), 및 DIEA(1.3 mL)으로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1960] 3-아미노-N-디메틸카바모일메틸-4-메틸아미노-벤즈아미드(700 mg)는 메탄올(10 mL) 중의 N-디메틸카바모일메틸-4-메틸아미노-3-니트로-벤즈아미드(800 mg) 및 Pd-C(160 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다.
- [1961] 2-(6-에톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(15 mg)는 DMF(3 mL) 중의 6-에톡시-벤조티아졸-2-일아민(100 mg), 3-아미노-N-디메틸카바모일메틸-4-메틸아미노-벤즈아미드(150 mg), thioCDI(150 mg) 및 EDC(150 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 452.6.
- [1962] 실시예 365:
- [1963] 2-(6-이소프로필-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
- [1964] 2-(6-이소프로필-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(12

mg)는 DMF(3 mL) 중의 6-이소프로필-벤조티아졸-2-일아민(150 mg), 3-아미노-N-디메틸카바모일메틸-4-메틸아미노-벤즈아미드(200 mg), thioCDI(200 mg) 및 EDC(200 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 450.6.

- [1965] 실시예 366:
- [1966] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드
- [1967] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드(24 mg)는 DMF(1 mL) 중의 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메톡시-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(80 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(40 mg), HBTU(95 mg), 및 DIEA(70 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 486.5. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.57-8.56(m, 1H), 8.11(s, 1H), 8.01-8.00(d, 1H), 7.84-7.82(m, 1H), 7.63-7.61(d, 1H), 7.57-7.54(d, 1H), 7.46-7.44(m, 1H), 4.43-4.40(t, 2H), 4.14-4.13(d, 2H), 3.75-3.72(t, 2H), 3.24(s, 3H), 3.04(s, 3H), 2.87(s, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [1968] 실시예 367:
- [1969] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드 염산염
- [1970] 4-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸아미노]-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1.7 g)는 THF(20 mL) 중의 4-클로로-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1 g), (2-아미노-에틸)-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(1.2 g) 및 DIEA(1.7 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 A에 따라 제조하였다.
- [1971] 3-아미노-4-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸아미노]-벤조산 메틸 에스테르(1.4 g)는 메탄올:EtOAc(1:1, 20 mL) 중의 4-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸아미노]-3-니트로-벤조산 메틸 에스테르(1.7 g) 및 Pd-C(350 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 B에 따라 제조하였다.
- [1972] 1-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸]-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.9 g)는 DMF(15 mL) 중의 6-클로로-벤조티아졸-2-일아민(920 mg), 3-아미노-4-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸아미노]-벤조산 메틸 에스테르(1.4 g), thioCDI(900 mg) 및 EDC(960 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 D에 따라 제조하였다.
- [1973] 1-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸]-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(1.7 g)은 메탄올:THF(1:1, 10 mL) 중의 1-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸]-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 메틸 에스테르(1.9 g) 및 2 N NaOH(5 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1974] {2-[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-5-(디메틸카바모일메틸-카바모일)-벤조이미다졸-1-일]-에틸}-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(70 mg)는 DMF(1 mL) 중의 1-[2-(tert-부톡시카보닐-메틸-아미노)-에틸]-2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(146 mg), 2-아미노-N,N-디메틸-아세트아미드(50 mg), HBTU(125 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1975] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-(2-메틸아미노-에틸)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 디메틸카바모일메틸-아미드 이염산염(60 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 중의 {2-[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-5-(디메틸카바모일메틸-카바모일)-벤조이미다졸-1-일]-에틸}-메틸-카르바산 tert-부틸 에스테르(70 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 485.5.
- [1976] 실시예 368:
- [1977] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-2-히드록시-에틸)-아미드
- [1978] (S)-3-히드록시-2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-프로피온산에틸 에스테르(213 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(200 mg), L-세린 에틸 에스테르 염산염(91 mg), HBTU(223 mg), 및 DIEA(128 μ L)로부터 시작

