

**(19) 대한민국특허청(KR)**  
**(12) 공개특허공보(A)**

(51) . Int. Cl.<sup>7</sup>

C07D 277/46  
C07D 213/55  
A61P 3/10

(11) 공개번호 10-2005-0121732  
(43) 공개일자 2005년12월27일

(21) 출원번호 10-2005-7019661  
(22) 출원일자 2005년10월14일  
번역문 제출일자 2005년10월14일  
(86) 국제출원번호 PCT/US2004/011650  
국제출원일자 2004년04월14일

(87) 국제공개번호 WO 2004/092146  
국제공개일자 2004년10월28일

(30) 우선권주장 60/463,102 2003년04월14일 미국(US)

(71) 출원인 디 인스티튜트스 포 파마슈티컬 디스커버리, 엘엘씨  
미국 코네티컷 브랜포드 비지니스 파크 드라이브 23 (우:06405)

(72) 발명자 반 잔트, 마이클, 씨.  
미국 06437 코네티컷 길포드 골든 힐 드라이브 91  
광, 하이쿠안  
미국 06443 코네티컷 매디슨 카운티 로드 304  
후, 샤오정  
미국 06514 코네티컷 할덴 유닛 121 믹스 애브뉴 900  
화이트하우스, 대런  
미국 06498 코네티컷 웨스트브룩 피싱 브룩 로드 40

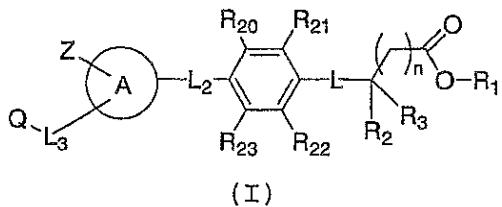
(74) 대리인 남상선

**심사청구 : 없음**

(54) 당뇨병 치료를 위한 N-((((1,3-티아졸-2-일)아미노)카르보닐)페닐)솔포닐)페닐알라닌 유도체 및 관련 화합물

**요약**

본 발명은 인슐린 내성 또는 고혈당증에 관련된 대사 장애의 치료에 유용한 화학식(I)의 화합물 및 이의 약제학적 허용염에 관한 것이다. 이러한 화합물은 당뇨병 및 다른 단백질 티로신 포스파타아제(PTP-1B) 매개 질병, 예를 들어 암, 신경퇴행성 질환 등의 치료에 유용한 PTP-1B의 억제제를 포함한다. 본 발명의 화합물은 또한 약제조성을 및 상기 질환을 치료하는 방법에 유용하다:



## 명세서

### 발명의 상세한 설명

#### 발명의 배경

#### 발명의 분야

본 발명은 당뇨병 치료에 유용한 치환된 페닐알칸산에 관한 것이다. 보다 상세하게는, 인슐린 신호화 경로의 네거티브 조절인자인 단백질 티로신 포스파타제-1B(PTP-1B)를 억제할 수 있고, 인슐린 감수성을 개선하는 화합물에 관한 것이다.

#### 관련 기술의 설명

단백질 티로신 포스파타제는 다양한 조절 과정에 관련되는 기질을 탈인산화하는 막이동(transmembrane) 또는 세포내 효소 패밀리이다(Fischer et al., 1991, Science 253: 401-406). 단백질 티로신 포스파타제-1B(PTP-1B)는 약 50 kd의 세포내 단백질로서, 다양한 사람 조직에 다양으로 존재한다(Charbonneau et al., 1989, Proc. Natl. Acad. Sci. USA 86: 5252-5256; Goldstein, 1993, Receptor 3: 1-15).

어떠한 단백질이 PTP-1B의 기질인가를 결정하는 것은 상당한 관심사였다. 특히 관심을 불러일으켰던 기질이 인슐린 수용체이다. 인슐린 수용체에 대한 인슐린의 결합은 도메인의 자동인산화를 초래한다. 이것은 인슐린 수용체 티로신 키나제의 활성화를 초래하여, 다양한 인슐린 수용체 기질(IRS) 단백질을 인산화시키고 인슐린 신호화 이벤트를 다운스트림으로 더욱 전개시켜 인슐린의 다양한 생물학적 작용을 매개한다.

실리 등(Seely et al., 1996, Diabetes 45: 1379-1385 ("실리"))은 시험관내에서 PTP-1B와 인슐린 수용체의 관계를 연구하였다. 실리는 PTP-1B 촉매 도메인에 점 돌연변이를 가진 PTP-1B의 글루타티온 S-트랜스페라제(GST) 융합 단백질을 제작하였다. 이 융합 단백질은 촉매적으로 불활성이지만, 인슐린 수용체와 결합할 수 있었고, 이는 인슐린 수용체를 발현하는 세포로부터 유래되는 전세포 용해물로부터 그리고 정제된 수용체 제조물로부터 인슐린 수용체를 침전시키는 능력에 의해 입증되었다.

아마드 등(Ahmad et al. , 1995, J. Biol. Chem. 270: 20503-20508)은 래트 KRC-7 간종양 세포에 PTP-1B 중화 항체를 도입하기 위해 삼투적 로딩을 이용하였다. 간종양 세포내의 항체의 존재는 인슐린 자극된 DNA 합성 및 포스파티딜이노시톨 3' 키나아제 활성을 각각 42% 및 38% 증가시켰다. 인슐린 수용체 자동인산화 및 인슐린 수용체 기질-1 티로신 인산화는 항체 로딩 세포에서 각각 2.2배 및 2.0배로 증가하였다. 항체 로딩 세포는 또한 외인성 웨პ티드 기질에 대한 인슐린 자극된 인슐린 수용체 키나아제 활성을 있어서 57% 증가를 나타내었다.

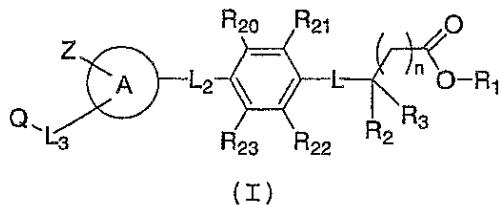
케네디 등(Kennedy et al. , 1999, Science 283: 1544-1548)은 단백질 티로신 포스파타제 PTP-1B가 인슐린 신호화 경로의 네거티브 조절인자라는 것을 입증하였고, 이는 이 효소의 억제제가 인슐린 수용체 자체의 구조적 결함이라기 보다는 인슐린 신호 변환 초기 과정의 결함과 관련되는 것으로 보이는 타입 2 당뇨병의 치료에 유익하다는 것을 의미한다(J. M. Olefsky, W. T. Garvey, R. R. Henry, D. Brillon, S. Matthei and G. R. Freidenberg, G. R. (1988). ) 인슐린 비의존성 (타입 II) 당뇨병에서 인슐린 내성의 세포 메카니즘 (Am. J. Med. 85: Suppl. 5A, 86-105. ) 인슐린 감수성을 개선시킨 약제는, 인슐린 내성을 경감시키지 않지만, 대신 인슐린 분비를 증가시킴에 의해 보상작용을 하는 설포닐우레아를 사용한 NIDDM의 전통적인 치료법에 비해 여러가지 장점을 가질 것이다.

따라서, PTP-1B의 억제제는 필요한 환자에서 타입 2 당뇨병의 조절, 글루코오스 내성의 개선, 및 인슐린 감수성의 개선에 유용하다. 또한 화합물은 다른 PTP-1B 매개 질환의 치료 또는 조절, 예를 들어 암, 신경퇴행성 질환 등의 치료에 유용하다.

### 발명의 요약

광범위한 한 측면에서, 본 발명은 하기 화학식(I)의 화합물, 상기 화합물을 포함하는 약제 조성물, 및 당뇨병 치료에 이러한 화합물 및 조성물을 사용하는 방법을 포함한다.

한 측면에서, 본 발명은 하기 화학식 (I) 및 이의 약제학적으로 허용되는 염을 포함한다:



상기 식에서,

n은 0, 1, 2, 또는 3이고;

각 R<sub>1</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐이며;

R<sub>2</sub>는 폐닐, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH<sub>2</sub>, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-S(O)<sub>b</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)히드록시알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-헵테로시클로알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-헵테로아릴이고, 여기서 헵테로시클로알킬기는 폐닐 고리에 임의적으로 융합되며(여기서, 헵테로시클로알킬 부분, 폐닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다), b는 0, 1, 또는 2이고;

R<sub>3</sub>는 H 또는 -CO<sub>2</sub>R<sub>1</sub>이며,

R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub>, 및 R<sub>23</sub>은 독립적으로 H, 아릴알콕시, 아릴알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, NH-아릴, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O)아릴, -NHC(O)아릴, NH아릴알킬, NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-아릴, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-아릴, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-아릴, -NHSO<sub>2</sub>-아릴, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)SO<sub>2</sub>아릴, 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)아릴알킬로부터 선택되며, 여기서 아릴기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환되고;

L은 -SO<sub>2</sub>NH-, -SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -NHSO<sub>2</sub>-, -O-, -C(O)NH-, -C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -SO<sub>2</sub>-, -C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)-, -NH-, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-이며, 여기서 알킬기는 폐닐로 임의적으로 치환되며(여기서, 폐닐은 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

L<sub>2</sub>는 결합 또는 -C(O)NR<sub>9</sub>-, -N(R<sub>9</sub>)C(O)-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NR<sub>9</sub>-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-, -C(O)N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -N(R<sub>9</sub>)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -N(R<sub>9</sub>)SO<sub>2</sub>-, -SO<sub>2</sub>N(R<sub>9</sub>)-, -N(R<sub>9</sub>)-, -N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬-, -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬-O-, 또는 -

(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-N(R<sub>9</sub>)-이며, 여기서 R<sub>9</sub>는 H, 또는 CO<sub>2</sub>H, -SO<sub>2</sub>아릴, 아릴알킬로 임의적으로 치환된 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬이고(여기서, 아릴기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알킬, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

L<sub>3</sub>는 결합, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-O-, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, -알케닐-, C(O)이며;

A 고리는 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 푸라닐, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 피리딜, 퀴놀리닐, 나프틸, 퀴나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 트리아졸릴이며, 이들 고리 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, CN, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 임의적으로 치환되고;

Q는 H, 아릴, -아릴-카르보닐-아릴, -아릴-알킬-아릴, -아릴-헵테로아릴, -아릴-헵테로시클로알킬, -헵테로아릴, -헵테로아릴-알킬-아릴, -헵테로시클로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는 알콕시카르보닐이며, 여기서 고리기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 임의적으로 치환되고(여기서, R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 아릴(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 알카노일, 아릴알카노일, 알콕시카르보닐, 아릴알콕시카르보닐, 헵테로아릴카르보닐, 헵테로아릴, 헵테로시클로알킬카르보닐, -C(O)NH<sub>2</sub>, -C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, -C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 -SO<sub>2</sub>-아릴이며, 여기서 고리기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 할로알킬 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

Z는 부재하거나, H, -NHC(O)아릴, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O)아릴, 또는 페닐이거나(여기서, 페닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시, 또는 NO<sub>2</sub>인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 임의적으로 치환된다), Z는 -NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬이며;

단, L<sub>2</sub>가 결합인 경우 A 고리는 페닐이 아니다.

화학식(I)의 화합물은 PTP-1B와 결합한다. 바람직하게는, 상기 상호작용은 상기 효소의 억제를 초래한다.

본 발명은 또한 본 발명의 화합물의 제조에 유용한 중간체를 포함한다.

본 발명은 또한 화학식(I)의 화합물 또는 이의 염 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체, 용매, 보조제 또는 희석제를 포함하는 약제 조성물을 제공한다.

본 발명은 화학식(I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 화학식(I)의 화합물 또는 이의 염을 포함하는 약제 조성물을 투여하는 것을 포함하여 질병의 치료가 필요한 환자의 질병을 치료하는 방법을 추가로 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 치료학적 유효량의 화학식(I)의 화합물을 투여하는 것을 포함하여 단백질 티로신 포스파타제를 억제하는 방법을 제공한다.

다른 측면에서, 본 발명은 치료학적 유효량의 화학식(I)의 화합물을 투여하는 것을 포함하여 인슐린 내성 또는 고혈당증과 관련된 대사장애를 치료하는 방법을 제공한다.

본 발명은 또한 화학식(I)의 화합물 또는 이의 염을 약제 제조에 사용하는 것을 제공한다.

본 발명은 또한 본 발명의 화합물을 제조하는 방법 및 이러한 방법에 사용되는 중간체를 제공한다.

본 발명은 또한 타입 I 및 타입 II 당뇨병의 조합 치료를 위한 방법 및 조성물을 제공한다. 이러한 구체예에서, 본 발명은 제형 및 약제 조성물 및 화학식 (I)의 PTPase 억제제와 이하에서 상세하게 개시되는 화합물 및 의약으로 타입 I 및 II 당뇨병을 치료하는 방법을 제공한다. 이러한 구체예에서, 본 발명의 방법은 화학식(I)의 PTPase 억제제가 치료학적 유효량의 추

가의 화합물 및 의약과 함께 제형화되어 있는 것을 특징으로 하는 타입 I 및 타입 II 당뇨병을 치료하는 방법을 포함할 수 있다. 대안적인 구체예에서, 본 발명의 타입 I 및 타입 II 당뇨병 치료 방법은 본원에 기재된 화학식(I)의 PTPase 억제제를 치료학적 유효량의 추가의 화합물 및 의약과 동반하여, 동시에 또는 함께 투여하는 것을 포함한다.

### 발명의 상세한 설명

화학식(I)의 화합물의 바람직한 부류는 화학식(I-1)의 화합물이며, 상기 식에서,

R<sub>1</sub>은 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 벤질, 또는 알릴이고;

R<sub>2</sub>는 폐닐, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH<sub>2</sub>, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-S(O)<sub>b</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)히드록시알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-피리디닐, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-피페리디닐, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-피롤리디닐, 또는 -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-테트라히드로푸라닐이며, 여기서 혼테로시클로알킬기는 폐닐 고리에 임의적으로 융합되고(여기서, 상기 혼테로시클로알킬 부분, 폐닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4 개의 기로 임의적으로 치환된다), b는 0, 1, 또는 2이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 피리미딜, 또는 트리아졸릴이며, 이들 고리 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 임의적으로 치환되고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, -폐닐-카르보닐-폐닐, -폐닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-폐닐, -폐닐-피리딜, -폐닐-피리미딜, -폐닐-옥사졸릴, -폐닐-티아졸릴, -폐닐-이미다졸릴, -폐닐-피롤릴, -폐닐-피페리디닐, -폐닐-피롤리디닐, -폐닐-피페라지닐, -폐닐-모르폴리닐, -폐닐-티오모르폴리닐, -폐닐-티오모르폴리닐 디옥사이드, -폐닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 벤조푸라닐, 벤조티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-폐닐, -피리미딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-폐닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 디벤조푸라닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라히드로푸라닐, 테트라히드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐이며, 여기서 고리기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 폐닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 임의적으로 치환되고(여기서, R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피리딜, 피리미딜, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐, -C(O)NH<sub>2</sub>, -C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, -C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 SO<sub>2</sub>-폐닐이고, 여기서 고리기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

Z는 H, 부재, -NHC(O)폐닐, -NHC(O)나프틸, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O)폐닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O)나프틸, 나프틸, 또는 폐닐이거나(여기서, 폐닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시, 또는 NO<sub>2</sub>인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 임의적으로 치환된다),

Z는 -NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬, 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬이다.

화학식(I)의 특히 바람직한 화합물은 R<sub>1</sub>이 H인 화합물들이다. R<sub>1</sub>기가 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 벤질 및 알릴인 화학식(I)의 화합물은 중간체로서 바람직하다.

화학식(I-1)의 바람직한 화합물은 화학식(I-2)의 화합물을 포함하며, 상기식에서,

L은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)-,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-이고, 여기서 알킬기는 페닐로 임의적으로 치환되고(여기서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

$L_2$ 는 결합이거나,  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)NR<sub>9</sub>-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)-이고, 여기서 R<sub>9</sub>는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 나프틸( $C_1-C_4$ )알킬, 안트라세닐( $C_1-C_4$ )알킬이며(여기서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다);

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-C(O)-$ 이고;

R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub>, 및 R<sub>23</sub>은 독립적으로 H, 페닐( $C_1-C_4$ )알콕시, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐,  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2$ -페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-SO<sub>2</sub>페닐, NH벤질, 또는  $-N(C_1-C_6)$ 알킬벤질으로부터 선택되고, 여기서 페닐 및 나프틸기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 임의적으로 치환된다.

바람직한 화학식(I-2)의 화합물에는 기 정의가 이하 기재된 바와 같은 화학식(I-3)의 화합물이 포함된다:

L은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-이며, 상기 정의에서, 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)NR<sub>9</sub>-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)-이고, 상기 정의에서, R<sub>9</sub>는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬이며, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-C(O)-$ 이고;

R<sub>1</sub>은 H,  $C_1-C_6$  알킬, 벤질 또는 알릴이며;

R<sub>2</sub>는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-C(O)NH<sub>2</sub>,  $-(C_1-C_4)$  알킬-C(O)NH( $C_1-C_4$ )알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-C(O)N( $C_1-C_4$ )알킬( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-S(O)<sub>b</sub>-( $C_1-C_4$ )알킬, ( $C_1-C_4$ ) 히드록시알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-페리디닐, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬-페롤리디닐이고, 상기 정의에서, 헤테로시클로알킬기는 페닐 고리에 융합되거나 융합되지 않고, 헤�테로시클로알킬 부분, 페닐 부분, 또는 이들 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-$  ( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며; 상기 정의에서, b는 0, 1, 또는 2이고;

R<sub>3</sub>은 H이며;

R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub> 및 R<sub>23</sub>은 H, 페닐 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알콕시, 페닐 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, NH-페닐, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, NH벤질, 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬벤질로부터 독립적으로 선택되고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

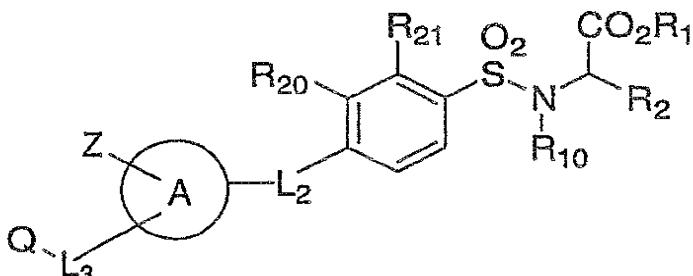
A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 피리미딜, 또는 트리아졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1 또는 2개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-카르보닐-페닐, -페닐-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, -페닐-피리딜, -페닐-피리미딜, -페닐-피롤릴, -페닐-피페리디닐, -페닐-피롤리디닐, -페닐-피페라지닐, -페닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, 이미다졸리디닐, 디벤조푸라닐, 테트라히드로푸라닐, 테트라히드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐이고, 여기서, 상기 정의된 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 4 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며; 상기 정의에서, R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐이고, 상기 정의에서, 시클릭기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며,

Z는 부재하거나, H, -NHC(O)페닐, -NHC(O)나프틸, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)페닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)나프틸, 나프틸, 또는 페닐이고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시, 또는 NO<sub>2</sub>인 1, 2, 3, 4 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 또는

Z는 -NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬, 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬이다.

바람직한 화학식(I-3)의 화합물 또는 이의 염에는 하기 화학식(II)의 화합물이 포함된다:



II

상기 식에서,

R<sub>1</sub>은 H, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, 또는 벤질이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐 ( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피페리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피롤리디닐이며, 상기 정의에서, 헤테로시클로알킬기는 폐닐 고리에 융합되거나 융합되지 않으며, 헤테로시클로알킬 부분, 폐닐 부분, 또는 이들 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬이며, 상기 정의에서, 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 폐닐로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 H, 벤질옥시, 벤질, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬, NH-폐닐,  $N(C_1-C_4)$  알킬-폐닐, NH벤질, 또는  $-N(C_1-C_6)$  알킬벤질로부터 독립적으로 선택되며, 상기 정의에서, 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다.

바람직한 화학식(II)의 화합물에는 기 정의가 이하 정의된 바와 같은 화학식(II-1)의 화합물이 포함된다:

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$  알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬- $N(R_9)-$ 이며, 상기 정의에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$  폐닐, 벤질, 펜에틸, 나프틸- $CH_2-$ , 안트라세닐- $CH_2-$ 이고, 상기 정의에서, 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_3$ 은 결합,  $-(C_1-C_4)$  알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)-$ 이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로파라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬인 1 또는 2개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, -폐닐-카르보닐-폐닐, -폐닐-피리딜, -폐닐-피페리디닐, -폐닐-피롤리디닐, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 디벤조푸라닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 상기 정의된 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며; 상기 정의에서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 폐닐 ( $C_1-C_4$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 폐닐( $C_1-C_4$ ) 알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 또는  $-SO_2-$  폐닐이고, 상기 정의에서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는 부재하거나, H,  $-NHC(O)$  폐닐,  $-NHC(O)$  나프틸,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$  폐닐,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$  나프틸, 나프틸, 또는 폐닐이고, 상기 정의에서, 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 또는

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$  알킬-( $C_3-C_7$ ) 시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)-(C_1-C_4)$  알킬-( $C_3-C_7$ ) 시클로알킬이다.

그 밖의 화학식(II-1)의 화합물에는 기 정의가 이하 기재된 바와 같은 화학식(II-2)의 화합물이 포함된다:

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬 또는 벤질이며;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬이고, 상기 정의에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬이고, 상기 정의에서, 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않은 페닐로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 H, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬로 부터 독립적으로 선택되고,

$L_2$ 는 결합, 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이며, 상기 정의에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 벤질, 펜에틸이고, 상기 정의에서 페닐기는  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_3$ 은 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬, 또는  $-C(O)-$ 이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1 또는 2개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 H, 페닐, 나프틸, 피리딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알콕시,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 상기된 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며; 상기 정의에서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐 ( $C_1-C_4$ ) 알카노일이고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는 부재하거나, H,  $-NHC(O)$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 페닐, 또는 페닐이고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며, 또는

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$  알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬이다.

바람직한 화학식(II-2)의 화합물에는 기 정의가 이하 기재된 바와 같은 화학식(II-3)의 화합물이 포함된다:

$R_1$ 은 H, 또는  $C_1-C_4$  알킬이고;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬이며, 상기 정의에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$ 알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 또는  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_4$ 알킬이고, 상기 정의에서, 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않은 페닐에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$  중 하나 이상은 H이면서, 다른 것은 H, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬이고,

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이며, 상기 정의에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 벤질, 펜에틸이고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 은 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-C(O)-$ 이고;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1 또는 2개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 H, 페닐, 나프틸, 피리딜, 페리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 이들 각각은 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_4$ )알카노일이고, 상기 정의에서 페닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는 부재하거나, H,  $-NHC(O)$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 페닐, 또는 페닐이고, 상기 정의에서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬 (예를 들어,  $CF_3$ ),  $C_1-C_2$  할로알콕시 (예를 들어,  $OCF_3$ ), 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며, 또는

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬이다.

바람직한 화학식(II-3)의 화합물에는 기 정의가 이하 기재된 바와 같은 화학식(II-4)의 화합물이 포함된다:

$L_2$ 는 결합 또는  $-NR_9-$ 이고; 상기 정의에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬, 또는 벤질이며;

$R_2$ 는 페닐, 벤질, 펜에틸, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고, 상기 정의에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 또는  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 페닐, 또는 피리딜이고, 이들 각각은 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시 카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며, 상기 정의에서  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_4$ )알카노일이고, 상기 정의에서, 페닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는 부재하거나, H, 또는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기에 의해서 치환되거나 치환되지 않은 페닐이다.

바람직한 화학식 II-4의 화합물은 화학식 II-5의 화합물, 즉, A 고리가 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $N(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬인 1개 또는 2개의 기로 각각 치환되거나 비치환된 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 티아졸릴 또는 피리미딜인 화합물을 포함한다. 바람직한 구체예에서, A 고리는 비치환되거나 하나 이상의 할로겐으로 치환된다.

바람직한 화학식 II-5의 화합물은 화학식 II-6의 화합물, 즉,  $R_{10}$ 이 H 또는  $C_1-C_4$  알킬이고;  $L_3$ 가 결합 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬-인 화합물을 포함한다. 더욱 바람직하게는,  $R_{10}$ 은 H 또는 메틸이다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-a의 화합물, 즉, A 고리가 각각 비치환된 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 티아졸릴 또는 피리미딜인 화학식 II-5 또는 II-6의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-b의 화합물, 즉,  $R_1$ 이 H인 화학식 II-5, II-6 또는 II-6-a의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-c의 화합물, 즉,  $L_3$ 가 결합이고  $L_2$ 가 결합인 화학식 II-5, II-6, II-6-a 또는 II-6-b의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-d의 화합물, 즉, A 고리가 피라졸릴 또는 티아졸릴인 화학식 II-6-c 또는 II-6-b의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-e의 화합물, 즉, Z가 부재하는 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-f의 화합물, 즉, Z가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알킬),  $C_1-C_6$  알콕시(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알콕시), 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬(한 가지 양태에서는  $CF_3$ ),  $C_1-C_2$  할로알콕시(한 가지 양태에서는  $OCF_3$ ) 또는  $NO_2$ 인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된 폐닐인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 III-6-d의 화합물을 제공한다. 또 다른 양태에 있어서, 폐닐은 3개 이하의 치환기로 치환되거나 비치환된다. 또 다른 양태에 있어서, 폐닐은 일치환된다. 또 다른 양태에 있어서, 폐닐 고리는 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-g의 화합물, 즉, Q가 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$  또는  $NR_6R_7$ 인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된 폐닐인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, 또는 II-6-f의 화합물을 제공하고; 여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일 또는 폐닐( $C_1-C_4$ )알카노일이며 폐닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-h의 화합물, 즉, Q가 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알콕시카르보닐),  $C_1-C_6$  알킬(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알킬),  $C_1-C_6$  알콕시(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알콕시), 할로겐,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 폐닐인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, II-6-f, 또는 II-6-g의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-i의 화합물, 즉, Q가 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알콕시카르보닐),  $C_1-C_6$  알킬(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알킬),  $C_1-C_6$  알콕시(또 다른 양태에서는  $C_1-C_4$  알콕시), 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$  또는  $NR_6R_7$ 인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 폐닐인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, II-6-f, 또는 II-6-g의 화합물을 제공하고; 여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로

H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬), 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일 또는 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)알카노일이며 페닐기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub>인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-j의 화합물, 즉, Q가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> 또는 NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된 피리딜인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, 또는 II-6-f의 화합물을 제공하고, 여기서 R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일 또는 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일이며 페닐기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub>인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-k의 화합물, 즉, Q가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시카르보닐), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시), 할로겐, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub>인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 피리딜인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, II-6-f, 또는 II-6-j의 화합물을 제공한다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-6-l의 화합물, 즉, Q가 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시카르보닐), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬), C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시), 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub> 또는 NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 피리딜인 화학식 II-4, II-5, II-6, II-6-a, II-6-b, II-6-c 또는 II-6-d, II-6-e, II-6-f, 또는 II-6-j의 화합물을 제공하고, 여기서 R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬 (또 다른 양태에서는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬), 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일 또는 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)알카노일이며 페닐기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub>인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다.