하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

- [1979] (S)-3-히드록시-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(152 mg)은 (S)-3-히드록시-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산에틸 에스테르(200 mg) 및 수산화리튬(64 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1980] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-2-히드록시-에틸)-아미드(68 mg)는 (S)-3-히드록시-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(50 mg), 디메틸아민(56 μ L, THF 중의 2 M), HBTU(46 mg), 및 DIEA(27 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 524.0.
- [1981] 실시예 369:
- [1982] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-5-아미노-1-디메틸카바모일-펜틸)-아미드 염산염
- [1983] (S)-6-tert-부톡시카보닐아미노-2-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-헥산산 메틸 에스테르(300 mg)는 DMF(2 mL) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(392 mg), (S)-2-아미노-6-tert-부톡시카보닐아미노-헥산산 메틸 에스테르(280 mg), HBTU(400 mg), 및 DIEA(400 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1984] (S)-6-tert-부톡시카보닐아미노-2-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-헥산산(260 mg)은 MeOH:THF(1:1, 2 mL) 중의 (S)-6-tert-부톡시카보닐아미노-2-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-헥산산 메틸 에스테르(300 mg) 및 2 N NaOH(2 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [1985] [(S)-5-디메틸카바모일-5-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-펜틸]-카르바산 tert-부틸 에스테르(200 mg)는 DMF(2 mL) 중의 (S)-6-tert-부톡시카보닐아미노-2-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-헥산산(260 mg), THF 중의 2 M 디메틸아민(1 mL), HBTU(400 mg), 및 DIEA(400 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [1986] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [((S)-5-아미노-1-디메틸카바모일-펜틸카바모일)-메틸]-아미드 이염산염(150 mg)은 디옥산 중의 4M HCl(1 mL) 및 DCM(2 mL) 중의 [(S)-5-디메틸카바모일-5-(2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸아미노)-펜틸]-카르바산 tert-부틸 에스테르(200 mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 L에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 547.8.
- [1987] 실시예 370:
- [1988] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-5-디메틸아미노-1-디메틸카바모일-펜틸)-아미드
- [1989] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [((S)-5-디메틸아미노-1-디메틸카바모일-펜틸카바모일)-메틸]-아미드(20 mg)는 DCM(1 mL) 및 DMF(500 μ L) 중의 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [((S)-5-아미노-1-디메틸카바모일-펜틸카바모일)-메틸]-아미드 이염산염(70 mg), 37% 포름알데히드 용액(500 μ L), 및 Na(OAc)₃BH(100mg)로부터 시작하는 일반적인 절차 P에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 575.7.
- [1990] 표 1에 나타낸, 실시예 371 내지 377은 상기 기술된 실시예 135와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 371: 456.6. 실시예 372: 490.6. 실시예 373: 498.7. 실시예 374: 532.7. 실시예 375: 545.5. 실시예 376: 471.9. 실시예 377: 526.8.
- [1991] 표 1에 나타낸, 실시예 378은 상기 기술된 실시예 83과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 484.8이다.
- [1992] 표 1에 나타낸, 실시예 379는 상기 기술된 실시예 135와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z

값은 512.7이다.

- [1993] 표 1에 나타낸, 실시예 380 내지 382는 하기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 380: 428.7. 실시예 381: 462.8. 실시예 382: 473.7.
- [1994] 표 1에 나타낸, 실시예 383은 상기 기술된 실시예 278과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 522.0이다.
- [1995] 표 1에 나타낸, 실시예 384 내지 386은 하기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 384: 485.7. 실시예 385: 499.8. 실시예 386: 512.8.
- [1996] 표 1에 나타낸, 실시예 387은 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 498.4이다.
- [1997] 표 1에 나타낸, 실시예 388은 상기 기술된 실시예 316과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 512.7이다.
- [1998] 표 1에 나타낸, 실시예 389 내지 393은 하기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 389: 570.6. 실시예 390: 524.1. 실시예 391: 473.7. 실시예 392: 554.0. 실시예 393: 513.8.
- [1999] 표 1에 나타낸, 실시예 394는 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 499.0이다.
- [2000] 표 1에 나타낸, 실시예 395는 하기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 512.7이다.
- [2001] 표 1에 나타낸, 실시예 396은 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 513.0이다.
- [2002] 표 1에 나타낸, 실시예 397 및 398은 하기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 397: 468.5. 실시예 398: 535.7.
- [2003] 실시예 399:
- [2004] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
- [2005] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(102 mg)는 {[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(100 mg), 3-피롤리딘올(23 mg), HBTU(109 mg), 및 DIEA(63 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 485.8. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 12.40(bs, 1H), 8.54(q, 1H), 8.11(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.82(d, 1H), 7.67(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.39(d, 1H), 5.04(d, 1H), 4.32(d, 1H), 4.15-3.97(m, 2H), 3.63(s, 3H), 3.62-3.51(m, 2H), 3.50-3.33(m, 2H), 2.05-1.70(m, 2H).
- [2006] 표 1에 나타낸, 실시예 400 내지 410은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 400: 484.7. 실시예 401: 484.7. 실시예 402: 518.7. 실시예 403: 518.7. 실시예 404: 529.8. 실시예 405: 529.8. 실시예 406: 549.7. 실시예 407: 551.8. 실시예 408: 498.7. 실시예 409: 498.7. 실시예 410: 532.7.
- [2007] 표 1에 나타낸, 실시예 411 내지 414는 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 411: 484.5. 실시예 412: 533.4. 실시예 413: 547.5. 실시예 414: 547.5.
- [2008] 실시예 415:
- [2009] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
- [2010] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(45 mg)는 DMF(1 mL) 중의 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아

졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(95 mg), 디메틸-(R)-피롤리딘-3-일-아민(20 mg), HBTU(85 mg), 및 DIEA(70 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 561.4.

- [2011] 실시예 416:
- [2012] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
- [2013] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-디메틸아미노-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(35 mg)는 DMF(1 mL) 중의 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(95 mg), 디메틸-(S)-피롤리딘-3-일-아민(20 mg), HBTU(85 mg), 및 DIEA(70 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 561.6. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.67-8.66(m, 1H), 8.12(s, 1H), 7.96(s, 1H), 7.84-7.82(d, 1H), 7.66-7.64(d, 1H), 7.55-7.53(d, 1H), 7.40-7.37(d, 1H), 4.09-4.07(m, 3H), 3.86-3.80(m, 2H), 3.69(s, 3H), 3.57(s, 2H), 2.82-2.78(m, 6H), 2.30-2.27(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.
- [2014] 표 1에 나타낸, 실시예 417 및 418은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 417: 512.8. 실시예 418: 512.9.
- [2015] 실시예 419:
- [2016] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-2-디메틸카바모일-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드
- [2017] (S)-1-(2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피롤리딘-2-카르복시산 메틸 에스테르(114 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), L-프롤린 메틸 에스테르 염산염(44 mg), HBTU(109 mg), 및 DIEA(63 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.
- [2018] (S)-1-(2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피롤리딘-2-카르복시산(54 mg)은 (S)-1-(2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피롤리딘-2-카르복시산 메틸 에스테르(90 mg) 및 수산화리튬(29 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.
- [2019] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-2-디메틸카바모일-피롤리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(23 mg)는 (S)-1-(2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-아세틸)-피롤리딘-2-카르복시산(33 mg), 디메틸아민(35 uL, THF 중의 2 M), HBTU(29 mg), 및 DIEA(17 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 540.7.
- [2020] 표 1에 나타낸, 실시예 420은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 535.7이다.
- [2021] 실시예 421:
- [2022] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드
- [2023] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-2-옥소-에틸)-아미드(75 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(100 mg), 2-아미노-1-모르폴리노-1-에탄올 염산염(56 mg), HBTU(127 mg), 및 DIEA(73 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 485.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.38(bs, 1H), 8.53(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.81(d, 1H), 7.67(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.40(d, 1H), 4.16(d, 2H), 3.64(s, 3H), 3.63-3.60(m, 2H), 3.58(t, 2H), 3.55-3.50(m, 2H), 3.50-3.45(m, 2H).
- [2024] 표 1에 나타낸, 실시예 422 내지 424는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 422: 518.7. 실시예 423: 501.6. 실시예 424: 533.8.
- [2025] 표 1에 나타낸, 실시예 425는 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z

값은 484.8이다.

[2026] 표 1에 나타낸, 실시예 426 내지 430은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 426: 498.7. 실시예 427: 531.7. 실시예 428: 543.8. 실시예 429: 562.7. 실시예 430: 591.8.