그 밖의 바람직한 화학식 II-4의 화합물은 화학식 II-7의 화합물, 즉, 기 정의가 다음과 같은 화합물이다:

n은 0, 1, 2 또는 3이고;

R<sub>1</sub>은 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐 (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐이고;

R<sub>2</sub>는 페닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-C(O)NH<sub>2</sub>, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-S(O)<sub>b</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 히드록시알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-피리디닐, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-페페리디닐, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-페롤리디닐 또는 -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-테트라히드로푸라닐이고, 여기서 헤테로시클로알킬기는 페닐 고리에 융합되거나 비융합되고, 헤테로시클로알킬 부분, 페닐 부분 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시인 전체 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되며; b는 0, 1 또는 2이고;

R<sub>3</sub>는 H 또는 -CO<sub>2</sub>R<sub>1</sub>이고,

R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub> 및 R<sub>23</sub>은 H, 페닐알콕시, 페닐알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, NH-페닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)페닐, -NHC(O)페닐, NH페닐알킬, NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-페닐, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, N((C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, -NHSO<sub>2</sub>-페닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬SO<sub>2</sub>페닐 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬)페닐알킬로부터 독립적으로 선택되며, 여기서 페닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고;

L은  $\text{-SO}_2\text{NH-}$ ,  $\text{-SO}_2\text{N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-NHSO}_2-$ ,  $\text{-O-}$ ,  $\text{-C(O)NH-}$ ,  $\text{-C(O)N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-SO}_2-$ ,  $\text{-C(O)-(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-C(O)-}$ ,  $\text{-NH-}$ ,  $\text{-N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-이며, 여기서 알킬기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $\text{NO}_2$ , 할로알킬 또는 할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된 폐닐로 치환되거나 비치환된다.

그 밖의 바람직한 화학식 II-7의 화합물은 화학식 II-8의 화합물, 즉, 기정의가 다음과 같은 화합물이다:

$\text{L}_2$ 는 결합 또는  $\text{-C(O)NR}_9-$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)C(O)-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-C(O)NR}_9-$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-N(R}_9\text{)C(O)-}$ ,  $\text{-C(O)N(R}_9\text{)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)C(O)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-C(O)N(R}_9\text{)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-N(R}_9\text{)C(O)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)SO}_2-$ ,  $\text{-SO}_2\text{N(R}_9\text{)-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-O-(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬-O-}$  또는  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-N(R}_9\text{)-}$ 이고,

$\text{R}_9$ 은 H이거나  $\text{CO}_2\text{H}$ ,  $\text{-SO}_2\text{페닐}$ , 폐닐알킬, 나프틸알킬 또는 안트라세닐알킬로 치환되거나 비치환된  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬이며, 여기서 아릴기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬,  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬, 할로알킬 또는 할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고;

$\text{L}_3$ 는 부재하거나, 결합,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-O-}$ ,  $\text{-O-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-알케닐-}$ , C(O)이고;

A 고리는 폐닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 퀴놀리닐, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 나프틸, 퀴나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 푸라닐, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 트리아졸릴이며, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬 또는  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환되고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸,  $\text{-페닐-카르보닐-페닐}$ ,  $\text{-페닐-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-페닐}$ ,  $\text{-페닐-피리딜}$ ,  $\text{-페닐-피리미딜}$ ,  $\text{-페닐-옥사졸릴}$ ,  $\text{-페닐-티아졸릴}$ ,  $\text{-페닐-이미다졸릴}$ ,  $\text{-페닐-피롤릴}$ ,  $\text{-페닐-피페리디닐}$ ,  $\text{-페닐-피롤리디닐}$ ,  $\text{-페닐-피페라지닐}$ ,  $\text{-페닐-모르폴리닐}$ ,  $\text{-페닐-티오모르폴리닐}$ ,  $\text{-페닐-티오모르폴리닐 디옥시드}$ ,  $\text{-페닐-피리딜}$ ,  $\text{피리미딜}$ , 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴,  $\text{-피리딜-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-페닐}$ ,  $\text{-피리미딜-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-페닐}$ , 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥시드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬 또는  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐이며, 여기서 상기 언급된 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시,  $\text{NR}_6\text{R}_7$  또는 폐닐인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환되고; 여기서,  $\text{R}_6$  및  $\text{R}_7$ 은 독립적으로 H,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 폐닐( $\text{C}_1\text{-C}_6\text{)$ 알킬,  $\text{C}_2\text{-C}_6$  알카노일, 폐닐( $\text{C}_1\text{-C}_6\text{)$ 알카노일,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐, 폐닐( $\text{C}_1\text{-C}_6\text{)$ 알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피리딜, 피리미딜, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $\text{-C(O)NH}_2$ ,  $\text{-C(O)NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬,  $\text{-C(O)N(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬( $\text{C}_1\text{-C}_6\text{)$ 알킬 또는  $\text{-SO}_2\text{-페닐}$ 이며, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{NO}_2$ , OH,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬,  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)}$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알킬 또는  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고,

Z는 부재하거나, H,  $\text{-NHC(O)페닐}$ ,  $\text{-N(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬C(O)페닐}$  또는 폐닐이며, 여기서 폐닐기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시 또는  $\text{NO}_2$ 인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된다.

그 밖의 바람직한 화학식 II-8의 화합물은 화학식 II-9의 화합물, 즉, 기정의가 다음과 같은 화합물을 포함한다:

$R_{20}$ ,  $R_{21}$ ,  $R_{22}$  및  $R_{23}$ 은 H, 페닐알콕시, 벤질, 페네틸, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐, NH페닐알킬,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2$ -페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬( $SO_2$ 페닐 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)페닐( $C_1-C_6$ )알킬로부터 독립적으로 선택되며, 여기서 각각의 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고;

$L$ 은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)-$ ,  $-NH-$ ,  $-N(C_1-C_4)$  알킬- 이거나 (여기서, 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬 또는 할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐로 치환되거나 비치환된다);

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-O-(C_1-C_6)$ 알킬-,  $-(C_1-C_6)$ 알킬-O- 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이고,

$R_9$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐알킬, 나프틸알킬 또는 안트라세닐알킬이며, 여기서 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 할로알킬 또는 할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고;

$L_3$ 는 부재하거나, 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, -알케닐-,  $C(O)$ 이고;

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬이고;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피리디닐, ( $C_1-C_4$ ) 히드록시알킬이며, 여기서 페닐 고리는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 전체 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고;

A 고리는 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 나프틸, 쿠나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 이소티아졸릴 또는 피롤릴이며, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1개, 2개 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환되고;

$Q$ 는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-카르보닐-페닐, -페닐- $(C_1-C_4)$ 알킬- 페닐, -페닐-피리딜, -페닐-피리미딜, -페닐-이미다졸릴, -페닐-피롤릴, -페닐-피페라지닐, -페닐-모르폴리닐, -페닐-티오모르폴리닐 디옥시드, -페닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜- $(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, -피리미딜- $(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥시드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이며, 여기서 상기 언급된 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $NR_6R_7$  또는 페닐인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환되고; 여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ )알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬 또는  $-SO_2$ -페닐이며, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환되고,

Z는 부재하거나, H 또는 페닐이며, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시 또는  $NO_2$ 인 1개, 2개, 3개, 4개 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-10의 화합물, 즉, 기 정의가 다음과 같은 화학식 II-9의 화합물을 제공한다:

$R_{22}$  및  $R_{23}$ 은 둘 모두 H이고;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 독립적으로 H, 페닐( $C_1-C_4$ )알콕시, 벤질, 페네틸, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬, OH, 알콕시 및  $NO_2$ 이며, 여기서 각각의 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 양태에 있어서, 본 발명은 화학식 II-11의 화합물, 즉, 기 정의가 다음과 같은 화학식 II-9의 화합물을 제공한다:

$R_{22}$  및  $R_{23}$ 은 둘 모두 H이고;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 독립적으로 H,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬,  $NH$ -페닐,  $NH$ -페닐알킬,  $N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2$ -페닐,  $-N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬- $SO_2$ 페닐 또는  $-N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-페닐( $C_1-C_6$ )알킬이며, 여기서 각각의 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1개, 2개, 3개 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-12)의 화합물, 즉,  $R_1$ 이 H 또는 메틸(바람직하게는 H)인 화학식(II-10 또는 II-11)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-13)의 화합물, 즉, L이  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C-O(O)-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬- $C(O)-$ ,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-이고, 상기 각각의 알킬 기가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬(또 다른 일면에서,  $C_1-C_4$  알킬),  $C_1-C_6$  알콕시(또 다른 일면에서,  $C_1-C_4$  알콕시), 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-10, II-11 또는 II-12)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-14)의 화합물, 즉, L이  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬- $C(O)-$ ,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-인 화학식(II-10, II-11, 또는 II-12)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-15)의 화합물, 즉, L이  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_3)C_1-C_3$ 알킬-,  $-O-$ , 또는  $-C(O)-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-인 화학식(II-10, II-11, 또는 II-12)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-16)의 화합물, 즉,  $L_2$ 가 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-, 또는  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)C_1-C_4$ 알킬-이고,  $R_9$ 가 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 또는 나프틸알킬이고, 상기 각각의 아릴 기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬,  $N(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬- $(C_1-C_6)C_1-C_6$ 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-17)의 화합물, 즉,  $L_2$ 가  $-N(R_9)SO_2-$ , 또는  $-SO_2N(R_9)-$ 이고,  $R_9$ 가 화학식(II-16)에 대해 정의된 바와 같은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-18)의 화합물, 즉, L<sub>2</sub>가 -N(R<sub>9</sub>)-, -N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, 또는 -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-N(R<sub>9</sub>)-이고, R<sub>9</sub>가 화학식(II-16)에 대해 정의된 바와 같은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-19)의 화합물, 즉, L<sub>2</sub>가 -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬-, 또는 -(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬-O-인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-20)의 화합물, 즉, L<sub>2</sub>가 결합, -N(R<sub>9</sub>)SO<sub>2</sub>-, -SO<sub>2</sub>N(R<sub>9</sub>)-, 또는 -N(R<sub>9</sub>)-이고, R<sub>9</sub>가 화학식(II-16)에 대해 정의된 바와 같은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-21)의 화합물, 즉, R<sub>2</sub>가 페닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(또 다른 일면에서, 벤질)이고, 각각의 상기 페닐 부분은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub> 인 총 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, 또는 II-20)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-22)의 화합물, 즉, R<sub>2</sub>가 페닐 또는 벤질인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, 또는 II-20)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-23)의 화합물, 즉, R<sub>2</sub>가 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-피리디닐, 또는(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)히드록시알킬인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, 또는 II-20)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-24)의 화합물, 즉, A 고리가 페닐 또는 나프틸이고, 이들 각각의 독립적으로, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, 또는 II-20)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서, 본 발명은 A-고리는 치환되지 않는다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-25)의 화합물, 즉, A 고리가 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 피리미딜, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 또는 피롤릴이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, 또는 II-23)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서, 본 발명은 A-고리는 치환되지 않는다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-26)의 화합물, 즉, A 고리가 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 퀴나졸리닐, 또는 벤조[b]티오펜이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, 또는 II-23)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서, 본 발명은 A-고리는 치환되지 않는다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-27)의 화합물, 즉, Q가 H, 페닐, 나프틸, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라히드로푸라닐, 테트라히드로티에닐, 피페라지닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기에서

R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐, -

$C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 또는  $-SO_2-$ 페닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 할로젠,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-28)의 화합물, 즉, Q가 페닐, 나프틸, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라히드로푸라닐, 테트라히드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로젠,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는 페닐인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, 35 II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-29)의 화합물, 즉, Q가  $-페닐-카르보닐-페닐$ ,  $-페닐-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-페닐-$ 피리딜,  $-페닐-피리미딜$ ,  $-페닐-이미다졸릴$ ,  $-페닐-피롤릴$ ,  $-페닐-피페라지닐$ ,  $-페닐-모르폴리닐$ ,  $-페닐-티오모르폴리닐$  디옥사이드,  $-페닐-피리딜$ ,  $-피리딜-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-피리미딜-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐이고, 상기 시클릭기가 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$ 알킬,  $C_1-C_6$ 알콕시, 할로젠,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $NR_6R_7$ , 또는 페닐인 1, 2, 3, 4 또는 5 개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기에서,

$R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ )알카노일,  $C_1-C_6$ 알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 또는  $-SO_2-$ 페닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 할로젠,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$ 알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-30)의 화합물, 즉, Q가  $-페닐-카르보닐-페닐$ ,  $-페닐-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-페닐-$ 피리딜,  $-페닐-피리미딜$ ,  $-페닐-이미다졸릴$ ,  $-페닐-피롤릴$ ,  $-페닐-피페라지닐$ ,  $-페닐-모르폴리닐$ ,  $-페닐-티오모르폴리닐$  디옥사이드,  $-페닐-피리딜$ ,  $-피리딜-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-피리미딜-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐이고, 상기 시클릭기가 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$ 알킬,  $C_1-C_6$ 알콕시, 할로젠,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는 페닐인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-31)의 화합물, 즉, Q가  $C_1-C_6$  알킬, 할로젠,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-32)의 화합물, 즉, Q가 H인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, 또는 II-26)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-33)의 화합물, 즉,  $R_6$  및  $R_7$ 이 독립적으로 H,  $C_1-C_6$ 알킬, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_4$  알카노일, 페닐( $C_1-C_4$ )알카노일,  $C_1-C_4$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알콕시카르보닐이며, 각각의 상기 시클릭기가 독립적으로 할로젠,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$ 알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-27 또는 II-29)의 화합물을 제공한다.

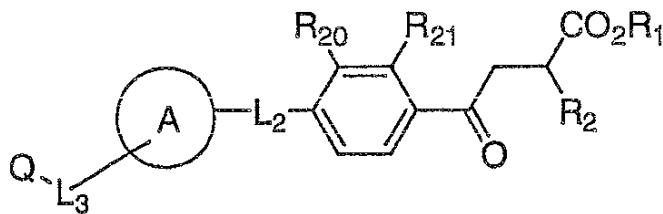
또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-34)의 화합물, 즉,  $R_6$  및  $R_7$ 가 독립적으로 H, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_4)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬( $C_1-C_4$ )알킬, 또는  $-$

$\text{SO}_2$ -페닐이고, 상기 각각의 시클릭기가 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{OH}$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬,  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬,  $\text{CF}_3$  또는  $\text{OCF}_3$ 인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(II-27 또는 II-29)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-35)의 화합물, 즉, Z이 부재하거나 H인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, II-26, II-27, II-28, II-29, II-30, II-31, II-32)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(II-36)의 화합물, 즉, Z이 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{CF}_3$ ,  $\text{OCF}_3$ , 또는  $\text{NO}_2$ 인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐인 화학식(II-9, II-10, II-11, II-12, II-13, II-14, II-15, II-16, II-17, II-18, II-19, II-20, II-21, II-22, II-23, II-24, II-25, II-26, II-27, II-28, II-29, II-30, II-31, II-32)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서, 페닐기는 일치환된다. 또 다른 일면에서, 페닐기는 치환되지 않는다.

화학식(II-9)의 바람직한 화합물 또는 염은 하기 화학식(III)의 화합물을 포함한다:



III

상기 식에서,

$R_1$ 은  $\text{H}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 벤질, 또는 알릴이고;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_4$ )알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $-\text{CH}_2\text{-피리딜}$ , 또는( $\text{C}_1\text{-C}_4$ )히드록시알킬이고, 페닐 및 피리딜 부분은 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $-\text{SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬, 또는  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 독립적으로  $\text{H}$ ,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬,  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬,  $\text{NH}\text{-페닐}$ ,  $\text{NH}\text{-페닐알킬}$ ,  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4)$ 알킬-페닐,  $-\text{NHSO}_2\text{-페닐}$ ,  $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{알킬})\text{SO}_2\text{-페닐}$ , 또는  $-\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_4\text{알킬})\text{-페닐}$ ( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬로부터 선택되며, 페닐기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{OH}$ ,  $\text{NO}_2$ , 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다.

화학식(III)의 바람직한 화합물은 화학식(III-1)의 화합물, 즉, A 고리가 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디벤조푸라닐, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 피리미딜, 퀴나졸리닐, 또는 벤조[b]티오펜이며, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{CF}_2$ ,  $\text{OCF}_3$ ,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬, 또는  $\text{N}(\text{C}_1\text{-C}_6)$ 알킬( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬인 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q가  $\text{H}$ , 페닐, 나프틸, -페닐-피리딜, -페닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜-( $\text{C}_1\text{-C}_4$ )알킬-페닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$ 알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐이며, 상기 시클릭기가 독립적으로 알콕시카르보닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시,  $\text{NR}_6\text{R}_7$ , 또는 페닐인 1, 2, 3, 4 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기에서,

$R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로  $H$ ,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ )알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 또는  $-SO_2-$ 페닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $OH$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, ( $C_1-C_6$ )알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화합물을 포함한다.

화학식(III-1)의 바람직한 화합물은 화학식(III-2)의 화합물, 즉,

$R_1$  이  $H$ 이고;

$L_2$ 가 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이고,  $R_9$ 가  $H$ ,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐알킬, 나프틸- $CH_2-$ , 또는 안트라세닐- $CH_2-$ , 여기에서, 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐,  $OH$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 은 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $C(O)$ 이고;

$R_2$ 은 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $-CH_2-$ 피리딜, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기에서 페닐 및 피리딜 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$Q$ 는  $H$ , 페닐, 나프틸, -페닐-피리딜, -페닐-, 피리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$ 알킬,  $C_1-C_6$ 알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NR_6R_7$ , 또는 페닐인 1, 2, 3, 4 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며; 여기에서,

$R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로  $H$ ,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$ 알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ )알카노일, 또는  $SO_2-$ 페닐이고, 상기 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$ 알킬,  $C_1-C_4$ 알콕시,  $NO_2$ ,  $OH$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$ 할로알킬 또는  $C_1-C_2$ 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화합물을 포함한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(III-2-a)의 화합물, 즉,  $L_3$  이  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ , 또는  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬인 화학식(III-2)의 화합물을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(III-2-b)의 화합물, 즉,  $L_3$  이  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-C(O)-$ 알킬인 화학식(III-2)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서,  $L_3$ 는  $C(O)$ 이다. 또 다른 일면에서,  $L_3$ 는  $-(C_1-C_3)$ 알킬-이다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(III-2-c)의 화합물, 즉,  $R_{20}$  및  $R_{21}$ 가 독립적으로  $H$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬로부터 선택되는 화학식(III-2, III-2-a 또는 III-2-b)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서,  $R_{20}$  및  $R_{21}$  중 하나 이상은  $H$ 이다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(III-2-d)의 화합물, 즉,  $R_{20}$  및  $R_{21}$ 이 독립적으로  $H$ ,  $NH$ -페닐,  $NH$ 벤질,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2-$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $SO_2$ 페닐, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)페닐( $C_1-C_6$ )알킬로부터 선택되며, 각각의 상기 페닐기가 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $OH$ ,  $NO_2$ ,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3 또는 4개의 기(또 다른 일면에서, 1, 2 또는 3개의 기)로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(III-2, III-2-a 또는 III-2-b)의 화합물을 제공한다. 또 다른 일면에서,  $R_{20}$  및  $R_{21}$  중 하나 이상은  $H$ 이다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 화학식(III-2-e)의 화합물, 즉, R<sub>2</sub>가 페닐, 또는 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬이고, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알콕시, SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, CF<sub>3</sub>, 또는 OCF<sub>3</sub>인 총 1, 2 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않은 화학식(III-2, III-2-a, III-2-b, III-2-c, 또는 III-2-d)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-f)의 화합물, 즉 R<sub>2</sub>가 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, CF<sub>3</sub>, 또는 OCF<sub>3</sub>인 총 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐인 화학식(III-2-e)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, 페닐은 비치환된다.

또한 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-g)의 화합물, 즉 R<sub>2</sub>가 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, CF<sub>3</sub>, 또는 OCF<sub>3</sub>인 총 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬인 화학식(III-2-e)의 화합물을 제공한다. 보다 바람직한 측면에서, R<sub>2</sub>는 상기와 같이 치환되거나 비치환된 벤질이다. 또 다른 측면에서, 벤질은 비치환된다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-h)의 화합물, 즉 R<sup>2</sup>가 -CH<sup>2</sup>-페리딜(여기에서, 페리딜기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, CF<sub>3</sub>, 또는 OCF<sub>3</sub>인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다), 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 또는 화학식(III-2-d)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, R<sub>2</sub>는 비치환된 -CH<sub>2</sub>-페리딜이다. 또 다른 측면에서, R<sub>2</sub>는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬이다. 또한 또 다른 측면에서, R<sub>2</sub>는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬이다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-i)의 화합물, 즉, Q가 H, 페닐, 나프틸, 퍼리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다); R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>이 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 또는 화학식(III-2-h)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-j)의 화합물, 즉, Q가 페닐, 나프틸, 퍼리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다); R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>이 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 벤질, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐인 화학식(III-2-i)의 화합물을 제공한다.

또한 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-k)의 화합물, 즉, Q가 페닐 또는 나프틸 (이들 각각은 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2-i) 또는 화학식(III-2-j)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, Q는 상기 기술된 대로 치환되거나 비치환된 페닐이다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-l)의 화합물, 즉, Q가 퍼리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다); R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>이 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 벤질, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐인 화학식(III-2-i) 또는 화학식(III-2-j)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, Q는 각각이 비치환된 퍼리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-m)의 화합물, 즉, Q가 -페닐-퍼리딜이고 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로

치환되거나 비치환된다); R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>이 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알카노일, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, CF<sub>3</sub> 또는 OCF<sub>3</sub>인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 또는 화학식(III-2-h)의 화합물을 제공한다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-n)의 화합물, 즉, A 고리가 페닐 또는 나프틸 (이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 또는 화학식(III-2-m)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, A 고리는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐이다. 또 다른 측면에서, A 고리는 하나 이상의 기로 치환된다. 여전히 또 다른 구체예에서, A 고리는 비치환된다.

또한 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-o)의 화합물, 즉, A 고리가 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 또는 피리미딜 (이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 또는 화학식(III-2-m)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-p)의 화합물, 즉, A 고리가 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 하나의 기로 치환되거나 비치환된 티아졸릴인 화학식(III-2-o)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, 티아졸릴 고리는 비치환된다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-q)의 화합물, 즉, A 고리가 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 하나의 기로 치환되거나 비치환된 피라졸릴인 화학식(III-2-o)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, 피라졸릴 고리는 비치환된다.

또한 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-r)의 화합물, 즉, A 고리가 디벤조푸라닐, 벤조푸라닐, 퀴나졸리닐, 또는 벤조[b]티에닐 (이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 또는 화학식(III-2-m)의 화합물을 제공한다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-s)의 화합물, 즉, A 고리가 디벤조푸라닐 또는 벤조푸라닐 (이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 또는 화학식(III-2-m)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, A 고리는 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬인 하나의 기로 일치환되거나 비치환된 디벤조푸라닐이다. 여전히 또 다른 측면에서, 디벤조푸라닐기는 비치환된다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-t)의 화합물, 즉, L<sub>2</sub>가 결합인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 화학식(III-2-m), 화학식(III-2-n), 화학식(III-2-o), 화학식(III-2-p), 화학식(III-2-q), 화학식(III-2-r), 또는 화학식(III-2-s)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-u)의 화합물, 즉  $L_2$ 가  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$  (여기에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 또는 나프틸- $CH_2-$ 이고, 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 화학식(III-2-m), 화학식(III-2-n), 화학식(III-2-o), 화학식(III-2-p), 화학식(III-2-q), 화학식(III-2-r), 또는 화학식(III-2-s)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-v)의 화합물, 즉,  $L_2$ 가  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$  (여기에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 또는 나프틸- $CH_2-$ 이고, 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 화학식(III-2-m), 화학식(III-2-n), 화학식(III-2-o), 화학식(III-2-p), 화학식(III-2-q), 화학식(III-2-r), 또는 화학식(III-2-s)의 화합물을 제공한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-w)의 화합물, 즉,  $L_2$ 가  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$  (여기에서,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 또는 나프틸- $CH_2-$ 이고, 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화학식(III-2), 화학식(III-2-a), 화학식(III-2-b), 화학식(III-2-c), 화학식(III-2-d), 화학식(III-2-e), 화학식(III-2-f), 화학식(III-2-g), 화학식(III-2-h), 화학식(III-2-i), 화학식(III-2-j), 화학식(III-2-k), 화학식(III-2-l), 화학식(III-2-m), 화학식(III-2-n), 화학식(III-2-o), 화학식(III-2-p), 화학식(III-2-q), 화학식(III-2-r), 또는 화학식(III-2-s)의 화합물을 제공한다.

여전히 또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(III-2-x)의 화합물, 즉,  $R_9$ 가 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 벤질, 또는 나프틸- $CH_2-$ 이고, 아릴기가 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_4$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다(또 다른 측면에서, 아릴기는 1 또는 2개의 기로 치환되거나 비치환된다) 화학식(III-2-u), 화학식(III-2-v), 또는 화학식(III-2-w)의 화합물을 제공한다. 또 다른 측면에서, 페닐기는 비치환된다. 여전히 또 다른 측면에서, 페닐기는 일치환된다.

화학식(III-2)의 바람직한 화합물은 화학식(III-3)의 화합물, 즉,

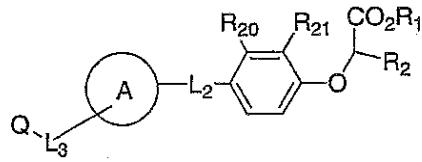
$L_3$ 이 결합이고;

$R_2$ 가 페닐, 벤질, 웬에틸, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고 (여기에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다);

$Q$ 가 H, 또는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NR_6R_7$ , 또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐이고;

A 고리가 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디히드로피라졸릴, 퀴나졸리닐, 및 벤조[b]티오펜 (이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화합물을 포함한다.

화학식(II-8)의 다른 바람직한 화합물 또는 염은 하기 화학식(IV)의 화합물을 포함한다:



상기 식에서, R<sub>1</sub>은 H 또는 메틸이고 (바람직하게는 H);

R<sub>2</sub>는 페닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 또는 (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)히드록시알킬이다 (여기에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다).

화학식(IV)의 바람직한 화합물은 화학식(IV-1)의 화합물, 즉

A 고리가 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 퀴놀리닐, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 피리미딜, 퀴나졸리닐, 푸라닐, 또는 벤조[b]티오펜이고 (이들 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 비치환된다);

R<sub>20</sub> 및 R<sub>21</sub>이 독립적으로 H, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, NH-페닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)C(O) 페닐, -NHC(O)페닐, NH페닐알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-페닐, -NHSO<sub>2</sub>-페닐, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)SO<sub>2</sub>페닐, 또는 -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬)페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬 (여기에서, 페닐기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)로부터 선택되는 화합물을 포함한다.

화학식(IV-1)의 바람직한 화합물은 화학식(IV-2)의 화합물, 즉,

L<sub>2</sub>가 결합 또는 -C(O)NR<sub>9</sub>-, -N(R<sub>9</sub>)C(O)-, -N(R<sub>9</sub>)SO<sub>2</sub>-, -SO<sub>2</sub>N(R<sub>9</sub>)-, -N(R<sub>9</sub>)-, -N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, 또는 -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-N(R<sub>9</sub>)-이고,

R<sub>9</sub>가 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -SO<sub>2</sub>페닐, 페닐알킬, 나프틸-CH<sub>2</sub>- 또는 안트라세닐-CH<sub>2</sub>-이고 (여기에서, 아릴기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다);

L<sub>3</sub>가 결합, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-O-, -O-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-, C(O)이고;

R<sub>2</sub>가 페닐, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬이고 (여기에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬, CF<sub>3</sub>, 또는 OCF<sub>3</sub>인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다);

Q가 H, 페닐, 나프틸, -페닐-피리딜, -페닐-, 피리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된다); 여기에서

R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>이 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 페닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알카노일, 또는 -SO<sub>2</sub>-페닐 (여기에서, 시클릭기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화합물을 포함한다.

화학식(IV-2)의 바람직한 화합물은 화학식(IV-3)의 화합물, 즉, Q가 H, 또는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 비치환된 페닐인 화합물을 포함한다.

화학식(IV-3)의 화합물은 화학식(IV-4)의 화합물, 즉,

$L_3$ 가 결합이고;

$R_1$ 이 H 또는  $C_1-C_4$  알킬이고;

$R_2$ 가 페닐, 벤질, 웬에틸, 또는  $C_1-C_6$  알킬 (여기에서, 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 비치환된다)인 화합물을 포함한다.

또 다른 측면에서, 본 발명은 화학식(IV-5)의 화합물, 즉,  $R_{20}$  및  $R_{21}$  중의 하나 이상이 H인 화학식(IV), 화학식(IV-4), 화학식(IV-3), 화학식(VI-2) 또는 화학식(IV-1)의 화합물을 제공한다.

화학식(IV-4)의 다른 화합물은 화학식(IV-6)의 화합물, 즉,  $R_{20}$  및  $R_{21}$  둘 모두가 H인 화합물을 포함한다.

화학식(IV-5)의 다른 화합물은  $R_{21}$ 이 H이고  $R_{20}$ 이  $-N(H$  또는  $C_1-C_4$  알킬)페닐 또는  $-N(H$  또는  $C_1-C_4$  알킬) $SO_2-$ 페닐 (여기에서, 페닐은  $C_1-C_6$  알킬로 치환되거나 비치환된다)인 것들을 포함한다. 보다 바람직하게는 페닐이  $C_2-C_5$  알킬로 치환된다. 보다 바람직하게는 n-부틸로 치환된다. 여전히 보다 바람직하게는 네 개의 위치에서 치환된다.

화학식(I)의 바람직한 화합물은 A 고리가 상기 특정된 대로 치환된 페닐인 것들을 포함한다. 바람직한 측면에서, 페닐은 하나 이상의 아릴 또는 헤테로아릴기, 예컨대 페닐 또는 벤조푸릴로 치환되고, 여기에서 아릴 또는 헤�테로아릴은 상기 특정된 대로 일-, 이- 또는 삼치환되거나 비치환된다.

화학식(I)에서 바람직한 "A 고리- $L_3-Q$ "기는 비페닐이며, 즉 A 고리가 페닐이고,  $L_3$ 가 결합이며, Q가 상기 특정된 대로 치환되거나 비치환된 페닐이다.

화학식(I)의 다른 바람직한 화합물은 A 고리가 티아졸릴이고, 바람직하게는 2- 또는 4-티아졸릴이고, 보다 바람직하게는 하나 이상의 페닐 또는 피리디닐기(Z 또는 Q로부터)로 치환된 2- 또는 4-티아졸릴인 것들을 포함하며, 여기에서 페닐 및 피리디닐기는 상기 특정된 대로 일-, 이- 또는 삼치환되거나 비치환된다. 상기 측면의 특히 바람직한 화합물은 A 고리가 상기 특정된 대로 이치환된 2- 또는 4-티아졸릴인 것들을 포함한다.

화학식(I)의 다른 바람직한 화합물은 A 고리가 피라졸릴이고, 바람직하게는 1-피라졸릴이고, 보다 바람직하게는 하나 이상의 페닐 또는 피리디닐기(Z 또는 Q로부터)로 치환된 1-피라졸릴인 것들을 포함하며, 여기에서 페닐 및 피리디닐기는 상기 특정된 대로 일-, 이- 또는 삼치환되거나 비치환된다. 상기 측면에서, 하나 이상의 페닐 또는 피리디닐기는 피라졸 A 고리의 3- 또는 5-위치에 있는 것이 바람직하다. 특히 바람직한 화합물은 A 고리가 피라졸 A 고리의 3- 및 5-위치 또는 3- 및 4-위치에서 이치환된 피라졸릴인 것들을 포함한다.

여전히 화학식(I)의 다른 바람직한 화합물은  $L_2$ 가  $-NHC(O)-$  또는  $-N[(C_1-C_6)\text{알킬}]C(O)-$ 이고, 보다 바람직하게는  $-NHC(O)-$ 인 것들이다.

또한 화학식(I)의 다른 바람직한 화합물은  $L_2$ 가  $-C(O)-$ 인 것들이다. 화학식(I)의 다른 바람직한 화합물은  $L_2$ 가  $-S(O)_2N[(C_1-C_6)\text{알킬}]-$ 인 것들을 포함한다.

또 다른 바람직한  $L_2$ 기는  $-[(C_1-C_3)\text{알킬렌}]N(R_9)-$ 이다. 바람직하게는 상기 측면의  $R_9$ 가  $-SO_2-$ 페닐이다 (여기에서, 페닐은 상기 특정된 대로 치환되거나 비치환된다). 보다 바람직하게는  $R_9$ 의 범위내에 있는 페닐기가 할로알킬 또는 할로겐으로 치환되고, 보다 바람직하게는 할로알킬 또는 할로겐인 하나 이상의 치환기로 이치환된다.

화학식 (I)의 그 밖의 바람직한 화합물은 n이 0인 것들이다. 이러한 일면에서, 보다 바람직한 화합물은 R<sub>2</sub>가 페닐 또는 벤질인 것들이며, 가장 바람직한 것은 R<sub>2</sub>가 벤질인 것이다. 특정 일면에서, R<sub>2</sub>는 1개 또는 2개의 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알킬, 할로겐, C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> 알콕시 또는 트리플루오로메틸로 치환되거나 치환되지 않은 벤질이다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 약제학적으로 허용되는 양의 화학식 (I)의 화합물을 당뇨병의 치료를 요하는 환자에게 투여하는 것을 포함하여, 당뇨병을 치료하는 방법을 제공한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 약제학적으로 허용되는 양의 화학식 (I)의 화합물 또는 염, 또는 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 포함하는 약제 조성물을 당뇨병의 치료를 요하는 환자에게 투여하는 것을 포함하여, 당뇨병을 치료하는 방법을 포함한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 약제학적으로 허용되는 양의 화학식 (I)의 화합물 또는 염, 또는 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 포함하는 약제 조성물을 TPT-IB 억제를 요하는 환자에게 투여하는 것을 포함하여, TBT-IB를 억제시키는 방법을 포함한다.

또 다른 일면에서, 본 발명은 약제학적으로 허용되는 양의 화학식 (I)의 화합물 또는 염, 또는 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 포함하는 약제 조성물을 암 또는 신경퇴행성 질환의 치료를 요하는 환자에게 투여하는 것을 포함하여, 암 또는 신경퇴행성 질환을 치료하는 방법을 포함한다.

본 발명의 화합물로는 하기한 것들이 있으며, 이들은 메사추세츠 캠브리지에 소재한 캠브리지소프트 닷컴 (CambridgeSoft.com)으로부터 판매되는 챔드로우(ChemDraw) 6.02 버전을 사용하여 명명되었다.

N-{[4-{3-(4-메톡시페닐)-5-(4-펜틸페닐)-4,5-디히드로-1H-피라졸-1-일}솔포닐]-N-메틸페닐알라닌}	
N-메틸-N-[{4-{5-(4-펜틸페닐)-3-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-4,5-디히드로-1H-피라졸-1-일}페닐]솔포닐]페닐알라닌	
2-벤질-4-옥소-4-[3-{[4-(트리플루오로메톡시)페닐]솔포닐}아미노]페닐]부탄산	
(2S)-2-[4-((비페닐-4-일메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]솔포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로판산	
2-벤질-4-{3-[(비페닐-4-일메틸)(2-나프틸솔포닐)아미노]페닐}-4-옥소부탄산	

상기 주지된 바와 같이, 본 발명의 화합물은 PTP-IB에 결합하여, 바람직하게는 이를 억제한다. 결과적으로, 본 발명의 화합물은 타입 2 당뇨병을 조절하거나 치료하는 것을 포함하는 다양한 질환의 치료, 당내성의 개선, 및 이를 필요로 하는 환자에게서 인슐린 민감도를 개선시키는데 유용하다. 화합물 또는 이들의 약제학적으로 허용되는 염은 또한 암, 퇴행성 질환 등과 같은 기타 PTP-IB 매개된 질환의 치료 또는 조절에 유용하다.

용어 "알콕시"는 산소 결합을 통해 모 분자 부분에 결합된 지시된 수의 탄소 원자를 갖는 알킬기를 나타낸다. 알콕시기의 예로는 메톡시, 에톡시, 프로포록시, 이소프로포록시 및 헥실옥시가 있다.

본원에 사용된 용어 "알킬"에는 의도된 수의 탄소 원자를 갖는 그러한 알킬기가 포함된다. 알킬기는 선형 또는 분지형일 수 있다. "알킬"의 예로는 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소-, 2차- 및 3차-부틸, 펜틸, 헥실, 헵틸, 3-에틸부틸 등이 있다.

용어 "아릴"은 하나 이상의 방향족 고리를 함유하는 방향족 탄화수소 고리 시스템을 지칭한다. 이러한 방향족 고리는 임의적으로, 융합되거나 그렇지 않으면 다른 방향족 탄화수소 고리 또는 비방향족 탄화수소 고리에 결합될 수 있다. 아릴기의 예로는 페닐, 나프틸, 1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌 및 비페닐이 있다. 아릴기의 바람직한 예로는 페닐, 나프틸 및 안트라세닐이 있다. 보다 바람직한 아릴기는 페닐 및 나프틸이다. 가장 바람직한 아릴기는 페닐이다.

용어 "시클로알킬"은 C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> 고리형 탄화수소를 지칭한다. 시클로알킬의 예로는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로헵틸 및 시클로옥틸이 있다.

용어 "할로겐" 또는 "할로"는 불소, 염소, 브롬 및/또는 요오드를 가리킨다.

용어 "헤테로시클로알킬"은 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 함유하는 고리 또는 고리 시스템을 지칭하는데, 여기서 상기 헤테로원자는 비방향족 고리 내에 있다. 헤테로시클로알킬 고리는 임의적으로, 융합되거나 그렇지 않으면 다른 헤테로시클로알킬 고리 및/또는 비방향족 탄화수소 고리 및/또는 펜틸 고리에 결합된다. 바람직한 헤테로시클로알킬기로는 3 내지 7원의 것이다. 헤테로시클로알킬기의 예로는 1,2,3,4-테트라히드로이소퀴놀린, 피페라진, 모르폴린, 피페리딘, 테트라히드로푸란, 피롤리딘, 피리디노닐 및 피라졸이 있다. 바람직한 헤테로시클로알킬기로는 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐, 피롤리디닐, 피리디노닐, 디히드로피롤리디닐 및 피롤리디노닐이 있다.

용어 "헤테로아릴"은 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 함유하는 방향족 고리를 지칭한다. 이러한 헤테로아릴 고리는 융합되거나 그렇지 않으면 하나 이상의 헤테로아릴 고리, 방향족 또는 비방향족 탄화수소 고리 또는 헤테로시클로알킬 고리에 결합될 수 있다. 헤테로아릴기의 예로는 피리딘, 푸란, 티에닐, 5,6,7,8-테트라히드로이소퀴놀린 및 피리미딘이 있다. 헤테로아릴기의 바람직한 예로는 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라졸릴, 피리미딜, 이미다졸릴, 벤즈이미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 이소옥사졸릴, 옥사디아졸릴, 이소티아졸릴, 벤즈이소티아졸릴, 트리아졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피라졸릴 및 벤조피라졸릴이 있다.

본 발명의 화합물은 하나 이상의 비대칭 탄소 원자를 함유함으로써 결과적으로 상이한 입체화학적 형태로 존재할 수 있다. 이들 화합물은, 예를 들어 라세미체, 키랄 비라세미 또는 부분입체 이성질체로 존재할 수 있다. 이러한 경우에, 단일 거울상 이성질체, 즉 광학적으로 활성인 형태를 라세미체의 비대칭적 합성 또는 분할에 의해 얻을 수 있다. 라세미체의 분할은, 예를 들어 분할제 존재하에서의 결정화; 예를 들어 키랄 HPLC 칼럼을 이용하는 크로마토그래피; 또는 라세미 혼합물을 분할제를 이용하여 유도시켜 부분입체 이성질체를 형성시키고, 크로마토그래피를 통해 분리시킨 다음, 상기 분할제를 제거하여 거울상 이성질체가 풍부하게 존재하는 형태의 고유 화합물을 형성시키는 것과 같은 통상의 방법에 의해 수행될 수 있다. 상기 과정 중 어느 것도, 화합물의 거울상 이성질체의 순도를 증가시키기 위해 반복 실시될 수 있다.

본원에 기술된 화합물이 올레핀 이중 결합을 갖거나 기하학적으로 비대칭인 다른 중심을 갖는 경우에 그리고 별 다르게 명시되지 않는 한, 상기 화합물은 시스, 트랜스, Z- 및 E- 배열을 포함하는 것으로 의도된다. 마찬가지로, 모든 호변이성질체 형태가 또한 포함되어야 한다.

화학식 (I)의 화합물은 통상의 비독성인 약제학적으로 허용되는 담체, 보조제 및 비히클을 함유하는 용량 단위 제형으로, 경구적으로, 국소적으로, 비경구적으로, 흡입 또는 분무에 의해, 또는 직장내로 투여될 수 있다. 본원에 사용된 용어 "비경구적"에는 경피적, 피하적, 혈관내 (예를 들어, 정맥내), 근육내, 또는 경막내 주사 또는 주입 기법 등이 포함된다. 또한, 화학식 (I)의 화합물 및 약제학적으로 허용되는 담체를 포함하는 약제 제형이 제공된다. 화학식 (I)의 화합물 하나 이상은 하나 이상의 비독성의 약제학적으로 허용되는 담체 및/또는 희석제 및/또는 보조제와 함께, 및 필요에 따라 다른 활성 성분과 함께 존재할 수 있다. 화학식 (I)의 화합물을 함유하는 약제 조성물은 경구 사용을 위해 적당한 형태, 예를 들어 정제, 트로치, 로젠지, 수성 또는 유성 혼탁액, 분산가능한 분말 또는 과립, 애멀션, 경질 또는 연질 캡슐, 또는 시럽 또는 엘릭서일 수 있다.

경구 용도로 사용하기 위한 조성물은 약제 조성물의 제조에 대해 당업계에 공지된 임의의 방법에 따라 제조될 수 있으며, 그러한 조성물에는 약제학적으로 기품있고 풍미있는 제제를 제공하도록 감미제, 향미제, 착색제 및 방부제로 이루어지는 군으로부터 선택된 하나 이상의 성분이 함유될 수 있다. 정제는 정제 제조에 적합한 비독성의 약제학적으로 허용되는 부형제와의 혼합물로 활성 성분을 함유한다. 이들 부형제는, 예를 들어 불활성 희석제, 예컨대 탄산칼슘, 탄산나트륨, 락토오스, 인산칼슘 또는 인산나트륨; 과립화제 및 봉해제, 예컨대 옥수수 전분 또는 알긴산; 결합제, 예컨대 전분, 젤라틴 또는 아카시아; 및 윤활제, 예컨대 스테아린산 마그네슘, 스테아르산 또는 텔크일 수 있다. 이러한 정제는 코팅되지 않거나, 공지된 기법에 의해 코팅될 수 있다. 일부 경우에, 상기 코팅은 소화관 내에서의 봉해 및 흡수를 지연시켜 보다 긴 시간에 걸쳐 지속적인 작용을 나타내도록 공지된 기법에 의해 제조될 수 있다. 예를 들어, 글리세릴 모노스테아레이트 또는 글리세릴 디스테아레이트와 같은 시간 지연 물질이 사용될 수 있다.

경구 사용을 위한 제형은 또한, 활성 성분이 불활성 고체 희석제, 예를 들어 탄산칼슘, 인산칼슘 또는 카울린과 혼합되는 경질 젤라틴 캡슐; 또는 활성 성분이 물 또는 오일 매질, 예를 들어 땅콩유, 액체 파라핀 또는 올리브유와 혼합되는 연질 젤라틴 캡슐로서 존재할 수 있다.

경구 사용을 위한 제형은 또한 로젠지로서 존재할 수 있다.

수성 혼탁액에는 수성 혼탁액을 제조하는데 적합한 부형제와의 혼합물로 활성 물질이 함유된다. 그러한 부형제는 혼탁화제, 나트륨 카르복시메틸셀룰로오스, 메틸셀룰로오스, 히드록시-메틸셀룰로오스, 나트륨 알기네이트, 폴리비닐파롤리돈, 검 트라가칸트 및 검 아카시아이며; 분산 또는 습윤화제는 천연 포스파티딜, 예를 들어 레시틴, 또는 알킬렌 옥사이드와 지방산의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 스테아레이트, 또는 에틸렌 옥사이드와 장쇄 지방족 알코올의 축합 생성물, 예를 들어 헵타데카에틸렌옥시세타놀, 또는 에틸렌 옥사이드와, 지방산 및 헥시톨로부터 유도된 부분 에스테르와의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비톨 모노올레이트, 또는 에틸렌 옥사이드와, 지방산 및 헥시톨 무수물로부터 유도된 부분 에스테르와의 축합 생성물, 예를 들어 폴리에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 수성 혼탁액에는 또한 하나 이상의 방부제, 예를 들어 에틸, 또는 n-프로필 p-히드록시벤조에이트, 하나 이상의 착색제, 하나 이상의 향미제, 및 하나 이상의 감미제, 예컨대 수크로오스 또는 사카린이 함유될 수 있다.

유성 혼탁액은 식물성유, 예를 들어 아라키스유, 올리브유, 참깨유 또는 땅콩유, 또는 액체 파라핀과 같은 광유 중에 활성 성분을 혼탁시킴으로써 제형화될 수 있다. 상기 유성 혼탁액에는 증점제, 예를 들어 밀납, 경질 파라핀 또는 세틸 알코올이 함유될 수 있다. 감미제 및 향미제는 풍미있는 경우 제제를 제공하도록 첨가될 수 있다. 이들 조성물은 아스코르빈산과 같은 산화방지제를 첨가시켜 보존될 수 있다.

물을 첨가하여 수성 혼탁액을 제조하는데 적합한 분산가능한 분말 및 과립은, 분산화제 또는 습윤화제, 혼탁화제 및 하나 이상의 방부제와의 혼합물 형태의 활성 성분을 제공한다. 적합한 분산화제 또는 습윤화제 또는 혼탁화제의 예로는 상기 언급된 것들이 있다. 부가적인 부형제, 예를 들어 감미제, 향미제 및 착색제가 또한 존재할 수 있다.

본 발명의 약제 조성물은 또한 수중유형 에멀션 형태일 수 있다. 유성 상은 식물성유 또는 광유, 또는 이들의 혼합물일 수 있다. 적합한 에멀션화제는 천연 검, 예를 들어 검 아카시아 또는 검 트라가칸트; 천연 포스파티딜, 예를 들어 대두, 레시틴, 및 지방산 및 헥시톨로부터 유도된 에스테르 또는 부분 에스테르, 무수물, 예를 들어 소르비탄 모노올레이트, 및 부분 에스테르와 에틸렌 옥사이드의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 이러한 에멀션에는 또한 감미제 및 향미제가 함유될 수 있다.

시럽 및 엘리서는 감미제, 예를 들어 글리세롤, 프로필렌 글리콜, 소르비톨, 글루코오스 또는 수크로오스로 제형화될 수 있다. 그러한 제형에는 또한 완화제, 방부제, 향미제 및 착색제가 함유될 수 있다. 약제 조성물은 멸균 주사가능한 수성 또는 유성 혼탁액의 형태일 수 있다. 이 혼탁액은 상기 언급된 적합한 분산화제 또는 습윤화제 및 혼탁화제를 사용하여 당업계에 공지된 기법에 따라 제형화될 수 있다. 이러한 멸균 주사가능한 제제는 또한 비독성 비경구적으로 허용되는 희석제 또는 용매 중의 멸균성의 주사가능한 용액 또는 혼탁액, 예를 들어 1,3-부탄디올 중의 용액으로서 존재할 수 있다. 사용될 수 있는 허용가능한 비히클 및 용매로는 물, 렇거 용액 및 등장성 염화나트륨 용액이 있다. 또한, 멸균성의 비휘발성 유(fixed oil)가 용매 또는 혼탁되는 매질로서 통상적으로 사용되고 있다. 이를 위해 합성된 모노- 또는 디글리세리드를 포함하는 임의의 온화한 비휘발성유가 사용될 수 있다. 또한, 올레인산과 같은 지방산이 주사가능 물질의 제조에 사용되고 있음이 확인된다.

화학식 (I)의 화합물은 또한, 예를 들어 약물의 직장 투여를 위한 좌약 형태로 투여될 수 있다. 이들 조성물은, 실온에서는 고체이나 직장 온도에서는 액체이어서 직장 내에서 용융되어 약물을 방출시키는 적합한 비자극성 부형제와 약물을 혼합시켜 제조될 수 있다. 그러한 물질로는 코코아 버터 및 폴리에틸렌 글리콜이 있다.

화학식 (I)의 화합물은 멸균성 매질 내에 비경구적으로 투여될 수 있다. 사용된 비히클 및 농도에 따라 달라지나 약물은 비히클 내에 현탁되거나 용해될 수 있다. 유리하게는, 국소 마취제, 방부제 및 완충제와 같은 보조제를 비히클 내에 용해시킬 수 있다.

눈 또는 기타 외부 조직, 예를 들어 입 및 피부의 질환에 대해서, 상기 제형은 전체 양에 대해 예를 들어 0.075 내지 30% w/w, 바람직하게는 0.2 내지 20% w/w 및 가장 바람직하게는 0.4 내지 15% w/w의 양으로 활성 성분을 함유하는 국소 젤, 스프레이, 연고 또는 크림으로서, 또는 좌약으로서 적용되는 것이 바람직하다. 연고로 제형화시키는 경우에, 활성 성분은 파라핀 또는 수훈화성 연고 베이스와 함께 사용될 수 있다.