[2027] 실시예 431:

[2028] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2029] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(63 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(75 mg), 3-히드록시피페리딘(18 mg), HBTU(73 mg), 및 DIEA(42 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 549.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.53-8.42(m, 1H), 8.11(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.66(bs, 1H), 7.51(d, 1H), 7.37(d, 1H), 4.19-4.08(m, 4H), 3.75-3.60(m, 5H), 3.20(dd, 1H), 3.05(t, 1H), 2.01-1.95(m, 2H), 1.57-1.27(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2030] 표 1에 나타낸, 실시예 432 내지 434는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 432: 532.7. 실시예 433: 498.7. 실시예 434: 532.7.

[2031] 실시예 435:

[2032] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2033] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(65 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(75 mg), 4-히드록시피페리딘(18 mg), HBTU(73 mg), 및 DIEA(42 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 549.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.41(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.65(bs, 1H), 7.51(d, 1H), 7.37(d, 1H), 4.15(d, 2H), 3.98-3.89(m, 2H), 3.78-3.69(m, 2H), 3.68(s, 3H), 3.20(t, 1H), 3.04(t, 1H), 1.84-1.67(m, 2H), 1.45-1.20(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2034] 실시예 436:

[2035] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2036] {[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(513 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(500 mg), 글리신 메틸 에스테르 염산염(193 mg), HBTU(634 mg), 및 DIEA(364 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[2037] {[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(300 mg)은 {[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(493 mg) 및 수산화리튬(192 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

[2038] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(77 mg)는 {[2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(100 mg), 4-히드록시피페리딘(27 mg), HBTU(109 mg), 및 DIEA(63 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 499.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.48(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.92(s, 1H), 7.81(d, 1H), 7.67(d, 1H), 7.51(d, 1H), 7.39(d, 1H), 4.80(d, 1H), 4.15(d, 2H), 3.98-

3.88(m, 1H), 3.76-3.68(m, 2H), 3.63(s, 3H), 3.20(t, 1H), 3.05(t, 1H), 1.85-1.65(m, 2H), 1.46-1.20(m, 2H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2039] 표 1에 나타낸, 실시예 437 내지 439는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 437: 532.6. 실시예 438: 542.9. 실시예 439: 563.8.

[2040] 실시예 440:

[2041] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2042] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(3-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(72 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(75 mg), 3-피페리딘메탄올(20 mg), HBTU(73 mg), 및 DIEA(42 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 563.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.41(bs, 1H), 8.53-8.40(m, 1H), 8.10(s, 1H), 7.93(s, 1H), 7.87-7.60(m, 2H), 7.50(d, 1H), 7.36(d, 1H), 4.73-4.50(m, 1H), 4.43-4.01(m, 3H), 3.82(d, 1H), 3.67(s, 3H), 3.31-3.16(m, 2H), 3.06-2.87(m, 1H), 2.86-2.34(m, 1H), 1.82-1.41(m, 3H), 1.40-1.10(m, 2H).

[2043] 실시예 441:

[2044] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2045] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-(4-히드록시메틸-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(73 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(75 mg), 4-피페리딘메탄올(20 mg), HBTU(73 mg), 및 DIEA(42 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 563.8. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 8.48(t, 1H), 8.11(s, 1H), 7.94(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.67(bs, 1H), 7.51(d, 1H), 7.37(d, 1H), 4.37(d, 1H), 4.14(d, 2H), 3.92(d, 1H), 3.67(s, 3H), 3.27(d, 2H), 3.02(t, 1H), 2.58(t, 1H), 1.78-1.55(m, 3H), 1.20-0.90(m, 2H), -OH 및 -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2046] 표 1에 나타낸, 실시예 442 내지 444는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 442: 514.2. 실시예 443: 557.8. 실시예 444: 512.8.

[2047] 실시예 445:

[2048] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2049] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((S)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(77 mg)는 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(100 mg), (S)-3-메톡시-피페리딘 염산염(37 mg), HBTU(101 mg), 및 DIEA(58 uL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 546.7. ¹H NMR(DMSO-d₆, 400 MHz): δ 12.51(bs, 1H), 8.57-8.47(m, 1H), 8.26(s, 1H), 8.14(s, 1H), 7.89-7.66(m, 3H), 7.54(d, 1H), 4.33-4.15(m, 1H), 4.15-4.00(m, 1H), 3.81-3.56(m, 4H), 3.55-3.44(m, 1H), 3.43-3.18(m, 6H), 2.01-1.21(m, 4H).