대안적으로, 활성 성분은 수중유형 크림 베이스를 사용하여 크림으로 제형화될 수 있다. 필요에 따라, 크림 베이스의 수성상에는, 예를 들어 30% w/w 이상의 다가 알코올, 예컨대 프로필렌 글리콜, 부탄-1,3-디올, 만니톨, 소르비톨, 글리세롤, 폴리에틸렌 글리콜 및 이들의 혼합물이 포함될 수 있다. 국소 제형은 바람직하게는, 피부 또는 그 밖의 치료해야 할 영역을 통해 활성 성분이 흡수 또는 침투되는 것을 향상시키는 화합물을 포함할 수 있다. 그러한 피부 침투 향상제의 예로는 디메틸су포시드 및 관련된 유사물이 있다. 본 발명의 화합물은 경피 장치(transdermal device)에 의해 투여될 수도 있다. 바람직하게는 국소 투여는 저장소 및 다공성 멤브레인 유형의 패치 또는 고체 매트릭스 변종 패치를 사용하여 수행될 것이다. 어느 하나의 경우에, 활성 성분은 저장소 또는 미소캡슐로부터 멤브레인을 통해, 피부 또는 수용체 점막과 접촉하는 활성 성분 침투가능한 접착제 내로 연속적으로 전달된다. 활성 성분이 피부를 통해 흡수되는 경우에, 활성 성분의 조절된 소정량의 흐름이 수용체 내로 투여된다. 미소캡슐의 경우에, 캡슐화제가 또한 멤브레인으로서 작용할 수 있다. 경피 패치에는 아크릴 에멀션과 같은 접착 시스템을 구비한 적합한 용매 시스템 내의 화합물, 및 폴리에스테르 패치가 포함된다. 본 발명의 에멀션의 유성 상은 공지된 방식으로 공지된 성분을 사용하여 제조될 수 있다. 이 상은 에멀션화제만을 포함할 수 있지만, 이는 지방, 오일, 또는 지방 및 오일 모두와 하나 이상의 에멀션화제의 혼합물을 포함할 수 있다. 바람직하게는, 친수성 에멀션화제가, 안정화제로서 작용하는 친유성 에멀션화제와 함께 포함된다. 또한, 오일과 지방이 모두 포함되는 것이 바람직하다. 또한, 안정화제를 함유하거나 함유하지 않은 에멀션화제는 소위 에멀션화되는 왁스(emulsifying wax)를 구성하며, 오일 및 지방과 함께 상기 왁스는 소위 에멀션화되는 연고 베이스를 구성하는데, 이 연고 베이스는 크림 제형의 유성의 분산된 상을 형성한다. 본 발명의 제형에 사용하기에 적합한 에멀션화제 및 에멀션 안정화제에는 특히 트윈 60, 스판 80, 세토스테아릴 알코올, 미리스틸 알코올, 글리세릴 모노스테아레이트 및 나트륨 라우릴 슬레이트가 포함된다. 제형에 대해 적합한 오일 또는 지방의 선택은 목적하는 미용학적 특성을 달성하는 가에 기초하여 이루어는데, 왜냐하면 사용될 대부분의 오일 내에서의 에멀션 약제 제형의 용해도가 매우 낮기 때문이다. 따라서, 크림은 튜브 또는 기타 용기로부터 누출되지 않도록 기름기가 없고, 얼룩이 없으며, 적당한 점도를 가진 세척가능한 제품인 것이 바람직하다. 디-이소아디페이트, 이소세틸 스테아레이트, 코코넛 지방산의 프로필렌 글리콜 디에스테르, 이소프로필 미리스테이트, 데실 올레이트, 이소프로필 팔미테이트, 부틸 스테아레이트, 2-에틸헥실 팔미테이트와 같은 직쇄 또는 분지쇄, 모노- 또는 2염기성 알킬 에스테르, 분지쇄 에스테르의 혼합물을 사용할 수 있다. 이들은 요구되는 특성에 따라 단독 또는 혼합하여 사용할 수 있다. 다르게는, 흰색 연질 파라핀 및/또는 액체 파라핀 또는 다른 미네랄 오일과 같은 고 응점 지질을 사용할 수 있다.

안구에 국소 투여하기 적합한 제제는 활성 성분을 적합한 담체, 특히 활성 성분을 위한 수성 용매에 용해 또는 현탁한 점안제를 또한 포함한다. 항염증성 활성 성분은 바람직하게는 이러한 제제중에 0.5 내지 20%, 이롭게는 0.5 내지 10%, 특히 약 1.5% w/w의 농도로 존재한다. 치료적 목적을 위해, 본 조합 발명의 활성 화합물은 통상 지시된 투여 경로에 적합한 하나 이상의 보조제와 혼합된다. 만일 경구 투여할 경우, 화합물은 락토스, 수크로오스, 전분 분말, 알칸산의 셀룰로오스 에스테르, 셀룰로오스 알킬 에스테르, 활석, 스테아르산, 마그네슘 스테아레이트, 산화마그네슘, 인산 및 황산의 나트륨 및 칼슘염, 젤라틴, 아카시아 검, 알긴산 나트륨, 폴리비닐파리돌리돈, 및/또는 폴리비닐 알콜과 혼합할 수 있고, 간편한 투여를 위해 정제화 또는 캡슐화할 수 있다. 이와 같은 캡슐 또는 정제는 히드록시프로필메틸 셀룰로오스에서 활성 화합물을 분산하여 제공함으로써 조절성 방출 제제를 포함할 수 있다. 비경구 투여를 위한 제제는 수성 또는 비수성 등장성 멸균 주사 용액 또는 현탁액의 형태일 수 있다. 이들 용액 또는 현탁액은 경구 제제에서 사용이 언급된 하나 이상의 담체 또는 희석제를 포함하는 멸균 분말 또는 과립으로부터 제조될 수 있다. 화합물은 물, 폴리에틸렌 글리콜, 프로필렌 글리콜, 에탄올, 옥수수유, 면실유, 땅콩 오일, 참깨 오일, 벤질 알콜, 소듐 클로라이드, 및/또는 여러 가지 버퍼에서 용해할 수 있다. 다른 보조제 및 투여경로는 약제학적 분야에서 매우 잘 알려져 있다.

1일당 체중의 킬로그램당 약 0.1 mg 내지 약 140 mg의 용량값이 상기의 질환을 치료하는데 유용하다(1일당 환자당 약 0.5 mg 내지 약 7 g). 단일 용량 형태를 생산하기 위한 담체 물질과 혼합될 수 있는 활성 성분의 함량은 치료될 숙주 및 특

정 투여경로에 따라 변화될 수 있다. 용량 단일 형태는 일반적으로 활성성분의 약 1 mg 내지 약 500 mg을 포함할 수 있다. 1일 용량은 1일당 1 내지 4회분으로 투여될 수 있다. 피부 질환의 경우, 본 발명의 화합물의 국소 제제를 1일 2번 내지 4번 영향받는 영역에 적용하는 것이 바람직 할 수 있다.

그러나, 모든 특정 환자에 대한 특정 용량 수치는 사용되는 특정 화합물의 활성, 연령, 체중, 건강, 성별, 식이, 투여시간, 투여경로 및 배출율, 약물 조합 및 치료를 받는 특정 질환의 중증도를 포함하는 다양한 인자에 의존할 수 있다고 이해된다.

비-인간 동물의 투여를 위해, 제제는 동물의 사료 또는 음료수에 첨가할 수 있다. 동물들이 식이와 함께 조성물의 치료적 으로 적합한 함량을 섭취할 수 있기 때문에 동물 사료 및 음료수에 제제화하는 것이 편리할 수 있다. 사료 또는 음료수에 첨가하기 위한 프리믹스로서 조성물이 존재하는 것도 편리할 수 있다. 바람직한 비-인간 동물은 사육하는 동물을 포함한다.

상기와 같이, 본 발명은 또한 I형 및 II형 당뇨병의 조합치료를 위한 방법 및 조성물을 제공한다. 일면에서, 본 발명은 중후군 X 또는 II형 당뇨병(비-인슐린-의존성 당뇨병)을 경험하거나 겪고 있는 환자의 심혈관 위험 프로필을 개선하기 위한 하 나 이상의 안지오텐신 변환 효소(ACE) 저해제와 조합된 화학식(I)의 화합물의 사용방법을 제공한다. 이 방법은 또한 II형 당뇨병에서 심장병, 뇌졸중 또는 심장마비에 대한 위험인자의 감소를 특징으로 한다.

이들 방법은 중후군 X 또는 II형 당뇨병을 경험하거나 겪고 있는 환자에서 고지혈증의 감소를 포함한다. 이들 방법은 저밀도 지질단백(LDL) 혈액 수치를 감소시키고 고밀도 지질단백(HDL) 혈액 수치를 증가시키는 방법을 포함한다. 이 방법은 또한 II형 당뇨병에서 죽상 동맥 경화증의 저해, 예방 또는 감소, 또는 그의 위험인자의 감소에 유용한 특징을 갖는다.

이 방법은 또한 II형 당뇨병에서 유리 지방산 혈액 수치 및 트리글리세라이드 수치의 감소를 포함한다.

본 발명에서 사용될 수 있는 ACE 저해제는 퀴나프릴, 라미프릴, 베라파밀, 캡토프릴, 딜티아젬, 클로니딘, 히드로클로르티 아지드, 베나제프릴, 프라조신, 포시노프릴, 리시노프릴, 아테놀롤, 에날라프릴, 페린드로프릴, 페린드로프릴 tert-부틸아민, 트란돌라프릴 및 모엑시프릴, 또는 이들 화합물의 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 포함한다.

본 발명은 또한 II형 당뇨병(비-인슐린-의존성 당뇨병)을 경험하거나 겪고 있는 환자, 바람직하게는 인간 II형 당뇨병 또는 중후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심혈관 또는 뇌혈관 위험 프로필을 개선하기 위한 화학식(I)의 PTPase 저해제의 사용방법을 제공한다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병 또는 중후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심장질환, 뇌졸중, 또는 심장마비의 위험 인자의 감소를 특징으로 한다.

본 발명은 또한 치료가 필요한 환자에서 II형 당뇨병 또는 중후군 X의 치료를 위한 하나 이상의 PTPase 저해제, 하나 이상의 바이구아니드제, 및 임의의 하나 이상의 설포닐우레아제의 약제학적 조합의 사용방법을 제공한다. 또한 치료가 필요한 환자에서 인슐린 내성 또는 고혈당증에 의해 매개되는 대사적 질환의 치료 또는 저해를 위한 이들 제제의 사용방법을 제공한다. 본 발명은 또한 치료가 필요한 환자에 혈액 글루코스 수치를 조절하는 방법을 포함한다.

각각의 이들 방법은 그의 필요를 요하는 환자에 약제학적 유효량의

- a) 화학식(I)의 PTPase 저해제; 및
- b) 바이구아니드제; 및
- c) 임의의 설포닐우레아제의 투여를 포함한다.

본 발명에 유용한 바이구아니드제(biguanide agent)는 메트포민 및 그의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 포함한다. 본 발명의 방법 및 조성물에 유용한 설포닐우레아제는 글리부라이드, 글리부라이드, 글리피지드, 글리메프리드, 클로르프로파미드, 톨부타미드, 또는 톨라자미드, 또는 이들 약물의 약제학적으로 허용되는 염 형태로 구성된 군에서 선택될 수 있다.

본 발명은 또한 중후군 X 또는 II형 당뇨병(비-인슐린-의존성 당뇨병), 바람직하게는 인간 II형 당뇨병을 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심혈관 위험 프로필을 개선하기 위한 미그리톨 또는 마카르보스와 같은 하나 이상의 알파-글리코시데이즈 저해제와 조합된 화학식(I)의 PTPase 저해제를 포함하는 약제학적 조성물 및 사용방법을 제공한다. 이들 방법은 필요를 요하는 환자에서 심장질환, 뇌졸중 또는 심장 마비에 대한 위험 인자의 감소를 특징으로 한다.

이들 방법은 II형 당뇨병에서 저밀도 지질단백(LDL) 혈액 수치의 감소 및 고밀도 지질단백(HDL) 혈액 수치의 증가를 위한 방법을 포함하는 II형 당뇨병에서 고지혈증의 감소를 포함한다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 죽상 동맥 경화증 또는 이의 위험 인자의 저해, 예방 또는 감소에 유용한 특징을 갖는다.

이들 방법은 또한 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 유리 지방산 혈액 수치 및 트리글리세라이드 수치의 감소를 포함한다.

본 발명에 사용될 수 있는 알파-글루코시데이즈 저해제는 미그리톨 또는 아카르보스 또는 이들 화합물의 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 포함한다.

본 발명은 또한 하기 질환을 경험하거나 겪고 있는 환자에서 증후군 X 또는 II형 당뇨병의 관리 및 심혈관 위험 프로필의 개선을 위한 본 발명의 PTPase 저해제 및 설포닐우레아제의 사용방법을 제공한다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병에서 심장병, 뇌졸중 또는 심장마비를 위해 환자에서 위험 인자의 감소를 특징으로 한다. 이들 방법은 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 고지혈증의 감소를 포함하고, 저밀도 지질단백(LDL) 혈액 수치, 고밀도 지질단백(HDL) 혈액 수치, 및 총 혈액 지질단백 수치의 감소를 위한 방법을 포함한다. 이들 방법은 또한 증후군 X 또는 II형 당뇨병을 경험하거나 겪고 있는 환자에서 죽상 동맥 경화증 및 이의 위험 인자의 저해, 예방 또는 감소를 특징으로 한다. 이들 방법은 또한 이같은 환자에서 유리 지방산 혈액 수치 및 트리글리세라이드 수치의 감소를 포함한다.

대표적 설포닐우레아제는 글리피지드, 글리부리드(글리벤클라미드), 클로르프로파미드, 톨부타미드, 톨라자미드, 및 글리메프리리드 또는 이들 약물의 약제학적으로 허용되는 염 형태를 포함한다.

또한, 본 발명은 본 발명의 PTPase 저해제 및 적어도 하나의 티아졸리딘디온제의 조합을 제공한다. 상기 조합은 치료가 필요한 환자에서 증후군 X 또는 II형 당뇨병의 치료, 저해 또는 유지에 유용하다. 따라서, 이 조합의 사용방법을 본 발명에서 제공한다. 이와 같이, 본 발명은 필요한 환자에서 인슐린 내성 또는 고혈당증에 의해 매개되는 대사 질환의 치료 또는 저해를 위한 이들 제제의 사용방법을 제공한다. 본 발명은 또한 치료가 필요한 환자에서 혈액 글루코스 수치를 조절하는 방법을 포함한다.

각각의 이들 방법은 그의 필요한 환자에게 약제학적 유효량의:

- a) 피오클리티존 및 로시클리티존, 또는 이들 약물의 약제학적으로 허용되는 염 형태에서 선택된 것과 같은 티아졸리딘디온제; 및
- b) 화학식 (I)의 화합물의 투여를 포함한다.

본 발명은 또한 하나 이상의 항지혈증제와 조합된 PTPase 저해제를 포함하는 약제학적 조성물 및 그의 사용방법을 제공한다. 상기 방법 및 조성물은 II형 당뇨병(비-인슐린-의존성 당뇨병), 바람직하게는 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심혈관 위험 프로필의 개선에 유용하다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심장병, 뇌졸중 또는 심장마비의 위험 인자의 감소를 포함한다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병에서 저밀도 지질단백(LDL) 혈액 수치의 감소 및 고밀도 지질단백(HDL) 혈액 수치의 증가를 포함하는 II형 당뇨병에서 고지혈증의 감소를 포함한다. 이들 조성물 및 방법은 또한 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 죽상 동맥 경화증, 또는 이의 위험 인자의 저해, 예방 또는 감소에 유용하다. 이같은 면에서, 상기 조성물 및 방법은 II형 당뇨병 또는 증후군 X를 경험하거나 겪고 있는 환자에서 유리 지방산 혈액 수치 및 트리글리세라이드 수치의 감소에 유용하다.

본 발명에 사용하기 적합한 대표적인 항지혈증제는 담즙산 억제제, 피브릭산 유도체, HMG-CoA 환원효소 저해제 및 니코틴산 화합물을 포함한다. 본 발명에 유용한 담즙산 억제제는 콜레티풀 및 콜레세벨람 및 그의 약제학적으로 허용되는 염을 포함한다. 본 발명에서 사용될 수 있는 피브릭산 유도체는 클리포피르레이트, 젬피브로질 및 폐토피브레이트를 포함한다. 본 발명에 유용한 HMG-CoA 환원효소 저해제는 세리바스타틴, 플루바스타틴, 아토르바스타틴, 로바스타틴, 프라바트스테틴 및 심바스타틴, 또는 그의 약제학적으로 허용되는 염을 포함한다. 니아신은 본 발명의 방법에 사용할 수 있는 니코틴산 화합물의 예이다. 또한 오르리스탯과 같은 리페이즈 저해제가 유용하다.

본 발명은 또한 화학식 (I)의 화합물 및 알도스 환원효소 저해제(ARI)의 조합인 약제학적 조성물을 제공한다. 상기 조합은 II형 당뇨병, 또는 이에 관련된 증상 및 질환의 치료, 저해 또는 예방을 위한 방법에 유용하다. 이들 방법은 이같은 치료가

필요한 환자에게 약제학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 및 ARI의 조합을 포함하는 약제학적 유효량의 조성물을 투여하는 것을 포함한다. 이들 조성물 및 방법은 당뇨병성 신증, 망막증, 각막증, 당뇨병성 포도막염, 백내장의 치료, 예방 또는 저해에 유용하다.

대표적인 적합한 ARI는 미국특허 제6,420,426호 및 제6,214,991호에 기재되어 있다.

화학식 (I)의 화합물 및 ARI의 조합은 또한 II형 당뇨병에서 심장병, 뇌졸중 또는 심장마비에 대한 위험 인자의 저해 또는 감소에 유용하다. 따라서, 이같은 면에서 본 발명은 II형 당뇨병에서 고지혈증 및/또는 저밀도 지질단백(LDL) 혈액 수치를 감소시키는데 유용하다. 또한 이같은 면에서, II형 당뇨병에서 죽상 동맥 경화증 또는 그의 위험 인자의 저해, 예방 또는 감소를 위한 방법을 포함한다. 이같은 면은 유리 지방산 혈액 수치 및 트리글리세라이드 수치의 저하를 포함한다.

본 발명은 또한 I형 또는 II형 당뇨병의 관리를 위한 화학식 (I)의 화합물 및 인슐린(들)의 사용방법을 제공한다. 따라서, 본 발명은 조합 치료, 즉, 화학식 (I)의 화합물을 인슐린과 조합하여 투여하는 것을 제공한다. 상기 조합 치료는 화학식 (I)의 화합물 및 인슐린의 동시 또는 순차적 투여를 포함한다. 이 면에 유용한 인슐린은 천연적으로 발생하는 인슐린 및 합성 인슐린을 포함한다.

본 발명의 방법 및 조합에 유용한 인슐린은 속효성 인슐린, 중시간 작용 인슐린, 지속성 인슐린, 및 중시간 작용 및 속효성 인슐린의 조합을 포함한다.

상업적으로 구입가능한 속효성 인슐린 생성물은 HUMALOG® 브랜드 리스프로 주사 (rDNA 오리진); HUMULIN® 표준 인간 주사, USP [rDNA 오리진]; HUMULIN 표준 U-500 농축 인간 주사, USP [rDNA 오리진]; Eli Lilly로부터 구입가능한 REGULAR ILETIN II (인슐린 주사, USP, purifiea pork); 및 NOVOLIN® 인간 인슐린 주사 및 VENOSULIN® BR 벼파화 표준 인간 주사(각각 Novo Nordisk Pharmaceuticals에 구입가능)을 포함한다.

본 발명에 유용한 상업적으로 구입가능한 중시간 작용 인슐린은, 제한되지는 않지만, HUMULIN®L 브랜드 LENTE® 인간 인슐린 [rDNA 오리진] 아연 혼탁액, HUMULIN® N NPH 인간 인슐린 [rDNA 오리진] 이소페인(isophane) 혼탁액, LENTE®ILETIN.RTM. II 인슐린 아연 혼탁액, USP, 돼지에서 정제됨, 및 Eli Lilly에서 구입가능한 NPH ILETIN® II 이소페인 인슐린 혼탁액, USP, 돼지에서 정제됨, Aventis Pharmaceuticals에서 구입가능한 LANTUS® 인슐린 글라진 [rDNA 오리진] 주사, 및 NOVOLIN L Lente® 인간 인슐린 아연 혼탁액 (제조합 DNA 오리진), 및 Novo Nordisk Pharmaceuticals, Inc, Princeton N.J에서 구입가능한 NOVOLIN N NPH 인간 인슐린 이소페인 혼탁액(제조합 DNA 오리진) 생성물을 포함한다.

본 발명의 방법 및 제제에 유용한 중시간 작용 및 속효성 인슐린 조합은, 예컨대, HUMALOG® Mix 75/25 (75% 인슐린 리스프로 프로타민 혼탁액 및 25% 인슐린 리스프로 주사), HUMULIN® 50/50 (50% 인간 인슐린 이소페인 혼탁액 및 50% 인간 인슐린 주사) 및 HUMULIN® 70/30 (70% 인간 인슐린 이소페인 혼탁액 및 30% 인간 인슐린 주사)(각각은 Eli Lilly 사로부터 구입가능)이다. 또한 Novo Nordisk Pharmaceuticals에서 구입가능한 조합생성물의 NOVALIN® 70/30 (70% NPH, 인간 인슐린 이소페인 혼탁액 및 30% 표준, 인간 인슐린 주사) 계통을 사용할 수 있다.

본 발명에서 유용한 상업적으로 구입가능한 지속성 인슐린은 Eli Lilly사로부터 구입가능한 HUMULIN® U Ultralente® 인간 인슐린 [rDNA 오리진] 연장된 아연 혼탁액을 포함한다.

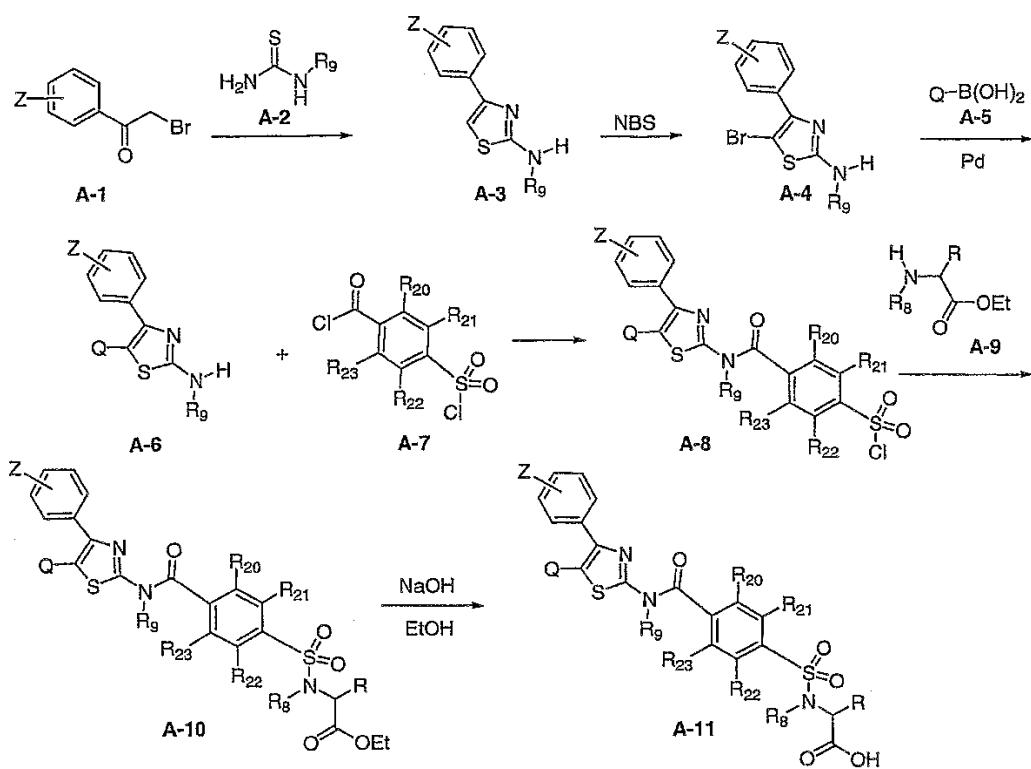
또한 본 발명의 방법에는 흡입성 인슐린 생성물, 예컨대, Pfizer사 및 Aventis SA에서 개발한 EXUBERA® 흡입성 인슐린 생성물이 유용하다.

각각의 이들 인슐린 생성물은 본 명세서에 참조로서 삽입된 관련된 섹션인 Physicians' Desk Reference, 55 Edition, 2001, published by Medical Economics Company, Inc. at Montvale, N.J.에서 각각의 제품에 대해 기술된 공지의 투여, 용량 및 요법을 사용하여 의약 전문가에 의해 직접 투여될 수 있다. 이 면에서, 본 발명은 예컨대, I형 또는 II형 당뇨병(비-인슐린-의존성 당뇨병), 바람직하게는 인간 II형 당뇨병을 경험하거나 겪고 있는 환자에서 심혈관 및 뇌혈관 위험 프로필을 개선하는 방법을 포함한다. 이들 방법은 또한 II형 당뇨병에서 심장병, 뇌졸중 또는 심장마비에 대한 위험 인자의 저해 또는 감소를 특징으로 한다.

본 발명의 화합물은 공지의 화학적 반응 및 방법을 사용함에 의해 제조될 수 있다. 본 발명의 화합물을 합성하는 대표적인 방법을 하기에 제시한다. 목적하는 표적 화합물을 위해 필요한 치환체의 특성은 대체로 합성의 바람직한 방법을 결정한다는 것이 이해된다. 이들 방법의 모든 가변기는 이들을 하기에 특정하지 않는다면 일반적인 기술되는 것에 따라 기술된다.

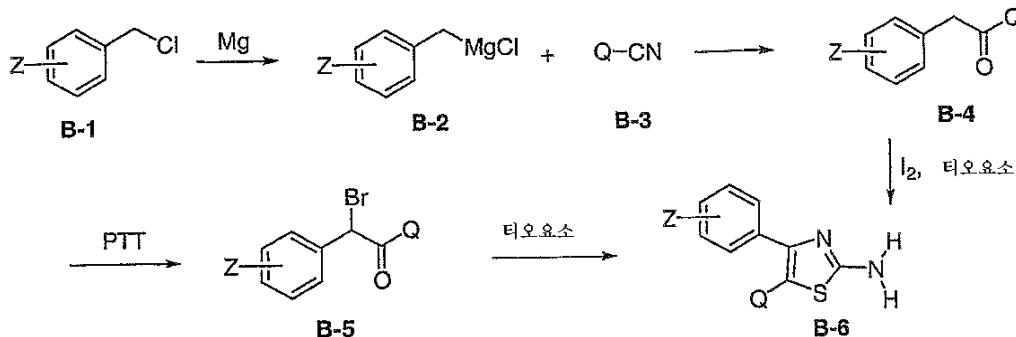
### 제조방법

화학식 (I)에서 A가 티아졸이고, L<sub>2</sub>가 -C(O)N(R<sub>9</sub>)- 및 L<sub>1</sub>이 -SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)알킬인 본 발명의 화합물은 하기의 일반적인 도식 A를 사용하여 치환된 2-브로모아세토페논으로부터 용이하게 제조될 수 있다. 이 방법에서, 목적하는 2-브로모아세토페논(A-1)은 알콜성 용매에서 티오요소(A-2)로 사이클화하여 티아졸 생성물(A-3)을 형성한다. NBS로 계속하여 브롬화하고, Q-보론산에 의한 커플화에 의해 중간체(A-6)를 제공한다. 만일 보론산을 쉽게 이용할 수 없다면, 다른 금속성 중간체, 예컨대, 주석 또는 아연 시약을 사용할 수 있다. 그 후, 2-아미노티아졸을 표준 조건을 사용하여 목적하는 산 클로라이드(A-7)로 커플화할 수 있다. 생성된 설포닐 클로라이드(A-8)를 계속해서 DNF 또는 디클로로메탄에서 트리에틸아민 또는 피리딘과 같은 염기로 처리함에 의해 아미노산 에스테르(A-9)로 커플화할 수 있다. 커플화 생성물(A-10)을 THE 또는 에탄올과 같은 용매에서 수성 NaOH로 처리함에 의해 가수분해하여 표적 화합물(A-11)을 생성할 수 있다.



### 도식 A

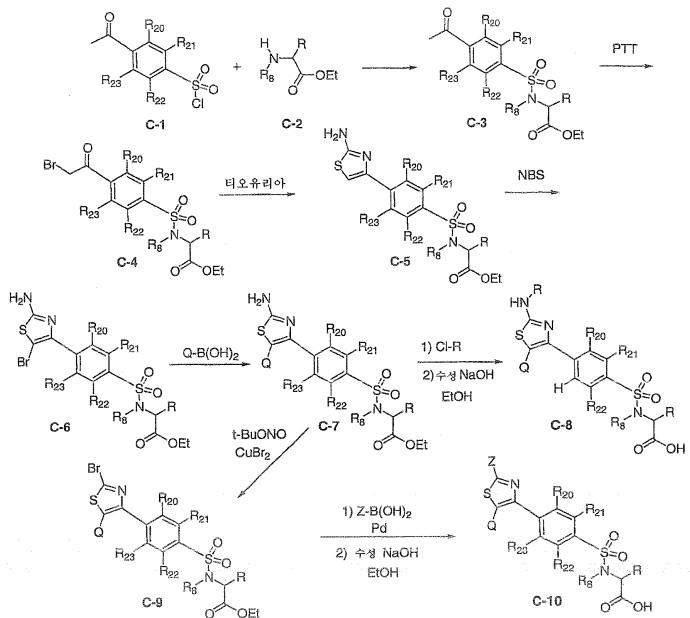
4,5-디치환된-2-티아졸 중간체의 다른 제조방법이 도식 B에 개요되어 있다. 여기는 치환된 벤질 클로라이드 또는 브로마이드(B-1)을 마그네슘으로 처리하여 상응하는 그리그나르드 시약(B-2)을 형성한다. 계속적인 니트릴(B-3)의 처리후 산 가수분해에 의해 케톤(B-4)을 얻는다. PTT로 브롬화하고, 티오요소로 계속적으로 사이클화하여 목적하는 아미노티아졸 중간체(B-6)를 얻는다. 다르게는, 케톤(B-4)을 요오드 및 티오요소로 처리함에 의해 직접 티아졸(B-6)로 전환할 수 있다.



## 도식 B

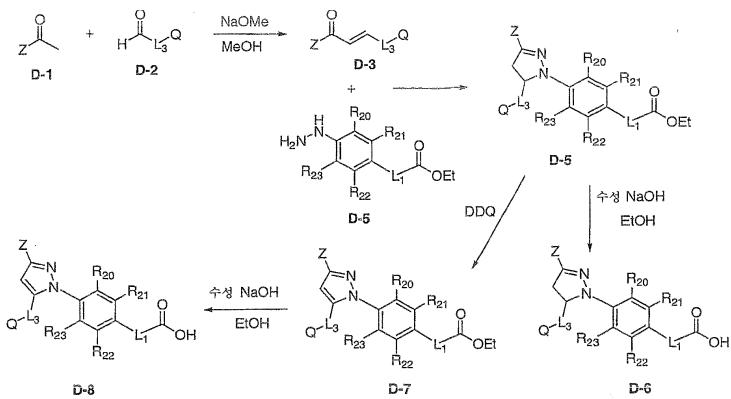
화학식 (I)에서 A가 티아졸, L<sub>2</sub> 및 L<sub>3</sub>이 결합이고, -L-C(R<sub>2</sub>)(R<sub>3</sub>)-이 -SO<sub>2</sub>N(R<sub>8</sub>)알킬인 본 발명의 화합물은 하기 일반적인 도식 C를 사용하여 치환된 2-브로모아세토페논으로부터 제조할 수 있다.

이 방법에서 설포닐 클로라이드(C-1)를 아미노알킬 산(C-2)으로 커플화하여 설푼아미드를 얻는다. PTT로 메틸 케톤(C-3)을 처리한 후 티오요소로 처리하여 2-아미노티아졸(C-5)을 얻는다. NBS로 5-위를 브롬화하여 브로마이드(C-6)를 얻고, 다양한 Q 그룹(C-7) 커플화할 수 있다. 많은 가능한 방법을 이 커플화 반응에 사용할 수 있다. 많은 통상의 방법의 일부는 아릴 또는 헤테로아릴 보론산, 팔라듐 시약을 갖는 주석 또는 아연 시약을 사용한다. 티아졸 중간체(C-7)상의 아미노기는 다양한 알킬화 또는 아실화 반응을 사용하여 기능화될 수 있다. 이들 중간체의 계속적인 가수분해로 표적 화합물(C-8)을 얻는다. 다르게는 중간체(C-7)를 t-BuONO 및 CuBr<sub>2</sub>로 처리하여 상응하는 브로마이드(C-9)를 얻을 수 있고, 상기와 같이 변형하여 표적 화합물(C-10)을 얻을 수 있다.



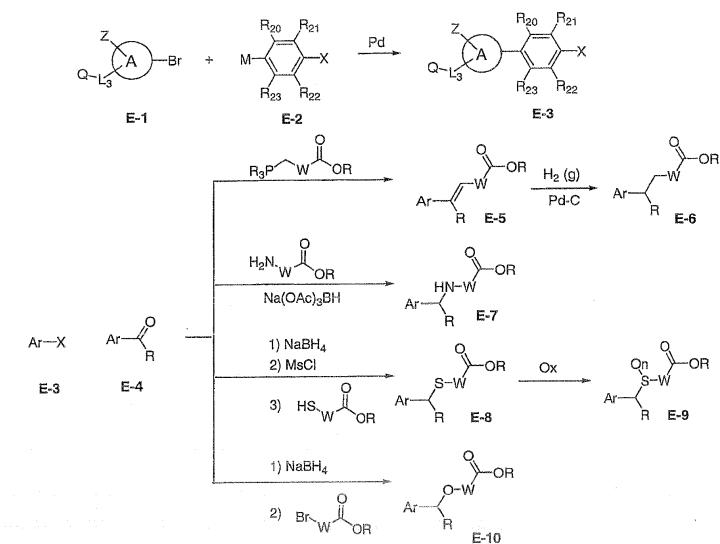
## 반응식 C

A가 치환된 피라졸 또는 피라졸린이고, L<sub>2</sub>은 전형적으로 반응식 D에서 기술하는 화학반응식을 사용하여 제조되는 본 발명의 화합물. 여기에서 메틸 케톤 D-1 및 알데히드 D-2는 알돌 축합을 수행하고 이를 알콜 용매중의 소듐 알콕사이드로 처리한 경우에 α,β-비포화 케톤 D-3을 형성한다. 중간체 D-3는 피라졸린 생성물 D-5을 수득하기 위하여, 적당하게 치환한 히드라진 D-4로 고리화될 수 있다. 가수분해는 피라졸린 생성물 D-6을 수득한다. 또한 중간체 D-5는 에스테르 중간체 D-7를 수득하기 위하여 DDQ로 산화될 수 있다. 가수분해는 요망되는 피라졸 표적 화합물 D-8을 수득한다.



## 반응식 D

다양한  $L_1$  링커 (화학식 I)는 가진 화합물을 일반 반응식 E에서 기술된 화학반응식을 사용하여 제조될 수 있다. 여기에서 아릴 또는 헤테로아릴 브롬 E-1을 요망되는  $L_1-CO_2R$  치환체를 제공하기 위하여, 개질될 수 있는 작용기 X를 함유하는 중간체 E-2에 커플링된다. 중간체 E-1 및 E-2 사이의 초기 커플링 반응은 종종 전이 금속 커플링 반응을 사용하여 수행될 수 있다. 이러한 유형의 가장 유용한 반응의 일부는 스즈키(Suzuki), 스틸(stille) 및 네기시(Negishi) 반응을 포함한다. 또한 일부 실시예에서는, 금속-M이 E-2중간체상에 있고, 할로겐 바람직하게는 Br 또는 I이 E-2중간체상에 있는 커플링 작용기를 역반응시키는 것이 보다 간편할 수 있다. 다양한 X 치환체가 특정  $L_1-CO_2R$ 를 가진 화합물을 제조하는데 유용할 수 있다. 일부 유용한 X 치환체는 셀폰아미드, 산, 에스테르, 알데히드, 케톤, 아미드, 니트로기, 아닐리노기, 하이드록시기, 설파이드 및 할라이드를 포함한다. 알데히드 또는 케톤과 동등한 X를 가진 중간체 E-3으로부터 제조된 표적 화합물의 일부 예는 반응식 E에서 도시된다.



## 반응식 E

위 텅형 시약을 가진 카르보닐 화합물의 처리는 불포화 유도체 E-5을 제공한다. 포화 화합물 E-6이 필요하다면, 예를 들어 탄소상의 팔라듐과 단순 수소화가 사용될 수 있다. 일부 경우에, 카르복시산 잔기(R=H)가 반응식에서 반응을 촉진시키기 위하여 에스테르로서 보호될 필요가 있을 수 있다. 카르보닐 화합물 E-4는 또한 상응하는 아민 E-7을 수득하기 위하여 환원 아민화 반응에서 소듐 트리아세톡시보로하이드라이드와 같은 환원제를 사용하여 아민 유도체와 커플링될 수 있다. 알데히드 또는 케톤 E-4를 소듐 보로하이드라이드와 환원시켜서 상응하는 알콜을 수득한다. 이 알콜을 메실레이트 또는 할라이드와 같은 이탈기로 순차적으로 변환시키고 티올과 같은 뉴클레오팜로 대치시켜서 설파이드 E-8을 수득하고, 이 설파이드는 요망된다면 솔폭사이드 또는 셀폰을 형성하기 위하여 산화될 수 있다. 유사하게 동일한 메실레이트 또는 할로겐

이탈기는 상응하는 아민 및 에테르 링커를 수득하기 위하여 아민 또는 알콜과 같은 다른 뉴클레오플로 대치될 수 있다. 소듐 보로하이드라이드 환원 생성물은 또한 개별적으로 단순 알킬화 또는 밀수노브 조건을 사용하여 알킬 할라이드 또는 치환된 폐놀로 직접 커플링될 수 있다.

당해 분야에서 기술을 가진 사람들은 하기 실시예로 증명되는 바와 같이 출발 물질 및 반응 조건이 다양할 수 있고, 반응 순서가 변경되고, 추가 단계가 본 발명에서 발생하는 화합물을 생성하기 위하여 이용된다는 것을 인식할 것이다. 일부 경우에, 특정 반응 작용의 보호가 상기 변형의 일부를 달성하는데 필요할 수도 있다. 일반적으로, 보호기의 필요뿐만 아니라 상기 기를 제거하고 부착하는데 필요한 조건이 유기 합성의 당업자에게 자명할 것이다.

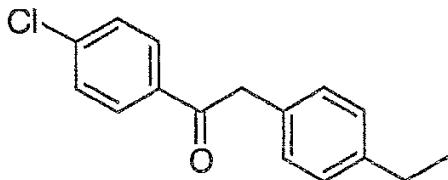
본 출원에서 언급된 모든 설명 및 참고문헌의 개시는, 특허를 포함하여 전체적으로 본원에서 참고문헌으로 통합되어 있다.

본 발명의 화합물의 제조는 하기 실시예에 의하여 추가로 예시되고, 이 실시예는 본 발명의 범위 또는 사상을 설명된 특정 방법 및 화합물로 한정하는 것으로 해석되지는 않는다. 모든 경우에, 다르게 특정되지 않는다면, 컬럼 크로마토그래피는 실리카겔 고체상을 사용하여 수행된다.

#### 실시예 1

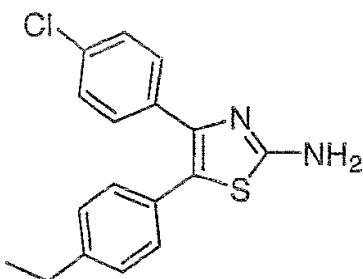
2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠설포닐아미노}-3-페닐-프로피온산의 제조

단계 1: 1-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-에탄온의 제조



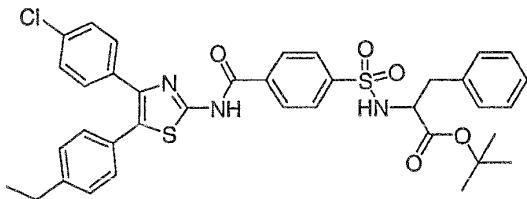
건조 질소 대기하에서 오븐 건조된 50ml 둥근 바닥 플라스크에서, THF 무수물중에서 마그네슘 터닝스 (2.92 g, 120 mmol)을 THF 무수물 (60ml)중의 4-에틸벤질클로라이드 (17.7g, 114 mmol)로 처리하고 30분 동안 교반시켰다. 교반시키는 동안에, 온도를 빙욕조를 사용하여 30 내지 38°C로 유지하였다. 생성된 자주색 용액을 추가 3시간 동안 실온에서 교반시키고 -10°C로 냉각시킨 후(NaCl-빙수욕) THF 무수물중의 4-클로로벤질 니트릴 용액(13.0 g, 94.6 mmol)을 10분 동안 첨가하였다. 첨가하는 동안에 온도를 -10 내지 -15°C로 유지하였다. 첨가가 완료된 이후에, 빙욕이 제거되고 생성된 용액을 추가 4시간 동안 교반시켰다. 한번 완료된 후에, 반응 혼합물을 0°C로 냉각시키고(빙욕조), 5% H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 수용액으로 pH 7 미만으로 산성화시켰다. 빙욕조 없이 추가 15분을 교반시킨 후에 상기 용액을 다이에틸 에테르(2 x 200 mL)로 추출하고 합쳐진 유기 추출물을 순차적으로 물(100 mL) 및 포화 NaCl 수용액(150 mL)으로 세척하였다. 생성된 용액을 MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고, 여과시키고 감압하에서 농축시킨 후에, 플래쉬 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 (헵탄 중의 0-15% 에틸 아세테이트) 1-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-에탄온을 황색 오일 (13.1 g, 54%)로 수득하였다.

단계 2: 4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일아민의 제조



건조 질소 대기하에서 오븐 건조된 100ml 둥근 바닥 플라스크에서, 1-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-에탄온 (13.1 g, 50.6 mmol), 티오유리아 (7.71 g, 101 mmol) 및 아이오다인 (12.8 g, 50.6 mmol)을 합쳐서 순 혼합물을 90°C로 가열하였다. 약 72 시간 동안 교반시킨 후에, H<sub>2</sub>O 50ml를 첨가하고 혼합물을 30분 동안 120°C 오일 욕조에서 가열시켰다. 실온으로 냉각시킨 후에, 반응 혼합물을 물에 끓고(300 mL), 1 N NaOH 수용액으로 pH 8 초과로 염기성화시켜서 디클로로메탄(2 x 350 mL)으로 추출하였다. 합쳐진 유기 추출물을 합쳐진 유기 추출물을 순차적으로 물 (200 mL) 및 포화 NaCl 수용액 (100 mL)으로 세척하고(150 mL), MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고, 여과시키고, 농축시켰다. 농축물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 (헵탄 중의 10-30% 에틸 아세테이트) 4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일아민 (5.32 g, 33%)을 수득하였다.

단계 3: 2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠설포닐아미노}-3-페닐-프로피온산 3차-부틸 에스테르



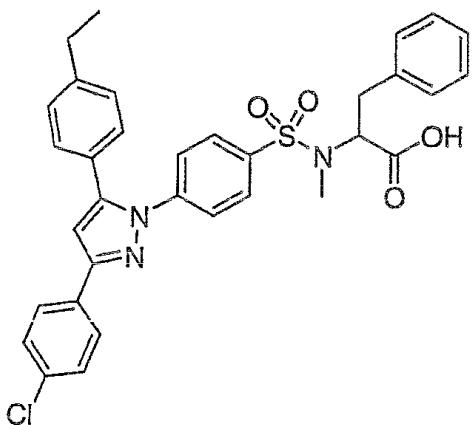
건조 질소 대기하에서 오븐 건조된 50ml 둥근 바닥 플라스크에서, 건조 1,2-디클로로에탄(10mL)중의 4-클로로설포닐-벤조산 용액(350 mg, 1.59 mmol)을 티오닐 클로라이드(0.35 mL, 4.0 mmol)로 처리한 후에 4시간 동안 100°C 오일 욕조에서 환류로 가열하였다. 실온으로 냉각한 후에, 용액을 감압하에서 농축시켰다. 생성된 잔류물을 디클로로메탄 무수물 (15 mL)로 용해시키고, 0 °C로 냉각한 후 디클로로메탄 (15 mL) 중의 4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일아민(500 mg, 1.59 mmol)을 대략 2분의 시기 동안 첨가하였다. 0 °C에서 약 1시간 동안 교반시킨 후에, 디이소프로필 에틸아민 (0.30 mL, 1.6 mmol)을 첨가하고 그 용액을 추가 3시간 동안 교반시켰다. 다음으로, H-Phe-Ot-Bu.HCl (652 mg, 1.59 mmol) 및 디이소프로필에틸아민 (0.69 mL, 4.0 mmol)을 첨가하고 그 용액을 1시간 동안 교반시켰다. 반응 혼합물을 실온으로 가온시킨 후에, 교반을 1시간 동안 지속시킨 후에 반응 혼합물을 감압하에서 농축시켰다. 생성된 잔류물을 플래쉬 컬럼 크로마토그래피로 정제하여(헵탄중의 20-30% 에틸 아세테이트) 2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤zen설포닐아미노}-3-페닐-프로피온산 3차-부틸 에스테르 (610 mg, 55%)을 황색 고체로 수득하였다.

단계 4: 2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠설포닐아미노}-3-페닐-프로피온산의 제조

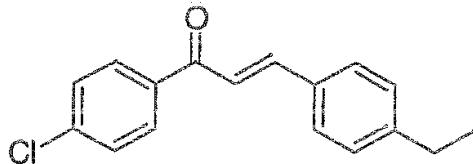
2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠설포닐아미노}-3-페닐-프로피온산 3차-부틸 에스테르 (1.20 g, 1.71 mmol)을 실온에서 트리플루오로아세트산 (6 mL)으로 처리하였다. 3시간 동안 교반한 후에 그 용액을 감압하에서 농축시키고 디에틸 에테르(3 mL)로 마쇄시켰다. 황색 침전물을 여과하고 디에틸 에테르 (2 x 3 mL)로 세척하여 2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠설포릴아미노}-3-페닐-프로피온산 (750 mg, 68%)을 연황색 고체로 수득하였다.

## 실시예 2

2-{(4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤젠설포닐)-메틸-아미노}-3-페닐-프로피온산의 제조

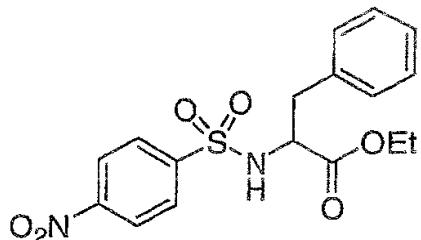


단계 1: 1-(4-클로로-페닐)-3-(4-에틸-페닐)-프로페논의 제조



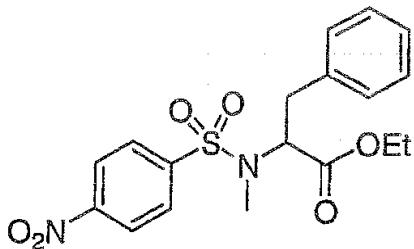
건조 메탄올 (25 mL)중의 4-클로로액토페논 (6.18 g, 10 mmol) 및 4-에틸벤즈알데히드 용액(5.76 mL, 10.5 mmol)을 소듐 메톡사이드(0.568 g, 10.5 mmol)로 처리하고 16시간 동안 실온에서 교반시켰다. 반응을 완결시킨 후에 그 용액을 0.5 N HC1 (25 mL)로 산성화시키고 생성된 침전물을 여과로 수집하였다. 미정제 생성물을 수용액중의 50% 메탄올로 세척하여(3 X 25 mL) 1-(4-클로로-페닐)-3-(4-에틸-페닐)-프로펜온 (10.6 g, 98%)을 수득하였다. 추가 정제를 필요로하지 않았다.

단계 2: 2-(4-니트로-벤zen설포닐아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 제조



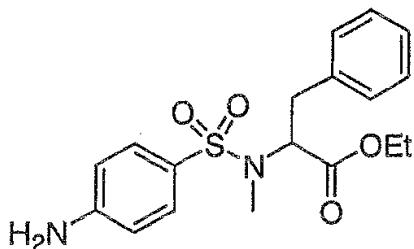
디클로로메탄 (50 mL)중의 페닐알라닌 에틸 에스테르 히드로클로라이드 (3.0 g, 10 mmol) 및 N,N-디이소프로필에틸아민 용액(3.8 mL, 22 mmol)을 0 °C로 냉각하고(빙수 욕조), 4-니트로벤zen설포닐 클로라이드 (2.33 g, 10.5 mmol)로 처리하였다. 30분 후에 그 용액을 실온으로 가온시키고 교반을 추가 4시간 동안 지속하였다. 반응이 완결된 후에, 반응 혼합물을 물(100mL)로 희석하고 유기 층을 디클로로메탄 (3 x 50 mL)으로 추출하였다. 합쳐진 유기 추출물을 MgSO4로 건조시키고 여과하고 농축시켰다. 플래쉬 크로마토그래피로 정제하여(헵탄중의 10% 에틸 아세테이트) 2-(4-니트로-벤zen설포닐아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (3.56g, 94%)을 흰결정 고체로 수득하였다.

단계 3: 2-(메틸-(4-니트로-벤zen설포닐)-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 제조



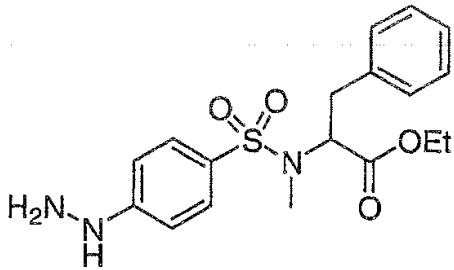
DMF (25 mL) 중의 N-(4-나트로벤젠설포닐)-페닐알라닌 에틸 에스테르 (3.8 g, 10 mmol) 및 세슘 카보네이트 (3.58 g, 11 mmol) 용액을 10분 동안 교반 시킨 후에, 메틸 아이오다이드 (0.75 mL, 12 mmol)로 처리하였다. 추가 16시간을 교반 시킨 후에, 반응 혼합물을 여과하고, 그 여과물을 물(50 mL)로 희석하고 에틸 아세테이트 (3 X 50 mL)로 추출하였다. 합쳐진 유기 추출물을 MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고 여과하고 농축시켰다. 플래쉬 크로마토그래피로 정제하여(헵탄중에 10% 에틸 아세테이트) 2-[메틸-(4-나트로-벤젠설포닐)-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (3.5 g, 90%)을 흰결정 고체로 수득하였다.