[2050] 실시예 446:

[2051] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [2-((R)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2052] {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(5.0 g)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(5.0 g),

글리신 메틸 에스테르 염산염(1.76 g), HBTU(5.8 g), 및 DIEA(3.34 mL)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(4.22 g)은 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산 메틸 에스테르(5.0 g) 및 수산화리튬(1.81 g)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카복시산 [2-((R)-3-메톡시-피페리딘-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(30 mg)는 DMF(1 mL) 중의 {[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-아세트산(80 mg), (R)-3-메톡시-피페리딘(100 mg), HBTU(200 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 546.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.54-8.53(m, 1H), 8.28(s, 1H), 8.12(s, 1H), 7.83-7.81(d, 1H), 7.71(m, 2H), 7.56-7.54(d, 1H), 4.24-4.18(m, 1H), 4.12-4.08(m, 1H), 3.73-3.71(m, 1H), 3.70(s, 3H), 3.52-3.47(m, 1H), 3.38-3.34(m, 2H), 3.31-3.25(m, 4H), 1.88-1.81(m, 1H), 1.71-1.62(m, 1H), 1.45-1.36(m, 1H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

표 1에 나타낸, 실시예 447은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 576.5이다.

표 1에 나타낸, 실시예 448은 상기 기술된 실시예 47과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 566.2이다.

표 1에 나타낸, 실시예 449 내지 452는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 449: 600.5. 실시예 450: 557.6. 실시예 451: 575.5. 실시예 452: 626.4.

표 1에 나타낸, 실시예 453 및 454는 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 453: 561.5. 실시예 454: 513.0.

표 1에 나타난, 실시예 455 및 456은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 455: 575.4. 실시예 456: 526.7.

표 1에 나타낸, 실시예 457은 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 526.0이다.

표 1에 나타낸, 실시예 458 및 459는 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 458: 589.5. 실시예 459: 541.0.

표 1에 나타낸, 실시예 460은 상기 기술된 실시예 152와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 526.1이다.

표 1에 나타낸, 실시예 461은 상기 기술된 실시예 399와 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 540.7이다.

표 1에 나타낸, 실시예 462는 하기 기술된 실시예 463과 유사한 절차에 의해 만든다. 이 실시예의 관찰된 m/z 값은 456.7이다.

실시예 463:

1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드

(S)-2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-프로피온산 메틸 에스테르(863 mg)는 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카복시산 (750 mg), L-알라닌 메틸 에스테르 염산염(293 mg), HBTU(870 mg), 및 DIEA(500 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

(S)-2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-프로피온산 (743 mg)은 (S)-2-{[1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노}-프로피온산 (743 mg)은

노}-프로피온산 메틸 에스테르(850 mg) 및 수산화리튬(299 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

[2069] 1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 ((S)-1-디메틸카바모일-에틸)-아미드(25 mg)는 (S)-2-([1-메틸-2-(6-트리플루오로메틸-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(100 mg), 디메틸아민(119 μ L, THF 중의 2 M), HBTU(98 mg), 및 DIEA(57 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였고, 여기서 DIEA를 교반하고 있는 마지막 시약으로서 반응 혼합물에 천천히 첨가하는, 일반적인 절차 F의 변형이 있었다. LC/MS: m/z 490.6. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.56(d, 1H), 8.28(s, 1H), 8.13(s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.71(d, 2H), 7.53(d, 1H), 5.00-4.87(m, 1H), 3.70(s, 3H), 3.07(s, 3H), 2.86(s, 3H), 1.32(d, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2070] 표 1에 나타낸, 실시예 464 내지 468은 상기 기술된 실시예 463과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 464: 511.8. 실시예 465: 498.7. 실시예 466: 532.7. 실시예 467: 456.6. 실시예 468: 490.7.

[2071] 실시예 469:

[2072] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드

[2073] (R)-2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(508 mg)는 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산(500 mg), D-알라닌 메틸 에스테르 염산염(214 mg), HBTU(634 mg), 및 DIEA(364 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다.

[2074] (R)-2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(341 mg)은 (R)-2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산 메틸 에스테르(475 mg) 및 수산화리튬(180 mg)으로부터 시작하는 일반적인 절차 E에 따라 제조하였다.

[2075] 2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카르복시산 [(R)-1-메틸-2-(4-메틸-피페라진-1-일)-2-옥소-에틸]-아미드(20 mg)는 DMF(1 mL) 중의 (R)-2-([2-(6-클로로-벤조티아졸-2-일아미노)-1-메틸-1H-벤조이미다졸-5-카보닐]-아미노)-프로피온산(50 mg), 1-메틸-피페라진(50 mg), HBTU(150 mg), 및 DIEA(100 μ L)로부터 시작하는 일반적인 절차 F에 따라 제조하였다. LC/MS: m/z 511.7. ^1H NMR(DMSO- d_6 , 400 MHz): δ 8.82-8.67(m, 1H), 8.12(m, 1H), 7.97(s, 1H), 7.85-7.83(m, 1H), 7.56-7.52(m, 2H), 7.44-7.41(m, 1H), 5.02-4.96(m, 1H), 4.50-4.43(m, 1H), 4.35-4.19(m, 1H), 3.69(s, 3H), 3.62-3.51(m, 2H), 3.45(m, 1H), 3.28(m, 1H), 3.10(m, 1H), 2.78-2.77(d, 3H), 1.44-1.35(m, 3H), -NH 프로톤 신호가 관찰되지 않음.

[2076] 표 1에 나타낸, 실시예 470 내지 472는 상기 기술된 실시예 463과 유사한 절차에 의해 만든다. 이들 실시예의 관찰된 m/z 값은 다음과 같다. 실시예 470: 545.7. 실시예 471: 498.7. 실시예 472: 532.7.

[2077] 상기 472개의 실시예 각각의, 본 발명은 화합물의 유리산 또는 염기 및 유리산 또는 염기의 약학적으로 허용가능한 염을 포함하는 분리된 구체예를 제공한다. 이들 구체예 각각의, 본 발명은 (i) 화합물의 유리산 또는 염기 형태인 추가 구체예, 및 (ii) 화합물이 약학적으로 허용가능한 염 형태인 추가 구체예를 제공한다. 이들 구체예 중 어떤 것은 상기 기술된 약학적 조성물의 어떤 것을 만들기 위해 사용될 수 있고, 상기 기술된 치료 방법 또는 치료적 사용의 어떤 것에서 사용될 수도 있다.

[2078] 생물학적 어세이

[2079] 세포 배양. 정상 사람 섬유아세포(NHFL)를 Lonza로부터 얻었다. 세포 배양을, 2% 소태아혈청(FBS), 섬유아세포 성장 인자(hFGF-B) 0.5 mL, 인슐린 0.5 mL, 젠타마이신/아포테리신-B 0.5 mL로 보강된 섬유아세포 성장 배지(FGM-2)에서의, 37 °C에서 5% CO₂의 가습 분위기에서 유지하였다. 세포가 80% 컨플루언스(confluence)로 성장한 후, 처리하였다.

[2080] HMOX1 단백질 어세이. NHFL 세포가 80% 컨플루언스로 성장하고, HEPES로 한번 세척함으로써 수확하고, 그 다음 트립신화하였다. NHFL 세포의 동일한 수(2×10^3 개의 세포 / 웰)를 384 웰 optilux 조직 배양(BD) 플레이트에 넣었다. 세포를 FGM-2 배지에 밤새도록 배양한 뒤 화합물에 노출하였다. 세포를 부형제(DMSO) 또는 화합물(부형

제에 용해됨)로 16시간 동안 처리하였다. 세포를 1X PBS로 2번 세척하고 4% p-포름알데히드로 15분 동안 고정하였다. 그 다음 고정된 세포를 0.1% Triton X-100으로 침투시키고, 1X PBS 0.05% Tween-20 중의 5% BSA로 15분 동안 차단하였다. HO-1 항체(abcam)를 1% BSA 중의 1:300 희석으로 1X PBS에서 1시간 동안 면역염색하기 위해 사용하였다. 세포를 1X PBS로 2번 세척하고, 이차 항체 염소 항-마우스 Alexa 488을 1% BSA 중의 1:400 희석 (Invitrogen); Hoechst 1:2000(Invitrogen)으로 1X PBS로 1시간 동안 면역염색하였다. 플레이트를 1X PBS로 5번 세척하고, GE InCell 1000을 사용하여 Hoechst Ex.360 Em. 535; Alexa 488 Ex.480 Em. 535에서 읽었다. 결과는 GE InCell Analyzer 소프트웨어를 사용하여 분석하였다. 험옥시게나제 데이터는 상기 DMSO 처리된 세포의 배수 변화를 나타낸다.