#### 단계 4: 2-[(4-아미노-벤젠설포닐)-메틸-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 제조



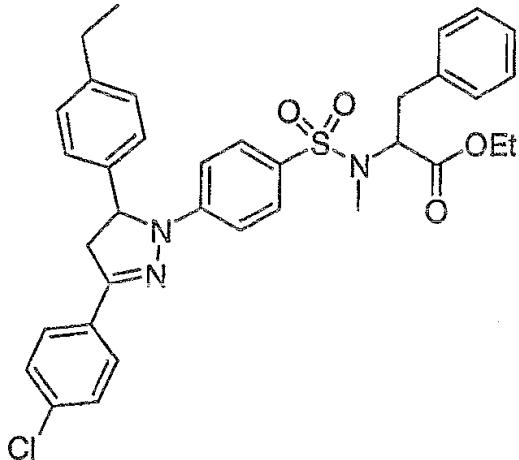
에틸 아세테이트(25 mL) 중의 2-[메틸-(4-나트로-벤젠설포닐)-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (3.5 g, 9.0 mmol) 및 탄소상의 팔라듐 (0.4 g) 용액을 실온에서 4시간 동안 20 psi에서 수소 기체로 처리하였다. 생성된 용액을 여과하고 농축하였다. 추가 정제가 필요하지 않았다.

#### 단계 5: 2-[(4-하이드라지노-벤젠설포닐)-메틸-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 히드로클로라이드의 제조



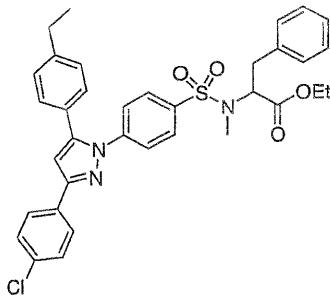
진한 HCl (12 mL) 중의 2-[(4-아미노-벤젠설포닐)-메틸-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 용액을 0°C로 냉각시키고(빙욕) 온도가 5 °C초과하여 상승하지 않는 속도로 NaNO<sub>2</sub> (5mL 물중의 0.69 g, 10 mmol) 수용액으로 조심스럽게 처리하였다. 교반을 1.5시간 동안 지속하였다. 완료되면, 그 용액을 진한 HCl (12 mL) 중에 SnCl<sub>2</sub>의 분리된 빙냉 용액 (7.11 g, 37.5 mmol)으로 이동시키고 천천히 2시간 동안 지속적인 교반으로 실온으로 가온시켰다. 생성된 침전물을 여과로 수집하고 벤젠으로 세척하여(3 x 100 mL) 2-[(4-하이드라지노-벤젠설포닐)-메틸-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 히드로클로라이드(xx g, 98%)을 흰색 고체로 수득하였다.

#### 단계 6: 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-4,5-디히드로-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 제조



에탄올 중의(50 mL) 1-(4-클로로-페닐)-3-(4-에틸-페닐)-프로펜온(0.270 g, 1 mmol) 및 2-[(4-하이드라지노-벤젠설포닐)-메틸-아미노]-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 히드로클로라이드(0.452 g, 1.1 mmol)을 가열하여 4시간 동안 환류시켰다. 실온으로 냉각시킨 후에 그 용액을 농축시키고 물로 희석하고(50 mL) 에틸 아세테이트(3 X 50 mL)로 희석하였다. 합쳐진 유기 추출물을  $MgSO_4$ 로 건조시키고 여과시키고 농축시켰다. 플래시 컬럼 크로마토그래피로 정제하여(헵탄 중의 10% 에틸 아세테이트) 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-4,5-디히드로-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (0.49 g, 78%)를 수득하였다.

단계 7: 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 제조



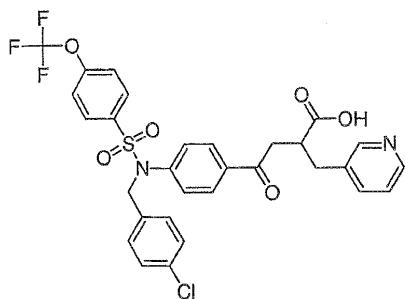
벤젠 (20 ml) 중 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-4,5-디히드로-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (0.25 g, 0.4 mmol)의 용액을 2,3-디클로로-5,6-디시아노-1,4-벤조퀴논 (DDQ) (0.136 g, 0.6 mmol)으로 처리하고, 6 시간 동안 환류하였다. 실온으로 냉각시킨 후에, 얻어진 용액을 농축시키고, 플래시 컬럼 크로마토그래피 (헵탄 중 10% 에틸 아세테이트)로 정제하여 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤zen설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르 (0.232 g, 95%)를 수득하였다.

단계 8: 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산의 제조

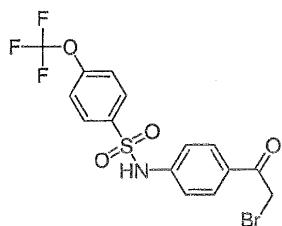
무수 THF (2 ml) 및 메탄올 (6 ml) 중 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤젠설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 에틸 에스테르의 용액을 10% v/v 수성 KOH (1 mL, 1 mmol)로 처리하였다. 2 시간 동안 교반시킨 후에, 용액을 0.5 N HCl로 pH 2 내지 3까지 산성화시키고, 에틸 아세테이트 (3 x 15 mL)로 추출하고, 농축시켰다. 플래시 컬럼 크로마토그래피 (헵탄 중 50% 에틸 아세테이트)로 정제하여 백색 고형물의 2-({4-[3-(4-클로로-페닐)-5-(4-에틸-페닐)-피라졸-1-일]-벤zen설포닐}-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산 (0.160 g, 85%)을 수득하였다.

실시예 3

## 4-{4-[(-클로로벤질)-(4-트리플루오로메톡시벤젠술포닐)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-파리딘-3-일 메틸-부티르산



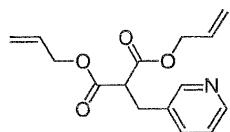
## 단계 1: N-[4-(2-브로모아세틸)-페닐]-4-트리플루오로메톡시벤젠술폰아미드



4-트리플루오로메톡시벤젠술포닐 클로리드 (3.18 g, 2.07 mL, 1.22 mmol)를 무수 메틸렌 클로리드 (50 ml) 중 4'-아미노아세토페논 (1.5 g, 1.11 mmol) 및 트리에틸아민 (3.1 mL, 2.22 mmol)의 용액에 첨가하였다. 16 시간 동안 교반하여 반응시킨 후, 물 (50 ml)에 붓고, 디에틸 에테르 (3 x 30 mL)로 추출하였다. 합쳐진 추출물을 0.5 N 염산 (2 x 10 mL), 물 및 마지막으로 염수로 세척하였다. 에테르성 용액을 무수  $MgSO_4$ 로 건조시키고, 여과하고 진공 중에서 농축하였다. 생성물 메틸 케톤을 추가 정제없이 이후 브롬화 단계에서 사용하였다.

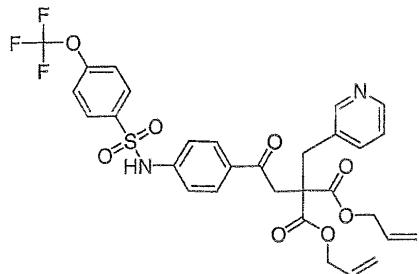
페닐트리메틸암모늄 트리브로미드 (4.68 g, 1.22 mmol)를 무수 디옥산 (50 ml) 중 메틸 케톤 (전 단계에서 제조됨)의 용액에 첨가하였다. 실온에서 3 시간 동안 교반하여 반응시킨 후, 물 (50 ml)에 붓고, 디에틸 에테르 (3 x 30 mL)로 추출하였다. 합쳐진 추출물을 물 및 염수로 세척하였다. 에테르성 용액을 무수  $MgSO_4$ 로 건조하고, 여과하고 진공 중에서 농축하였다. 용리액으로서 20% 에틸 아세테이트/헵탄을 사용하여 플래시 컬럼 크로마토그래피로 생성물을 정제하여 백색 고형물의 표제 화합물 (4.36 g, 89%)을 수득하였다;  $^1H$  NMR ( $CDCl_3$ , 300 MHz): δ 7.92 (4H, d,  $J = 8$  Hz, Ar-H), 7.38 (2H, d,  $J = 8$  Hz, Ar-H), 7.20 (3H, m, Ar-H, NH), 4.38 (2H, s,  $CH_2Br$ ).

## 단계 2: 2-파리딘-3-일 메틸-말론산 디알릴 에스테르



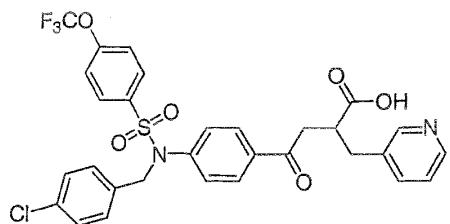
무수 THF (30 mL) 중 디알릴 말로네이트 (3.0 g, 16.3 mmol)의 용액을 조심스럽게 무수 THF (25 mL) 중 수소화 나트륨 (95%, 900 mg, 36 mmol)의 교반된 혼탁액에 첨가하였다. 얻어진 용액을 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 무수 THF (25 mL) 중 3-(요오도메틸)파리딘 히드로요오디드 (6.24 g, 18 mmol)의 용액을 적가하고, 얻어진 용액을 실온에서 16 내지 24 시간 동안 (TLC로 조절) 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (50 ml)에 붓고, 에틸 아세테이트 (3 x 50 mL)로 추출하였다. 합쳐진 추출물을 물, 염수로 세척하고, 무수  $MgSO_4$ 로 건조시키고, 여과하고 진공 중에서 농축하였다. MeOH로부터 분쇄하고 여과하여 백색 고형물의 표제 화합물 (4.03g, 90%)을 수득하였다;  $^1H$  NMR ( $CDCl_3$ , 300 MHz): δ 8.48 (2H, m), 7.38 (1H, td,  $J = 8, 2$  Hz, Ar-H), 7.20 (2H, dd,  $J = 8, 5$  Hz), 5.82 (2H, m), 5.26 (4H, m), 4.60 (4H, m), 3.88 (1H, t,  $J = 7$  Hz), 3.21 (2H, d,  $J = 7$  Hz).

단계 3: 2-{2-옥소-2-[4-(4-트리플루오로메톡시벤젠술포닐아미노]-에틸}-2-피리딘-3-일메틸-말론산 디알릴 에스테르



무수 THF (30 mL) 중 2-피리딘-3-일메틸-말론산 디알릴 에스테르 (1.15g, 4.18 mmol)의 용액을 무수 THF (25 mL) 중 수소화 나트륨 (95%, 232 mg, 9.2 mmol)의 교반된 혼탁액에 첨가하였다. 얻어진 용액을 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 무수 THF (25 mL) 중 N-[4-(2-브로모아세틸)-페닐]-4-트리플루오로메톡시-벤젠술폰아미드 (2.01 g, 4.6 mmol)의 용액을 적가하고, 얻어진 용액을 50°C에서 5 시간 동안 (TLC로 조절) 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (50 ml)에 끊고, 에틸 아세테이트 (3 x 50 mL)로 추출하였다. 합쳐진 추출물을 물, 염수로 세척하고, 무수 MgSO<sub>4</sub>로 건조시키고, 여과하고 진공 중에서 농축하였다. 용리액으로서 20% 에틸 아세테이트/헵탄을 사용하여 플래시 컬럼 크로마토그래피로 생성물을 정제하여 백색 고형물의 표제 화합물 (4.36 g, 89%)을 수득하였다; 1H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): δ 8.48 (1H, d, J = 3 Hz), 8.20 (1H, s), 7.90 (2H, d, J = 8 Hz), 7.78 (2H, d, J = 8 Hz), 7.42 (1H, d, J = 7 Hz), 7.32 (3H, m), 7.20 (1H, m), 7.12 (2H, d, J = 8 Hz), 5.88 (2H, m), 5.29 (4H, m), 4.62 (4H, s), 3.58 (2H, s), 3.50 (2H, s); ESI-LCMS e/z C<sub>30</sub>H<sub>27</sub>F<sub>3</sub>N<sub>2</sub>O<sub>8</sub>S에 대한 이론치: 632.610, 실험치 633 (M+ H)<sup>+</sup>.

단계 4: 4-{[(-클로로벤질)-(4-트리플루오로메톡시벤젠술포닐)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-피리딘-3-일메틸-부티르산



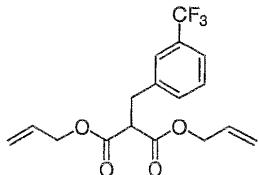
무수 THF (15 mL) 중 2-{2-옥소-2-[4-(4-트리플루오로메톡시벤젠술포닐아미노]-에틸}-2-피리딘-3-일메틸-말론산 디알릴 에스테르 (1.06g, 1.67 mmol)의 용액을 무수 THF (10 mL) 중 수소화 나트륨 (95%, 47 mg, 1.84 mmol)의 교반된 혼탁액에 첨가하였다. 얻어진 용액을 실온에서 1 시간 동안 교반하였다. 무수 THF (25 mL) 중 4-클로로벤질 클로리드 (0.3 g, 1.84 mmol)의 용액을 적가하고, 얻어진 용액을 50°C에서 5 시간 동안 (TLC로 조절) 교반하였다. 반응 혼합물을 물 (50 ml)에 끊고, 에틸 아세테이트 (3 x 50 mL)로 추출하였다. 합쳐진 추출물을 물, 염수로 세척하고, 무수 MgSO<sub>4</sub>로 건조하고, 여과하고, 진공 중에서 농축하여 N-알킬화된 디알릴 에스테르를 수득하였다.

디알릴 에스테르를 디옥산 (15 ml) 중에 재용해시켰다. 테트라카이스-(트리페닐포스핀)-팔라듐(O) (5 mg) 및 트리에틸아민 (0.1 mL)을 교반된 용액에 첨가한 후, 100°C에서 30 분 동안 가열하여 반응시키고, 실온으로 냉각시키고, 진공 중에서 농축하였다. 용리액으로서 20% 에틸 아세테이트/헵탄을 사용하여 플래시 컬럼 크로마토그래피로 생성물을 정제하여 백색 고형물의 표제 화합물 (846 mg, 80%)을 수득하였다; R<sub>f</sub> 0.30 (디클로로메탄 중 10% 메탄올), 1H NMR (MeOH-d<sub>4</sub>, 300 MHz): δ 8.42 (1H, s), 8.36 (1H, d, J = 3 Hz), 7.84 (2H, d, J = 8 Hz), 7.76 (3H, m), 7.42 (2H, d, J = 8 Hz), 7.35 (1H, dd, J = 8, 3 Hz), 7.20 (5H, m), 4.82 (2H, s), 3.42 (1H, m), 3.20 (1H, m), 3.02 (2H, m), 2.92 (2H, m); ESI-LCMS e/z C<sub>30</sub>H<sub>24</sub>ClF<sub>3</sub>N<sub>2</sub>O<sub>6</sub>S에 대한 이론치 : 633.041, 실험치 633 [M+ H(<sup>35</sup>Cl)]<sup>+</sup>, 635 [M+ H(<sup>37</sup>Cl)]<sup>+</sup>.

## 실시예 5

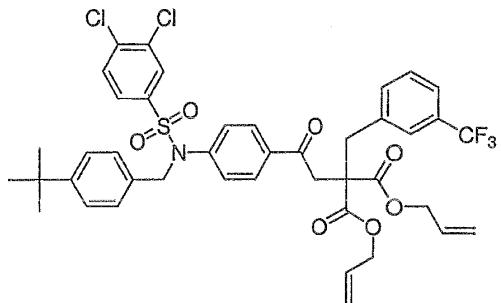
4-{4-[(4-3차-부틸벤질)-(3,4-디클로로벤젠술포닐)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-부티르산

단계 1: 2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르



2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를, 말론산 디알릴 에스테르 (4.5 g, 24.5 mmol), 수소화 나트륨 (95%, 680 mg, 27 mmol) 및 3-트리플루오로메틸벤질 브로미드 (6.45 g, 27 mmol)을 이용하여 2-피리딘-3-일메틸-말론산 디알릴 에스테르와 유사한 방법으로 제조하여 무색의 표제 화합물 (6.87 g, 82%)를 수득하였다.  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 300 MHz):  $\delta$  7.56 (2H, d,  $J$  = 8 Hz), 7.32 (2H, d,  $J$  = 8 Hz), 5.82 (2H, m), 5.24 (4H, m), 4.59 (4H, m), 3.72 (1H, t,  $J$  = 7 Hz), 3.31 (2H, d,  $J$  = 7 Hz).

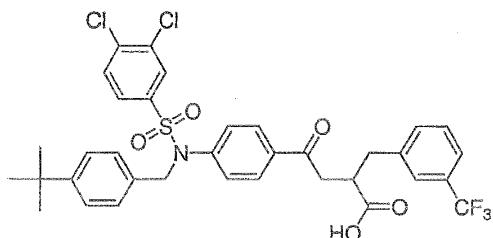
단계 2: 2-(2-{4-[(4-3차-부틸벤질)-(3,4-디클로로벤젠술포닐)-아미노]페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르



2-(2-{4-[(4-3차-부틸벤질)-(3,4-디클로로벤젠술포닐)-아미노]페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를 제 2의 단계의 알킬화제로서 N-{4-(2-브로모아세틸)페닐]-3,4-디클로로벤젠-술폰아미드를 사용하여 상기 기술된 것과 유사한 방법으로 합성하여 N-알킬화된 생성물 2-{2-[4-(3,4-디클로로벤젠술포닐아미노)-페닐]-2-옥소에틸}-2-(3-트리플루오로메틸-벤질)-말론산 디알릴 에스테르를 수득하였다.

상기 기술된 조건하에서, 이러한 중간체와 4-3차-부틸벤질 브로미드를 N-알킬화시켜 N,N-디알킬화된 생성물을 수득하였다.  $^1\text{H}$  NMR ( $\text{CDCl}_3$ , 300 MHz):  $\delta$  7.73 (1H, d,  $J$  = 8 Hz), 7.69 (1H, d,  $J$  = 2 Hz), 7.56 (2H, m), 7.47 (1H, m), 7.39 (1H, m), 7.32 (2H, m), 7.26 (4H, m), 7.10 (3H, m), 5.88 (2H, m), 5.26 (4H, m), 4.72 (2H, s), 4.64 (4H, m), 3.58 (2H, s), 3.42 (2H, s), 1.26 (9H, s).

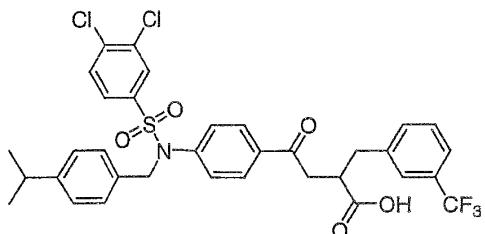
단계 3: 4-{4-[(4-3차-부틸벤질)-(3,4-디클로로벤zen술포닐)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-부티르산



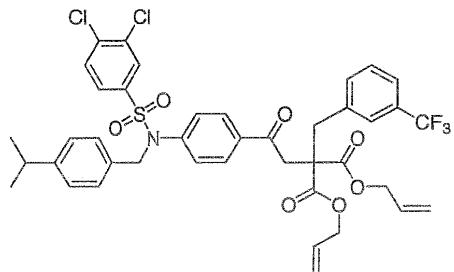
표제 화합물을 2-(2-{4-[4-3차-부틸벤질)-(3,4-디클로벤젠술포닐)-아미노]-페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를 비누화 및 탈카르복실화시켜 제조하였다. 용리제로서 디클로로메탄 중 5% 메탄올을 사용하여 플래시 컬럼 크로마토그래피를 이용하여 생성물을 정제하여 베이지 고형물을 갖는 표제 화합물을 수득하였다; Rf 0.62 (디클로로메탄 중 10% 메탄올) : 1H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): δ 7.77 (1H, d, J = 8 Hz), 7.66 (2H, m), 7.28 – 7.54 (8H, m), 7.24 (2H, d, J = 9 Hz), 7.10 (2H, d, J = 9 Hz), 4.71 (2H, s), 3.16 – 3.38 (3H, m), 2.93 (2H, m), 1.25 (9H, s); ESI-LCMS e/z C<sub>35</sub>H<sub>32</sub>Cl<sub>2</sub>F<sub>3</sub>NO<sub>5</sub>S에 대한 이론치 : 706.606, 실험치 706 (M+ H, <sup>35</sup>Cl, <sup>35</sup>Cl)<sup>+</sup>.

## 실시예 6

4-{4-[(3,4-디클로로벤젠술포닐)-(4-이소프로필벤질)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-부티르산



단계 1: 2-(2-{4-[4-디클로로벤젠술포닐-(4-이소프로필벤질)-아미노]-페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르



2-(2-{4-[4-디클로로벤젠술포닐-(4-이소프로필벤질)-아미노]-페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를, 2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를 N-{4-(2-브로모아세틸)-페닐}-3,4-디클로로벤젠-술폰아미드와 알킬화를 통해 합성하고, 이후 이러한 중간체를 4-이소프로필벤질 브로미드를 N-알킬화시켜 N,N-디알킬화된 생성물을 수득하였다. 1H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): δ 7.73 (1H, d, J = 8 Hz), 7.69 (1H, s), 7.56 (2H, m), 7.47 (1H, m), 7.36 (3H, m), 7.26 (4H, m), 7.10 (3H, m), 5.89 (2H, m), 5.30 (4H, m), 4.71 (2H, s), 4.66 (4H, m), 3.56 (2H, s), 3.43 (2H, s), 2.83 (1H, sept, J = 7 Hz), 1.20 (3H, s), 1.18 (3H, s).

단계 2: 4-{4-[(3,4-디클로로벤zen술포닐)-(4-이소프로필벤질)-아미노]-페닐}-4-옥소-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-부티르산

표제 화합물을 2-(2-{4-[4-디클로로벤젠술포닐-(4-이소프로필벤질)-아미노]-페닐}-2-옥소에틸)-2-(3-트리플루오로메틸벤질)-말론산 디알릴 에스테르를 비누화 및 탈카르복실화시켜 제조하였다. 용리제로서 디클로로메탄 중 5% 메탄올을 사용하여 플래시 컬럼 크로마토그래피를 사용하여 정제하여 크림형 고형물을 갖는 표제 화합물을 수득하였다; Rf 0.60 (디클로로메탄 중 10% 메탄올) : 1H NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): δ 7.76 (1H, d, J = 8 Hz), 7.70 (2H, m), 7.28 – 7.62 (8H, m), 7.24 (2H, m), 7.10 (2H, m), 4.70 (2H, s), 3.34 (1H, m), 3.20 (2H, m), 2.89 (2H, m), 2.81 (1H, sept, J = 7 Hz), 1.19 (3H, s), 1.17 (3H, s); ESI-LCMS e/z C<sub>34</sub>H<sub>30</sub>Cl<sub>2</sub>F<sub>3</sub>NO<sub>5</sub>S에 대한 이론치 : 692.579, 실험치 692 (M+ H, <sup>35</sup>Cl), 3501, <sup>35</sup>Cl<sup>1</sup><sup>+</sup>.

## 실시예 7

하기 화합물을 필수적으로 반응식 및 실시예 1 내지 6에서 상술된 방법 및 공정에 따라 제조하였다.

본 발명의 다른 화합물은 하기와 같으며, 이는 캠브리지 (Cambridge, MA)에서 "Cambridgesoft.com"에 의해 판매되는 캠드로우 (ChemDraw v. 6.02)를 사용하여 명명되었다.

### 화합물 번호 화합물명

- 1 N-{{[4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-트리아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 2 N-{{4-[3-(4-메톡시페닐)-5-(4-펜틸페닐)-4,5-디히드로-1H-파라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 3 N-{{[4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메톡시페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 4 N-메틸-N-[(4-{5-(4-펜틸페닐)-3-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-4,5-디히드로-1H-파라졸-1-일}페닐]술포닐]페닐알라닌;
- 5 N-{{4-[3-(4-메톡시페닐)-5-(4-펜틸페닐)-1H-파라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 6 N-메틸-N-[(4-{5-(4-펜틸페닐)-3-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1H-파라졸-1-일}페닐]술포닐]페닐알라닌;
- 7 N-{{4-[5-(4-부톡시페닐)-3-(4-메톡시페닐)-1H-파라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 8 2-벤질-4-옥소-4-[3-({[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]부탄산;
- 9 N-{{[4-({[4-(3-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 10 N-{{4-[5-(4-օ소프로필페닐)-3-(4-메톡시페닐)-1H-파라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 11 N-{{[4-({[4-(3-클로로-4-메틸페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 12 N-{{[4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}-N-메틸페닐알라닌;
- 13 메틸 (2S)-2-[4-((비페닐-4-일메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파노에이트;
- 14 N-{{[4-({[4-(4-브로모페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 15 N-{{[4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;
- 16 (2S)-2-[4-((비페닐-4-일메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 17 N-[(4-{[4,6-비스(4-메톡시페닐)파리미딘-2-일]아미노}페닐)술포닐]-N-메틸-L-페닐알라닌;
- 18 N-메틸-N-({4-[5-(4-펜틸페닐)-3-(트리플루오로메틸)-1H-파라졸-1-일]페닐}술포닐)페닐알라닌;
- 19 2-벤질-4-[4-({[2-니트로-4-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;
- 20 2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-({[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 21 2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-({[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

- 22 (2S)-2-[3-((비)페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 23 2-{4-{{(4-브로모페닐)술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;
- 24 N-{{4-[2-[(4-클로로벤조일)아미노]-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 25 (2S)-2-[4-((2-나프틸메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 26 N-{{4-{4-브로모-3-(4-메톡시)페닐}-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-피라졸-1-일}페닐}술포닐]-N-메틸페닐알라닌;
- 27 N-{{4-[5-(4-브로모페닐)-3-(4-메톡시)페닐]-1H-피라졸-1-일}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 28 2-{4-[(4-브로모벤조일)아미노]-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;
- 29 N-{{4-[(6-브로모-4-페닐퀴나졸린-2-일)아미노]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 30 N-{{4-[2-[(시클로펜틸아세틸)아미노]-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;
- 31 N-{{4-[2-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;
- 32 N-{{4-[5-(4-에틸페닐)-2-(6-메톡시피리딘-3-일)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;
- 33 2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{(4-클로로-3-니트로페닐)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;
- 34 N-{{4-{{4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일}아미노]페닐}술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;
- 35 2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{[5-(디메틸아미노)-1-나프틸]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 36 2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{(5-클로로-3-메틸-1-벤조티엔-2-일)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;
- 37 2-벤질-4-[3-((2-나프틸메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;
- 38 N-{{4-{{3-(4-클로로페닐)-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-피라졸-1-일}페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 39 N-{{4-[3-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 40 N-{{4-{4-브로모-3-(4-클로로페닐)-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-피라졸-1-일}페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 41 N-{{4-[4-브로모-3-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 42 N-{{4-[5-(4-브로모페닐)-3-(4-클로로페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 43 N-{{4-[3-(4-클로로페닐)-5-(4-펜틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 44 N-{{4-[4-브로모-3-(4-클로로페닐)-5-(4-펜틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 45 2-{4-{{(4-브로모-3-플루오로페닐)술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;
- 46 2-{4-{{(4-브로모-3-(트리플루오로메틸)페닐)술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;

- 47 2-벤질-4-[3-((비페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;
- 48 2-{4-({[4-브로모-2-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)-3-[({4-부틸페닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;
- 49 2-(3-[({4-부틸페닐}아미노)-4-{[(3,4-디클로로페닐]술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;
- 50 디알릴{2-옥소-2-[4-({[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]에틸}{4-(트리플루오로메틸)벤질]말로네이트;
- 51 N-({4-[(6-օ)소프로필-4-페닐퀴나졸린-2-일]아미노}페닐)술포닐)-N-메틸페닐알라닌;
- 52 N-({4-[(5-(4-클로로페닐)-2-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]술포닐}-N-에틸-L-페닐알라닌;
- 53 N-({4-[(5-(4-클로로페닐)-2-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]술포닐}페닐알라닌;
- 54 N-({4-[(2,5-비스(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]술포닐}페닐알라닌;
- 55 2-(3-[({4-부틸페닐}아미노)-4-{[(3,4-디브로모페닐]술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;
- 56 2-벤질-4-(4-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[(3,4-디클로로페닐]술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부탄산;
- 57 메틸 2-벤질-4-(3-{(비페닐-4-일메틸){[(3,4-디클로로페닐]술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 58 메틸 2-벤질-4-(3-{(3,4-디클로로벤질){[(3,4-디클로로페닐]술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 59 메틸 2-벤질-4-{3-[(4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{(2-나프틸술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 60 메틸 2-벤질-4-{3-{(비페닐-4-일메틸)(2-나프틸술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 61 2-벤질-4-{3-{(비페닐-4-일메틸)(2-나프틸술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부탄산;
- 62 2-(3-[({4-브로모페닐}아미노)-4-{[(4-부틸페닐]술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;
- 63 메틸 2-벤질-4-{3-{(2-나프틸메틸)(2-나프틸술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 64 2-벤질-4-{3-{(2-나프틸메틸)(2-나프틸술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부탄산;
- 65 4-{3-{(2-안트릴술포닐)(2-나프틸메틸}아미노}페닐)-2-벤질-4-옥소부탄산;
- 66 메틸 2-벤질-4-{3-{[4-(디메틸아미노)-3-플루오로페닐]술포닐}{(2-나프틸메틸}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 67 메틸 2-벤질-4-[3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페닐]-4-옥소부타노에이트;
- 68 메틸 2-벤질-4-{3-{[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}{(2-나프틸메틸}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;
- 69 2-벤질-4-[3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페닐]-4-옥소부탄산;

70 메틸 2-벤질-4-(3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디플루오로페닐]아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트; 또는

71 메틸 2-벤질-4-[3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-플루오로페닐]술포닐}아미노}페닐]-4-옥소부타노에이트.

또한, 본 발명의 기타 화합물이 하기에 기재되어 있고, 이는 캠브리지소프트 닷 캠(CambridgeSoft.com, Cambridge, MA)에서 시판되는 켐드로우(ChemDraw v. 6.02)를 사용하여 명명되어졌다.

예. 번호. 명

72 (2S)-2-[4-{[4-(메톡시카르보닐)벤질]{[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파논산;

73 2-벤질-4-옥소-4-[4-{[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노}페닐]부탄산;

74 2-[3-{(4-부틸페닐)아미노}-4-{[2-니트로-4-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파논산;

75 N-{[4-{(4-부틸페닐)아미노}-3-{[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페닐]-N-메틸-L-페닐알라닌;

76 벤질 (2S)-2-[4-{[(5-니트로-2-푸릴)메틸]{[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파노에이트;

77 (2R)-2-[4-{[(4-클로로-2-(트리플루오로메틸)퀴놀린-5-일]메틸}{[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파논산;

78 2-(4-{(4-부틸페닐)아미노}-3-{[4-(트리플루오로메톡시)벤조일]아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

79 2-(3-{(4-부틸페닐)아미노}-4-{[(4-클로로페닐)술포닐]아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

80 N-{(4-{(6-브로모-4-페닐퀴나졸린-2-일)(카르복시메틸)아미노}페닐)술포닐}-N-메틸페닐알라닌;

81 2-(3-{(4-부틸페닐)아미노}-4-{[(3-시아노-4-플루오로페닐)술포닐]아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

82 4-[4-{(4-클로로벤질){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노}페닐]-4-옥소-2-(파리딘-3-일메틸)부탄산;

83 2-벤질-4-[4-{((비)페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노}페닐]-4-옥소부탄산;

84 2-벤질-4-{4-{[4-메톡시-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}(1-나프틸메틸)아미노}페닐}-4-옥소부탄산;

85 2-벤질-4-(4-{[(3,4-디클로로페닐)술포닐][4-(트리플루오로메톡시)벤질]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

86 2-벤질-4-(4-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3-플루오로-4-메톡시페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

87 메틸 2-벤질-4-{3-[[3,4-디클로로페닐)술포닐](2-나프틸메틸)아미노}페닐}-4-옥소부타노에이트;

88 메틸 2-벤질-4-(3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;

89 2-벤질-4-(3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

90 2-벤질-4-(3-{(비페닐-4-일메틸)[(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

91 메틸 4-(3-{(4-벤조일벤질)[(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-2-벤질-4-옥소부타노에이트;

92 2-벤질-4-{3-[(3,4-디클로로페닐)술포닐](4-օ[소프로필벤질]아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

93 4-(4-디벤조[b,d]푸란-4-일페닐)-4-옥소-2-[3-(트리플루오로메틸)벤질]부탄산;

94 2-벤질-4-{3-[[4-메톡시]-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}(2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

95 메틸 2-벤질-4-{3-[(3,4-디플루오로페닐)술포닐](2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

96 N-{[4-(2-브로모-5-디벤조[b,d]푸란-4-일-1,3-티아졸-4-일)페닐]술포닐}페닐알라닌;

97 N-{[4-(5-브로모-2-디벤조[b,d]푸란-4-일-1,3-티아졸 4-일)페닐]술포닐}페닐알라닌;

98 2-[4-(5-브로모-2-디벤조푸란-4-일-티아졸-4-일)-벤젠술포닐아미노]-3-페닐-프로피온산;

99 2-[4-(2-디벤조푸란-4-일-티아졸-4-일)-벤젠술포닐아미노]-3-페닐-프로피온산;

100 (4-{2-[(8-클로로-디벤조푸란-4-카르보닐)-아미노]-5-에틸-티아졸-4-일}-페녹시)-페닐-아세트산;

101 [4-(2-벤조[b]티오펜-3-일-5-에틸-티아졸-4-일)-페녹시]-페닐-아세트산;

102 [4-(2-디벤조푸란-4-일-5-에틸-티아졸-4-일)-페녹시]-페닐-아세트산.

본 발명의 기타 화합물은 하기 표의 화합물 또는 이의 약학적으로 허용되는 염이다.

2-(4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤zen슬포닐아미노}-3-페닐-프로파온산;	R <sub>f</sub> 0.66 (디클로로메탄중 20% 메탄올) <sup>1</sup> H NMR (CD <sub>3</sub> OD, 300 MHz) δ 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.79 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.49 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.26 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.24-7.15 (m, 9 H, 4.13-4.05 (m, 1 H), 3.12-3.06 (m, 1 H), 2.90-2.82 (m, 1 H), 2.38 (s, 3 H); C <sub>32</sub> H <sub>26</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>3</sub> 에 대한 ESI-LCMS m/z 계산치 : 631; 측정치 630 (M - 1) <sup>+</sup> .
2-(4-[4-(3-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠슬포닐아미노}-3-페닐-프로파온산;	R <sub>f</sub> 0.63 (디클로로메탄중 20% 메탄올) <sup>1</sup> H NMR (CD <sub>3</sub> OD, 300 MHz) δ 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.77 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.58 (br s, 1 H), 7.40-7.37 (m, 1 H), 7.27-7.12 (m, 11 H), 4.11 (dd, J <sub>1</sub> = 9.0 Hz, J <sub>2</sub> = 5.4 Hz, 1 H), 3.09 (dd, J <sub>1</sub> = 13.8 Hz, J <sub>2</sub> = 5.4 Hz, 1 H), 2.85 (dd, J <sub>1</sub> = 13.8 Hz, J <sub>2</sub> = 9.9 Hz, 1 H), 2.39 (s, 3 H); C <sub>32</sub> H <sub>26</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>3</sub> 에 대한 ESI-LCMS m/z 계산치 : 631; 측정치 630 (M - 1) <sup>+</sup> .
2-(4-[4-(2-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠슬포닐아미노}-3-페닐-프로파온산;	R <sub>f</sub> 0.64 (디클로로메탄중 20% 메탄올) <sup>1</sup> H NMR (CD <sub>3</sub> OD, 300 MHz) δ 8.03 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.76 (d, J = 8.4 Hz, 2 H), 7.47-7.23 (m, 2 H), 7.18-7.04 (m, 11 H), 4.11 (dd, J <sub>1</sub> = 8.7 Hz, J <sub>2</sub> = 5.1 Hz, 1 H), 3.09 (dd, J <sub>1</sub> = 13.8 Hz, J <sub>2</sub> = 4.8 Hz, 1 H), 2.85 (dd, J <sub>1</sub> = 13.8 Hz, J <sub>2</sub> = 9.3 Hz, 1 H), 2.30 (s, 3 H); C <sub>32</sub> H <sub>26</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>3</sub> 에 대한 ESI-LCMS m/z 계산치 : 631; 측정치 630 (M - 1) <sup>+</sup> .

2-(4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨 릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤zen술포닐)- 메틸-아미노)-3-페닐-프로파온산;	$R_f$ 0.67 (디클로로메탄중 20% 메탄 올), $^1H$ NMR (CD <sub>3</sub> OD, 300 MHz) $\delta$ 8.02 (d, $J$ = 8.4 Hz, 2 H), 7.63 (d, $J$ = 8.7 Hz, 2 H), 7.49 (d, $J$ = 8.4 Hz, 2 H), 7.26 (d, $J$ = 8.4 Hz, 2 H), 7.23-7.19 (m, 9 H), 4.94 (dd, $J_1$ = 10.5 Hz, $J_2$ = 5.4 Hz, 1 H), 3.30-3.23 (m, 1 H), 2.95 (dd, $J_1$ = 14.4 Hz, $J_2$ = 10.5 Hz, 1 H), 2.93 (s, 3 H), 2.38 (s, 3 H); C <sub>33</sub> H <sub>28</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>3</sub> 에 대한 ESI-LCMS $m/z$ 계산치 : 645; 측정치 646 ( $M + 1$ ) <sup>+</sup> .
2-(4-[2-(2-시클로펜틸-아세틸아 미노)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤 술포닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로파온산;	$R_f$ 0.82 (디클로로메탄중 20% 메탄 올), $^1H$ NMR (CD <sub>3</sub> OD, 300 MHz) $\delta$ 7.5 (d, $J$ = 8.4 Hz, 2 H), 7.26-7.17 (m, 11 H), 3.32-3.25 (m, 1 H), 2.85 (dd, $J_1$ = 14.4 Hz, $J_2$ = 10.5 Hz, 1 H), 2.83 (s, 3 H), 2.71 (q, $J$ = 7.5 Hz, 2 H), 2.50 (d, $J$ = 7.5 Hz, 2 H), 2.37-2.76 (m, 1 H), 1.90- 1.83 (m, 3 H), 1.74-1.57 (m, 6 H), 1.30-1.26 (m, 3 H); C <sub>34</sub> H <sub>37</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 에 대한 ESI-LCMS $m/z$ 계산치 : 631; 측정치 632 ( $M + 1$ ) <sup>+</sup> .
2-(4-[2-(4-클로로-벤조일아미노) -5-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포 닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로파온산;	$R_f$ 0.60 (에틸 아세테이트중 20% 메탄올), $^1H$ NMR (DMSO-d <sub>6</sub> , 300 MHz) 8 8.02 (d, $J$ = 8.7 Hz, 2 H), 7.55 (dd, $J_1$ = 8.1 Hz, $J_2$ = 6.6 Hz, 4 H), 7.293-7.10 (m, 11 H), 3.66 (s, 1 H), 3.30-3.25 (m, 1 H), 2.93-2.84 (m, 1 H), 2.72 (q, $J$ = 7.5 Hz, 2 H), 1.28 (t, $J$ = 7.5 Hz, 3 H); C <sub>34</sub> H <sub>30</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 에 대한 ESI-LCMS $m/z$ 계 산치 : 659; 측정치 660 ( $M + 1$ ) <sup>+</sup> .
2-(4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨 릴-티아졸-2-일아미노]-벤젠술포닐)-메틸- 아미노)-3-페닐-프로파온산;	$R_f$ 0.67 (에틸 아세테이트중 20% 메탄올), $^1H$ NMR (CDC <sub>13</sub> , 300 MHz) $\delta$ 7.28 (d, $J$ = 9.3 Hz, 2 H), 7.51 (d, $J$ = 9.3 Hz, 2 H), 7.35 (d, $J$ = 8.7 Hz, 2 H), 7.31-7.15 (m, 11 H), 3.29-3.25 (m, 1 H), 2.95-2.85 (m, 2 H), 2.85 (s, 3 H), 2.36 (s, 3 H); C <sub>32</sub> H <sub>28</sub> C <sub>1</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 에 대한 ESI- LCMS $m/z$ 계산치 : 617; 측정치 618 ( $M +1$ ) <sup>+</sup> .

<p>2-{[4-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤zen술포닐}-에틸-아미노)-3-페닐-프로파온산;</p>	<p><math>R_f</math> 0.79 (에틸 아세테이트중 20% 메탄올), <math>^1H</math> NMR (<math>CDCl_3</math>, 300 MHz) δ 7.90-7.86 (m, 2 H), 7.63-7.53 (m, 6 H), 7.35-7.12 (m, 9 H), 4.79 (dd, <math>J_1 = 8.4</math> Hz, <math>J_2 = 6.6</math> Hz, 1 H), 3.41-3.28 (m, 3 H), 2.91 (dd, <math>J_1 = 14.4</math> Hz, <math>J_2 = 8.7</math> Hz, 2 H), 2.74-2.64 (m, 2 H), 1.29-1.21 (m, 6 H); <math>C_{34}H_{37}ClN_2O_4S_2</math>에 대한 ESI-LCMS <math>m/z</math> 계산치 : 630; 측정치 631 (<math>M + 1</math>)<sup>+</sup>.</p>
<p>2-{4-[5-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐아미노}-3-페닐-프로파온산; 또는</p>	<p><math>R_f</math> 0.89 (에틸 아세테이트중 20% 메탄올), <math>^1H</math> NMR (<math>CDCl_3</math>, 300 MHz) δ 7.93 (d, <math>J = 8.4</math> Hz, 2H), 7.64-7.56 (m, 4 H), 7.41-7.33 (m, 4 H), 7.27-7.14 (m, 7 H), 4.06 (dd, <math>J_1 = 8.3</math> Hz, <math>J_2 = 5.4</math> Hz, 1 H), 3.06 (dd, <math>J_1 = 13.5</math> Hz, <math>J_2 = 5.4</math> Hz, 1 H), 2.86 (dd, <math>J_1 = 13.5</math> Hz, <math>J_2 = 8.3</math> Hz, 1 H), 2.73 (q, <math>J = 7.4</math> Hz, 2 H), 1.29 (t, <math>J = 7.4</math> Hz, 3 H); <math>C_{32}H_{27}ClN_2O_4S_2</math>에 대한 ESI-LCMS <math>m/z</math> 계산치 : 602; 측정치 603 (<math>M + 1</math>)<sup>+</sup>.</p>
<p>2-{[4-[2-(4-클로로-페닐)-5-(6-메톡시-파리딘-3-일)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐}-에틸-아미노)-3-페닐-프로파온산;</p>	<p><math>R_f</math> 0.86 (디클로로메탄중 20% 메탄올)</p>

## 실시예 8

### PTP-1B 활성 측정 방법

테스트 화합물을 포스포티로실 도데카펩티드(phosphotyrosyl dodecapeptide) TRDI(P)YETD(P)Y(P)YRK [SEQ ID NO:1]을 지닌 재조합 인간 PTP1B에 대한 이들의 시험관내 억제 활성을 평가했다. 이는 1146, 1150 및 1151 티로신 잔기(기질의 공급원으로서의 IR-트리포스포펩티드)가 인산화된 1142-1153 인슐린 수용체 키나아제 조절 도메인에 해당한다. 효소 반응 과정을 포스포펩티드에 대한 말라카이트(malachite) 그린-암모늄 몰리브데이트 방법에 의해 검출되는 바와 같은 무기 포스페이트의 방출을 통해 모니터했다.

본 발명의 바람직한 화합물은 10  $\mu M$  미만의  $IC_{50}$  값을 나타내고, 본 발명의 더욱 바람직한 화합물은 1  $\mu M$  미만의  $IC_{50}$  값을 나타낸다. 특히 바람직한 화합물은 300 nM 미만의  $IC_{50}$  값을 나타낸다. 상기 화합물을 제조하고 사용하는 본 발명 및 방법 및 과정은 이에 속하는 당업자가 동일한 것을 제조하고 사용하는 것을 가능케 하는 충분하고, 명백하고, 간결하고, 정확한 용어로 이제 기재된다. 전술한 본 발명의 바람직한 구체예 및 이의 변형은 청구의 범위에 기재된 본 발명의 정신 또는 범위를 벗어남이 없이 제조되는 것으로 이해된다. 본 발명과 관련한 주제를 특별히 나타내고 명백히 청구하기 위해, 하기의 청구항은 본 내용을 결론내린다.

## 실시예 9

수컷 위스타(Wistar) 래트를 4주 이상 동안 고지방 식이를 먹였다. 클램프 실험 1주일 전에 경정맥 및 경동맥 도관술을 수행했다. 테스트 화합물(화합물 15)을 클램프 4시간 전에 복막 투여하고 표지된 3-3H-글루코오스를 추정된 내인성 글루코오스 생성(EGP) 1시간 전에 주입했다. 인슐린을 0.75U/kg/시간의 속도로 주입하여 혈장 인슐린을 200 mU/ml 이하로 상승시켰다. 유글리세미아(euglycemia)(80 mg/dl)를 유지시키기 위해, 표지되지 않은 글루코오스를 다양한 속도로 주입하여 10분마다 조정하였다.

화합물 15(30 mg/kg)의 처리는 글루코오스 주입 속도(GIR)를 현저하게 증가시켰다. 이러한 효과는 향상된 내인성 글루코오스 생성(EGP)의 억제 및 증가된 글루코오스 활용(GU)의 자극을 반영한다.

본 연구의 결과는 테스트 화합물이 인슐린 내성 래트에서 생체내 인슐린 활성을 개선시킴을 나타낸다. 이러한 개선은 간의 글루코오스 생성 뿐만 아니라 말초 글루코오스 활용 둘 모두에 영향을 준다. 상기 결과는 본 발명의 화합물이 당뇨병에 있어서 인슐린 내성의 치료를 위한 인슐린 강화제로서 유용함을 입증한다.

이슬린 내성 쥐의 이슬린 활성에 있어서의 화합물 15의 단일 경구 복용의 효과

용량	N	N GIR	EGP	GU
0 mg/kg	6	19.4±2.5	4.0±1.3	15.5±3.6
10 mg/kg	3	29.6±5.0	1.4±1.8	28.3±6.6
30 mg/kg	5	30.8±2.2**	0.16±0.5*	30.7±2.00**
60 mg/kg	4	38.0±2.2**	0.77±0.4	37.3±2.3**

\*P<0.05

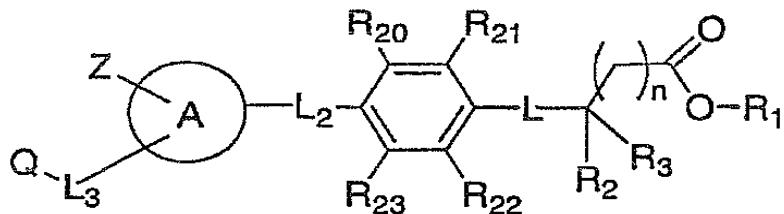
\*\*P<0.01 대 대조군; GIR, EGP 및 GU는 mg/kg/분의 ± sem을 의미한다.

상기 화합물을 제조하고 사용하는 본 발명 및 방법 및 과정은 이에 속하는 당업자가 동일한 것을 제조하고 사용하는 것을 가능케 하는 충분하고, 명백하고, 간결하고, 정확한 용어로 이제 기재된다. 전술한 본 발명의 바람직한 구체예 및 이의 변형은 청구의 범위에 기재된 본 발명의 정신 또는 범위를 벗어남이 없이 제조되는 것으로 이해된다. 본 발명과 관련한 주제를 특별히 나타내고 명백히 청구하기 위해, 하기의 청구항은 본 내용을 결론내린다.

(57) 청구의 범위

청구항 1.

하기 화학식의 화합물 또는 이의 약제학적 허용 염:



상기 식에서,

n은 0, 1, 2, 또는 3이고;

각 R<sub>1</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> 알케닐이며;

R<sub>2</sub>는 폐닐, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH<sub>2</sub>, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)NH(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-C(O)N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-S(O)<sub>b</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)히드록시알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-헵테로시클로알킬, -(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-헵테로아릴이고, 여기서 헵테로시클로알킬기는 폐닐 고리에 융합되거나 융합되지 않으며, 여기서, 헵테로시클로알킬 부분, 폐닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>알콕시, -SO<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알킬, 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고, b는 0, 1, 또는 2이고;

R<sub>3</sub>는 H 또는 -CO<sub>2</sub>R<sub>1</sub>이며,

R<sub>20</sub>, R<sub>21</sub>, R<sub>22</sub>, 및 R<sub>23</sub>은 독립적으로 H, 아릴알콕시, 아릴알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, NH-아릴, -N(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬C(O)아릴, -NHC(O)아릴, NH아릴알킬, NHC(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-

아릴,  $N(C_1-C_4)$  알킬)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-아릴,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-아릴,  $-NHSO_2-$ 아릴,  $-N(C_1-C_4)$  알킬)SO<sub>2</sub>아릴, 또는  $-N(C_1-C_4)$  알킬)아릴알킬로부터 선택되며, 여기서 아릴기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

L은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)-,  $-NH-$ ,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-이며, 여기서 알킬기는 폐널로 치환되거나 치환되지 않으며(여기서, 폐널은 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다);

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)NR<sub>9</sub>-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-C(O)N(R<sub>9</sub>)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-O-(C_1-C_6)$ 알킬-,  $-(C_1-C_6)$ 알킬-O-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬-N(R<sub>9</sub>)-이며, 여기서 R<sub>9</sub>는 H, 또는 C<sub>2</sub>H, -SO<sub>2</sub>아릴, 아릴알킬로 치환되거나 치환되지 않은 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬이고(여기서, 아릴기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, 할로겐, OH, NO<sub>2</sub>, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알킬, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다);

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-$ 알케닐-, C(O)이며;

A 고리는 폐널, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 푸라닐, 디히드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 피리딜, 퀴놀리닐, 나프틸, 퀴나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 트리아졸릴이며, 이들 고리 각각은 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시, NO<sub>2</sub>, CN, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬인 1, 2, 또는 3개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 아릴, -아릴-카르보닐-아릴, -아릴-알킬-아릴, -아릴-헤테로아릴, -아릴-헤테로시클로알킬, -헤테로아릴, -헤테로아릴-알킬-아릴, -헤테로시클로알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는 알콕시카르보닐이며, 여기서 고리기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>, 또는 폐널인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않고(여기서, R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 아릴(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 알카노일, 아릴알카노일, 알콕시카르보닐, 아릴알콕시카르보닐, 헤테로아릴카르보닐, 헤테로아릴, 헤테로시클로알킬카르보닐,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 또는  $-SO_2-$ 아릴이며, 여기서 고리기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, 할로알킬 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다);

Z는 부재하거나, H,  $-NHC(O)$ 아릴,  $-N(C_1-C_4)$  알킬)C(O)아릴, 또는 폐널이거나(여기서, 폐널기는 독립적으로 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시, 또는 NO<sub>2</sub>인 1, 2, 3, 4, 또는 5개의 기로 치환되거나 치환되지 않는다), Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)알킬-(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)시클로알킬이며;

단,  $L_2$ 가 결합인 경우 A 고리는 폐널이 아니다.