[2081] 하기 표 2는 실시예 1 내지 472의 상기 DMSO의 배수 변화를 나타낸다. 일반적으로, 배수 표시 데이터는 5 μ M 농도(즉, 전체 부피에 대한 화합물의 μ mol, 여기서 용매는 약 99.2% 배지 및 0.8% DMSO)에 대해 보고된다. 일부 경우에서, 보고된 데이터는 3 μ M 농도의 경우로, 별표(*)에 의해 나타내었다.

표 2

[2082]

실시예 번호	HMOX1 배수 유도	실시예 번호	HMOX1 배수 유도
1	19.37	237	30.64
2	6.51	238	33.00
3	12.49	239	10.00*
4	11.94	240	35.42
5	8.33	241	23.66
6	9.45	242	28.05*
7	5.40	243	15.23*
8	18.32	244	28.03
9	11.16	245	33.15
10	19.89	246	76.46
11	25.0	247	28.30
12	16.16	248	58.71
13	20.09	249	31.19
14	22.0	250	25.12*
15	22.8	251	29.56
16	30.0	252	13.12
17	21.4	253	26.56
18	20.15	254	47.43
19	21.09	255	49.33
20	18.64	256	48.00
21	19.59	257	21.87
22	18.70	258	24.65
23	4.11	259	25.35*
24	20.66	260	27.12
25	27.15	261	35.68
26	15.49	262	40.00*
27	23.25	263	19.88
28	10.1	264	22.92
29	13.94	265	55.03
30	21.43	266	57.00
31	23.57	267	58.80
32	12.64	268	28.35
33	11.65	269	19.94*
34	15.44	270	14.61
35	12.36	271	69.86
36	13.8	272	86.54
37	16.4	273	25.27
38	18.0	274	65.90
39	18.2	275	77.38
40	11.8	276	61.20
41	33.3	277	38.27*
42	34.7	278	36.50*

43	29.6	279	89.23
44	12.1	280	38.78
45	12.5	281	35.61
46	17.9	282	51.74
47	11.3	283	30.24
48	15.8	284	47.38
49	23.1	285	55.89
50	11.1	286	61.15
51	9.9	287	49.29
52	10.0	288	47.00
53	20.1	289	44.56
54	18.5	290	22.54
55	4.5	291	17.04
56	16.1	292	39.03
57	32.0	293	29.39
58	32.8	294	29.42
59	49.8	295	29.00*
60	39.8	296	34.59*
61	12.1	297	24.35*
62	20.3	298	21.11
63	9.8	299	16.66
64	18.9	300	26.20
65	10.2	301	27.79
66	20.8	302	63.71
67	18.7	303	25.65
68	21.1	304	24.67
69	4.7	305	41.67
70	21.4	306	38.71
71	4.2	307	31.52
72	11.9	308	24.33
73	20.6	309	21.46
74	11.1	310	24.55
75	29.0	311	77.35
76	22.5	312	68.84
77	31.4	313	22.90
78	28.6	314	79.73
79	17.6	315	75.66
80	23.2	316	18.15
81	17.0	317	16.33
82	17.0	318	11.94
83	1.25	319	23.92
84	19.0	320	20.00
85	11.6	321	15.32*
86	9.7	322	35.99
87	12.1	323	112.89
88	13.0	324	27.89
89	23.7	325	32.38
90	8.1	326	34.26
91	10.1	327	31.94
92	3.4	328	29.38
93	11.3	329	52.23
94	1.2	330	37.67
95	11.2	331	70.08
96	12.0	332	55.85
97	19.2	333	14.47
98	13.8	334	13.38*
99	8.5	335	18.89
100	25.9	336	16.14

101	11.2	337	12.73*
102	22.6	338	13.58*
103	9.0	339	10.63*
104	16.3	340	14.40*
105	17.5	341	32.78*
106	23.8	342	36.81*
107	18.6	343	21.06
108	18.3	344	25.74*
109	20.9	345	26.44*
110	26.3	346	12.94*
111	17.6	347	15.34*
112	17.5	348	22.00*
113	27.6	349	29.00*
114	5.1	350	24.00*
115	1.5	351	25.00*
116	22.3	352	20.00*
117	28.8	353	23.00*
118	14.1	354	17.00*
119	22.1	355	26.00*
120	1.7	356	19.00*
121	29.6	357	22.00*
122	26.1	358	11.85*
123	12.7	359	17.37*
124	22.9	360	34.28
125	25.9	361	28.80
126	4.6	362	13.00
127	12.4	363	10.00
128	32.7	364	27.84*
129	31.0	365	20.05*
130	5.3	366	18.79
131	6.8	367	25.41
132	5.8	368	48.03
133	45.9	369	22.41*
134	54.5	370	19.27*
135	49.6	371	28.96*
136	5.7	372	25.50*
137	6.0	373	32.01*
138	11.0	374	34.21*
139	18.8	375	19.45*
140	19.3	376	19.09
141	23.1	377	20.33
142	15.2	378	24.92
143	22.4	379	21.70
144	7.3	380	29.98*
145	7.1	381	28.17*
146	3.7	382	20.56
147	1.8	383	16.40
148	12.0	384	26.01
149	38.7	385	24.52
150	41.6	386	58.28
151	41.3	387	19.90
152	15.0	388	21.98
153	4.0	389	38.56
154	27.1	390	46.35
155	24.3	391	38.65
156	21.0	392	24.86
157	22.1	393	61.30
158	1.7	394	37.58

159	26.7	395	72.02
160	22.9	396	36.00
161	19.1	397	25.00*
162	--	398	31.70
163	26.3	399	20.83
164	20.5	400	15.00*
165	17.9	401	27.00*
166	22.4	402	23.99*
167	24.2	403	24.84*
168	21.9	404	26.14
169	24.4	405	21.37
170	23.0	406	31.02
171	22.8	407	7.73
172	21.4	408	25.00*
173	21.4	409	29.00*
174	26.2	410	24.69*
175	28.7	411	16.03
176	25.8	412	47.58
177	30.3	413	31.81
178	25.7	414	25.66
179	24.4	415	74.76
180	12.4	416	96.58
181	23.0	417	62.81
182	13.0	418	63.33
183	--	419	28.03
184	9.5	420	32.96
185	11.2	421	32.19
186	20.2	422	25.01*
187	18.4	423	30.20
188	18.3	424	24.93
189	24.6	425	20.31
190	23.4	426	25.06
191	33.8	427	17.02*
192	28.8	428	24.35
193	11.1	429	21.39
194	6.0	430	22.68
195	4.4	431	49.44
196	11.4	432	27.30*
197	18.0	433	29.00*
198	12	434	34.56*
199	1.5	435	30.22
200	22.9	436	29.26
201	26.5	437	47.08*
202	15.6	438	25.91
203	18.69*	439	84.18
204	19.33*	440	28.18
205	33.08*	441	73.59
206	27.00*	442	34.92
207	11.85*	443	39.76
208	26.50*	444	32.00*
209	14.21*	445	36.43*
210	29.92*	446	31.28*
211	46.15	447	58.35
212	48.81	448	36.74
213	48.56	449	22.97
214	42.36	450	51.05*
215	16.00*	451	51.29
216	31.60*	452	71.66

217	20.72	453	81.11
218	39.16	454	62.24
219	39.99	455	80.42
220	61.89	456	67.35
221	26.00*	457	39.92
222	49.93	458	68.49
223	44.74	459	41.98
224	15.51*	460	27.54
225	17.67*	461	27.11
226	23.32	462	20.02*
227	14.03*	463	26.67*
228	26.00*	464	27.17*
229	14.43	465	20.37*
230	29.79	466	22.38*
231	30.24	467	22.31*
232	32.95	468	26.33*
233	28.00*	469	26.08*
234	30.90*	470	24.52*
235	37.73	471	17.36*
236	45.74	472	22.98*

【심사관 직권보정사항】

【직권보정 1】

【보정항목】 청구범위

【보정세부항목】 청구항 제19항

【변경전】

제 1항에 있어서, 6-메톡시-1-메틸-2-(6-트리플루오로메톡시-벤조티아졸-2-일아미노)-1H-벤조이미다졸 -5-카르복시산 (2-모르폴린-4-일-에틸)-아미드 또는 그것의 약학적으로 허용가능한 염.

【변경후】

삭제