## 청구항 2.

제 1항에 있어서,

R<sub>1</sub>는 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 벤질, 또는 알릴이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐 ( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH_2$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬( $C_1-C_4$ )알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $S(O)_b-(C_1-C_4)$  알킬, ( $C_1-C_4$ ) 하이드록시알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-파리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-파페리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-파롤리디닐, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬-테트라하이드로푸라닐이고, 여기서 헤테로시클로알킬 기는 폐닐 고리에 용합되거나 용합되지 않고, 헤테로시클로알킬 부분, 폐닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-$  ( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며, b는 0, 1, 또는 2이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이마다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 피리미딜, 또는 티아졸릴이고, 이를 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1, 2, 또는 3개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, -폐닐-카르보닐-폐닐, -폐닐- $(C_1-C_4)$ 알킬- 폐닐, -폐닐-피리딜, -폐닐-피리미딜, -폐닐-옥사졸릴, -폐닐-티아졸릴, -폐닐-이마다졸릴, -폐닐-피롤릴, -폐닐-파페리디닐, -폐닐-파롤리디닐, -폐닐-피페라지닐, -폐닐-모르폴리닐, -폐닐-티오모르폴리닐, -폐닐-티오모르폴리닐 디옥사이드, -폐닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 벤조푸라닐, 벤조티에닐, 피롤릴, 이마다졸릴, -피리딜-,  $(C_1-C_4)$ 알킬-폐닐, -피리미딜- $(C_1-C_4)$ 알킬-폐닐, 모르풀리닐, 티오모르폴리닐, 디벤조푸라닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이마다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, 할로알킬, 할로알콕시,  $NR_6R_7$ , 또는 폐닐인 1, 2, 3, 4 또는 5개로 치환되거나 치환되지 않고;

여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 폐닐 ( $C_1-C_6$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 폐닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피리딜, 피리미딜, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $-C(O)NH_2$ ,  $-C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $-C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 또는  $-SO_2-$ 폐닐이고, 여기서 시클릭 기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $OH$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는  $-NHC(O)$ 폐닐,  $-NHC(O)$ 나프틸,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 폐닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 나프틸, 나프틸, 또는 폐닐이거나 (여기서 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$  인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않는다),

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬임을 특징으로 하는 화합물.

### 청구항 3.

제 2항에 있어서,

L은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)-$ ,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬-이고, 여기서 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $OH$ ,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않은 폐닐로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-N(R_9)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-O-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-O-$ , 또는  $-(C_1-C_4)알킬-N(R_9)-$ 이며,

$R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 나프틸( $C_1-C_4$ )알킬, 안트라세닐( $C_1-C_4$ )알킬이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_3$ 은 결합,  $-(C_1-C_4)알킬-O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)알킬$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)-$ 이며;

$R_{20}$ ,  $R_{21}$ ,  $R_{22}$ , 및  $R_{23}$ 는 독립적으로 H, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알콕시, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐,  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$  알킬-페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2-$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬 $-SO_2$ 페닐, NH벤질, 또는  $-N(C_1-C_6)$ 알킬벤질로부터 독립적으로 선택되며, 여기서 페닐 및 나프틸 기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

#### 청구항 4.

제 3항에 있어서,

$L$ 은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-NH-$ , 또는  $-N(C_1-C_4)$  알킬이고, 여기서 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-N(R_9)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-O-(C_1-C_4)알킬-$ ,  $-(C_1-C_4)알킬-O-$ , 또는  $-(C_1-C_4)알킬-N(R_9)-$ 이고,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)알킬-O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)알킬$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)-$ 이고;

$R_1$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬, 벤질 또는 알릴이며;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH_2$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬( $C_1-C_4$ )알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-S(O)<sub>b</sub>-( $C_1-C_4$ )알킬, ( $C_1-C_4$ ) 하이드록시알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피페리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피롤리디닐이고, 여기서 헤테로시클로알킬 기는 페닐 고리에 융합되거나 융합되지 않고, 헤테로시클로알킬 부분, 페닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며; b는 0, 1, 또는 2이고;

$R_3$ 는 H이며;

$R_{20}$ ,  $R_{21}$ ,  $R_{22}$ , 및  $R_{23}$ 은 독립적으로 H, 페닐( $C_1-C_4$ )알콕시, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, NH벤질, 또는  $-N(C_1-C_6)$ 알킬벤질로부터 선택되고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 피리미딜, 또는 트리아졸릴이고, 이를 각각은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1 또는 2개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

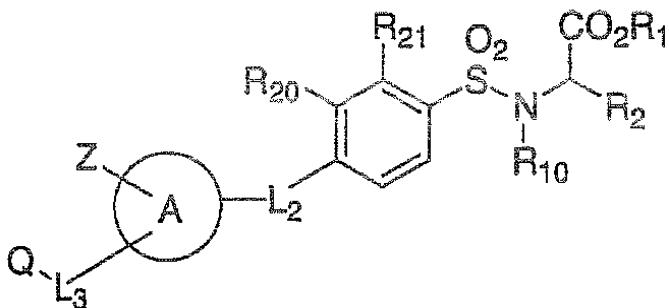
Q는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-카르보닐-페닐, -페닐-( $C_1-C_4$ )알킬-페닐, -페닐-피리딜, -페닐-피리미딜, -페닐-피롤릴, -페닐-피페리디닐, -페닐-피롤리디닐, -페닐-피페라지닐, -페닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜-( $C_1-C_4$ )알킬-페닐, 이미다졸리디닐, 디벤조푸라닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $NR_6R_7$ , 또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기서  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 또는  $-SO_2-$ 페닐이고, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Z는  $-NHC(O)$ 페닐,  $-NHC(O)$ 나프틸,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$ 나프틸, 나프틸, 또는 페닐이거나 (여기서, 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4개, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않는다),

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$  알킬-( $C_3-C_7$ ) 시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$  알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-( $C_3-C_7$ )시클로알킬임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 5.

제 4항에 있어서, 하기 화학식을 가짐을 특징으로 하는 화합물:



상기 식에서,

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬, 또는 벤질이고;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피페리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피롤리디닐이고, 여기서 헤테로시클로알킬 기는 페닐 고리에 융합되고 헤테로시클로알킬 부분, 페닐 부분, 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-$  ( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기서 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{20}$ , 및  $R_{21}$ 은 독립적으로 H, 벤질옥시, 벤질, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬( $C_1-C_6$ ) 알킬, NH-페닐,  $N(C_1-C_4)$  알킬-페닐, NH벤질, 또는  $-N(C_1-C_6)$  알킬벤질로부터 선택되고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않는다.

## 청구항 6.

제 5항에 있어서,

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $(C_1-C_4)$  알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$  알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬- $N(R_9)-$ 이고,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$  페닐, 벤질, 펜에틸, 나프틸- $CH_2-$ , 안트라세닐- $CH_2-$ 이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-C(O)-$ 이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬( $C_1-C_6$ ) 알킬인 1 또는 2개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-카르보닐-페닐, -페닐-, 피리딜, -페닐-피페리디닐, -페닐-피롤리디닐, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 디벤조푸라닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개로 치환되거나 치환되지 않고; 여기서  $R_6$  및  $R_7$ 이 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 또는  $-SO_2-$  페닐이고, 여기서 시클릭 기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬,  $N(C_1-C_6)$  알킬( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CR_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며,

Z는  $-NHC(O)$  페닐,  $-NHC(O)$  나프틸,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$  페닐,  $N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$  나프틸, 나프틸, 또는 페닐이거나(여기서 페닐 기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 이다),

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$  알킬- $(C_3-C_7)$  시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$  알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$  알킬- $(C_3-C_7)$  시클로알킬임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 7.

제 6항에 있어서,

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬, 또는 벤질이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬이며, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬이고, 여기서 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬, 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않은 폐닐기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 독립적으로 H, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬로부터 선택되고;

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬- 또는  $-((C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이며; 여기서  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 폐닐, 벤질, 펜에틸이고, 여기서 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-, 또는  $-C(O)-$ 이며;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이를 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1 또는 2개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 폐닐( $C_1-C_6$ )알킬, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개로 치환되거나 치환되지 않고;

여기서  $R_6$  및  $R_7$ 이 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 폐닐( $C_1-C_4$ )알카노일이고, 여기서 폐닐 기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며,

Z는  $-NHC(O)$ 폐닐,  $-N(C_1-C_4)$  알킬) $C(O)$ 폐닐, 또는 폐닐이거나(여기서 폐닐 기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않는다),

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-( $C_3-C_7$ )시클로알킬, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$  알킬-( $C_3-C_7$ )시클로알킬임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 8.

제 7항에 있어서,

$R_1$ 은 H, 또는  $C_1-C_4$  알킬이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬이며, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 또는  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬인 총 1, 2, 3, 또는 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{10}$ 은 H,  $C_1-C_4$  알킬이고, 여기서 알킬기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않은 폐닐로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$  중 하나 이상은 H이고, 다른 하나는 H, 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬, OH,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$  알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬이고,

$L_2$ 은 결합 또는  $-C(0)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬- $N(R_9)-$ 이며,  $R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 폐닐, 벤질, 펜에틸이고, 여기서 폐닐 기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-C(O)-$ 이고;

A 고리는 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 피롤릴, 피리미딜, 또는 옥사졸릴이고, 이들 각각은 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1 또는 2개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 이들 각각은 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

여기서  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 폐닐( $C_1-C_4$ )알카노일이고, 폐닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고,

Z는  $-NHC(O)$ 폐닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 폐닐, 또는 폐닐이거나(여기서 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시 또는  $NO_2$ 인 1, 2, 3, 4개, 또는 5개로 치환되거나 치환되지 않는다),

Z는  $-NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬, 또는  $-N-(C_1-C_4)$ 알킬 $C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬- $(C_3-C_7)$ 시클로알킬임을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 9.

제 8항에 있어서,

$L_2$ 는 결합이고;

$R_2$ 는 폐닐, 벤질, 펜에틸, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 또는  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬인 총 1, 2, 3, 4 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 페닐, 또는 피리딜이고, 이들 각각은 독립적으로  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ , 또는  $NR_6R_7$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_4$ )알카노일이고, 여기서 페닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬 ( $C_1-C_6$ ) 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Z는 페닐이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_2$  할로알킬,  $C_1-C_2$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 10.

제 1항에 있어서,

n은 0, 1, 2, 또는 3이고;

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬, 또는  $C_3-C_6$  알케닐이며;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH_2$ ,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)NH(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬- $C(O)N(C_1-C_4)$ 알킬( $C_1-C_4$ )알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-S(O)<sub>b</sub>- $(C_1-C_4)$  알킬, ( $C_1-C_4$ ) 하이드록시알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-피리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-페페리디닐,  $-(C_1-C_4)$  알킬-페롤리디닐, 또는  $-(C_1-C_4)$  알킬-테트라하이드로푸라닐이고, 여기서 헤테로시클로알킬 기는 페닐 고리에 융합되거나 융합되지 않고 헤테로시클로알킬 부분, 페닐 부분 또는 둘 모두는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고; b는 0, 1, 또는 2이며;

$R_3$ 는 H 또는  $-CO_2R_1$ 이고;

$R_{20}$ ,  $R_{21}$ ,  $R_{22}$ , 및  $R_{23}$ 는 독립적으로 H, 페닐알콕시, 페닐알킬, 할로겐, 알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)C(O)페닐,  $-NHC(O)$ 페닐, NH페닐알킬,  $NHC(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $N(C_1-C_4)$ 알킬)C(O)-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>) 알킬-페닐,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2-$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)SO<sub>2</sub>페닐, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)페닐알킬로부터 선택되고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

L은  $-SO_2NH-$ ,  $-SO_2N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-NHSO_2-$ ,  $-O-$ ,  $-C(O)NH-$ ,  $-C(O)N(C_1-C_4)$  알킬-,  $-SO_2-$ ,  $-C(O)-(C_1-C_4)$  알킬-,  $-(C_1-C_4)$  알킬-C(O)-,  $-NH-$ ,  $-N(C_1-C_4)$  알킬-이고, 여기서 알킬 기는 페닐로 치환되거나 치환되지 않고, 페닐은 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 11.

제 10항에 있어서,

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)NR_9-$ ,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)C(O)-$ ,  $-C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $C(O)N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)C(O)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-,  $-O-(C_1-C_6)$ 알킬-,  $-(C_1-C_6)$ 알킬-O-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이고,

$R_9$ 는 H, 또는  $CO_2H$ ,  $-SO_2$ 페닐, 페닐알킬, 나프틸알킬, 또는 안트라세닐알킬로 치환되거나 치환되지 않은  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기서 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 부재하거나, 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-O-,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$ 알킬-, -알케닐-, C(O)이고;

A 고리는 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 퀴놀리닐, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 나프틸, 퀴나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 푸라닐, 이소티아졸릴, 피롤릴, 옥사졸릴, 트리아졸릴이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1, 2 또는 3개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-카르보닐-페닐, -페닐- $(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, -페닐-피리딜, -페닐-피리미딜, -페닐-옥사졸릴, -페닐-티아졸릴, -페닐-이미다졸릴, -페닐-피롤릴, -페닐-피페리디닐, -페닐-피롤리디닐, -페닐-피페라지닐, -페닐-모르폴리닐, -페닐-티오모르폴리닐, -페닐-티오모르폴리닐 디옥사이드, -페닐-, 피리딜, 피리미딜, 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴, -피리딜- $(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, -피리미딜- $(C_1-C_4)$ 알킬-페닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $NR_5R_7$  또는 페닐인 1, 2, 3, 4개 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

여기서  $R_6$  및  $R_7$ 은 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_5$ ) 알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐 ( $C_1-C_6$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피리딜, 피리미딜, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐, - $C(O)NH_2$ , - $C(O)NH(C_1-C_6)$ 알킬, - $C(O)N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 또는  $-SO_2$ -페닐이고, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Z는 부재하거나, H,  $-NHC(O)$ 페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)C(O)페닐, 또는 페닐이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_5$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시, 또는  $NO_2$ 로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 12.

제 11항에 있어서,

$R_{20}$ ,  $R_{21}$ ,  $R_{22}$ , 및  $R_{23}$ 은 독립적으로 H, 페닐알콕시, 벤질, 펜에틸, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬, OH, 알콕시,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, NH-페닐, NH페닐알킬,  $N(C_1-C_4)$ 알킬-페닐,  $-NHSO_2$ -페닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)SO<sub>2</sub>페닐, 또는  $-N(C_1-C_4)$ 알킬)페닐( $C_1-C_5$ )알킬로부터 선택되고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

L은  $\text{-SO}_2\text{NH-}$ ,  $\text{-SO}_2\text{N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-NHSO}_2-$ ,  $\text{-O-}$ ,  $\text{-C(O)NH-}$ ,  $\text{-C(O)N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-SO}_2-$ ,  $\text{-C(O)-(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-C(O)-}$ ,  $\text{-NH-}$ ,  $\text{-N(C}_1\text{-C}_4\text{)}$  알킬-이고, 여기서 알킬기는 페닐기로 치환되거나 치환되지 않고, 페닐기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $\text{NO}_2$ , 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않거나;

$\text{L}_2$ 는 결합 또는  $\text{-C(O)NR}_9-$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)C(O)-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-C(O)NR}_9-$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-N(R}_9\text{)C(O)-}$ ,  $\text{-C(O)N(R}_9\text{)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)C(O)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)SO}_2-$ ,  $\text{-SO}_2\text{N(R}_9\text{)-}$ ,  $\text{-N(R}_9\text{)-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-O-(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬-}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬-O-}$ , 또는  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{) 알킬-N(R}_9\text{)-}$ 이고,

여기서,  $\text{R}_9$ 는 H,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{-SO}_2$ 페닐, 페닐알킬, 나프틸알킬, 또는 안트라세닐알킬이고, 여기서 아릴기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$ 알킬,  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬}$ , 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$\text{L}_3$ 는 부재하거나, 결합,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{) 알킬-O-}$ ,  $\text{-O-(C}_1\text{-C}_4\text{) 알킬}$ ,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-}$ ,  $\text{-알케닐-}$ , C(O)이고;

$\text{R}_1$ 는 H,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬, 또는  $\text{C}_3\text{-C}_6$  알케닐이며;

$\text{R}_2$ 는 페닐, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_4$ )알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{) 알킬-피리디닐}$ , ( $\text{C}_1\text{-C}_4\text{) 하이드록시알킬}$ 이고, 여기서 페닐 고리는 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{-SO}_2\text{-(C}_1\text{-C}_4\text{) 알킬}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬, 또는  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

A 고리는 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 피리미딜, 나프틸, 퀴나졸리닐, 벤조[b]티오펜, 이미다졸릴, 이소티아졸릴, 또는 피롤릴이고, 이들 각각은 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐, 할로알킬, 할로알콕시,  $\text{NO}_2$ ,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)}$ 알킬, 또는  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{) 알킬(C}_1\text{-C}_6\text{) 알킬}$ 이며;

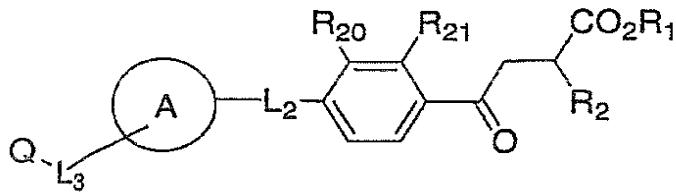
Q는 H, 페닐, 나프틸,  $\text{-페닐-카르보닐-페닐}$ ,  $\text{-페닐-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬- 페닐}$ ,  $\text{-페닐-피리딜}$ ,  $\text{-페닐-피리미딜}$ ,  $\text{-페닐-이미다졸릴}$ ,  $\text{-페닐-피롤릴}$ ,  $\text{-페닐-피페라지닐}$ ,  $\text{-페닐-모르폴리닐}$ ,  $\text{-페닐-티오모르폴리닐 디옥사이드}$ ,  $\text{-페닐- 피리딜}$ ,  $\text{피리미딜}$ , 푸라닐, 티에닐, 피롤릴, 이미다졸릴,  $\text{-피리딜-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-페닐}$ ,  $\text{-피리미딜-(C}_1\text{-C}_4\text{)알킬-페닐}$ , 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시,  $\text{NR}_6\text{R}_7$ , 또는 페닐기인 1, 2, 3, 4 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

여기서,  $\text{R}_6$  및  $\text{R}_7$ 은 독립적으로 H,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알킬,  $\text{C}_2\text{-C}_6$  알카노일, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알카노일,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시카르보닐, 페닐( $\text{C}_1\text{-C}_6$ )알콕시카르보닐, 피리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 피페리디닐카르보닐, 피롤리디닐카르보닐,  $\text{-C(O)NH}_2$ ,  $\text{-C(O)NH(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬}$ ,  $\text{C(O)N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬}$ , 또는  $\text{-SO}_2\text{-페닐}$ 이고, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  알콕시,  $\text{NO}_2$ , OH,  $\text{NH}_2$ ,  $\text{NH(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬}$ ,  $\text{N(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬(C}_1\text{-C}_6\text{)알킬}$ ,  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알킬 또는  $\text{C}_1\text{-C}_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Z는 부재하거나, H, 또는 페닐이고, 여기서 페닐기는 독립적으로  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_6$  알콕시, 할로겐,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알킬,  $\text{C}_1\text{-C}_4$  할로알콕시, 또는  $\text{NO}_2$ 인 1, 2, 3, 4 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

### 청구항 13.

제 12항에 있어서, 하기 화학식을 가짐을 특징으로 하는 화합물:



상기 식에서,

$R_1$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬, 벤질, 또는 알릴이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $C_1-C_6$  알킬,  $-CH_2-$ 파리딜, 또는 ( $C_1-C_4$ ) 하이드록시알킬이고, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 은 독립적으로 H,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ ,  $NH-$ 폐닐,  $NH-$ 폐닐알킬,  $N(C_1-C_4)Alk-$ 폐닐,  $-NHSO_2-$ 폐닐,  $-N(C_1-C_4)AlkSO_2-$ 폐닐, 또는  $-N(C_1-C_4)Alk-$ 폐닐( $C_1-C_6$ )알킬로부터 선택되고, 여기서 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않는다.

#### 청구항 14.

제 13항에 있어서,

A 고리는 폐닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디벤조푸라닐, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 파리미딜, 퀴나졸리닐, 또는 벤조[b]티오펜이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)Alk$ , 또는  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ 인 1, 2, 또는 3개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, -폐닐-파리딜, -폐닐-, 파리딜, 파리미딜, 푸라닐, 티에닐, 파롤릴, 이미다졸릴, -파리딜- $(C_1-C_4)$  알킬-폐닐, 모르폴리닐, 티오모르폴리닐, 티오모르폴리닐 디옥사이드, 이미다졸리디닐, 테트라하이드로푸라닐, 테트라하이드로티에닐, 피페리디닐, 피롤리디닐, 피페라지닐,  $C_1-C_6$  알킬, 할로겐, 할로알콕시, 할로알킬, 또는  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐이고, 여기서 상기 시클릭기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $C_1-C_4$  할로알킬,  $C_1-C_4$  할로알콕시,  $NR_6R_7$  또는 폐닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않고,

여기서,  $R_6$  및  $R_7$ 는 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 폐닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 폐닐( $C_1-C_6$ ) 알카노일,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐, 폐닐( $C_1-C_6$ )알콕시카르보닐, 파리딜카르보닐, 푸라닐카르보닐, 또는  $-SO_2-$ 폐닐이고, 여기서 시클릭기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)Alk$ ,  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ ,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

#### 청구항 15.

제 14항에 있어서,

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)$ 알킬-, 또는  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $N(R_9)-$ 이고,

$R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 페닐, 페닐알킬, 나프틸- $CH_2-$ , 또는 안트라세닐- $CH_2-$ 이고, 여기서 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬, 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)$ 알킬- $O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)$ 알킬,  $-(C_1-C_4)$  알킬-, C(0)이고;

$R_2$ 는 페닐, 페닐( $C_1-C_4$ )알킬,  $-CH_2-$ 파리딜, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기서 페닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$ 알킬,  $CF_3$ , 또는  $OCF_3$ 인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

Q는 H, 페닐, 나프틸, -페닐-파리딜, -페닐-, 파리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이고, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NR_6R_7$  또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5 개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_6$  및  $R_7$ 는 독립적으로 H,  $C_1-C_6$  알킬, 페닐( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_2-C_6$  알카노일, 페닐( $C_1-C_6$ )알카노일, 또는  $-SO_2-$ 페닐이고, 여기서 시클릭 기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $NO_2$ , OH,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬,  $C_1-C_2$  할로알킬 또는  $C_1-C_2$  할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 16.

제 15항에 있어서,

$L_3$ 는 결합이고;

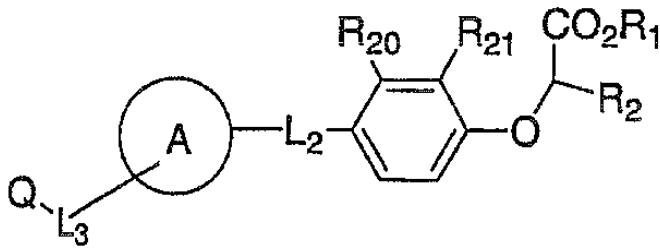
$R_2$ 는 페닐, 벤질, 펜에틸, 또는  $C_1-C_6$  알킬이며, 여기서 페닐기는 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-$ 알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 또는 독립적으로 알콕시카르보닐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NR_6R_7$  또는 페닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않은 페닐기이고;

A 고리는 페닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 디하이드로피라졸릴, 퀴나졸리닐, 및 벤조[b]티오펜이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)$ 알킬( $C_1-C_6$ )알킬인 1, 2, 또는 3개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 17.

제 11항에 있어서, 하기 화학식을 가짐을 특징으로 하는 화합물:



상기 식에서,

$R_1$ 은 H,  $C_1-C_6$  알킬, 벤질, 또는 알릴이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐( $C_1-C_4$ ) 알킬,  $C_1-C_6$  알킬, 또는 ( $C_1-C_4$ )하이드록시알킬이고, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$ -알킬,  $C_1-C_4$  할로알킬, 또는  $C_1-C_4$  할로알콕시인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않는다.

### 청구항 18.

제 17항에 있어서,

A 고리는 폐닐, 나프틸, 티아졸릴, 피라졸릴, 퀴놀리닐, 디하이드로피라졸릴, 벤조푸라닐, 피리미딜, 퀴나졸리닐, 푸라닐, 또는 벤조[b]티오펜이고, 이들 각각은 독립적으로, 할로겐,  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $C_1-C_6$  알콕시카르보닐,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $CN$ ,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬, 또는  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ 인 1, 2, 또는 3개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

$R_{20}$  및  $R_{21}$ 는 독립적으로 H,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ ,  $NH$ -폐닐,  $-N(C_1-C_4)$ 알킬) $C(O)$ 폐닐,  $-NHC(O)$ 폐닐,  $NH$ 폐닐알킬,  $N(C_1-C_4)Alk$ -폐닐,  $-NHSO_2-$ 폐닐,  $-N(C_1-C_4)Alk$  $SO_2$ 폐닐, 또는  $-N(C_1-C_4)Alk$ (폐닐( $C_1-C_6$ )알킬로부터 선택되고, 여기서 폐닐기는 독립적으로  $C_1-C_6$  알킬,  $C_1-C_6$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ , 할로알킬, 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

### 청구항 19.

제 18항에 있어서,

$L_2$ 는 결합 또는  $-C(O)NR_9-$ ,  $-N(R_9)C(O)-$ ,  $-N(R_9)SO_2-$ ,  $-SO_2N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-$ ,  $-N(R_9)-(C_1-C_4)Alk-$ , 또는  $-(C_1-C_4)Alk-N(R_9)-$ 이고,

$R_9$ 는 H,  $C_1-C_6$  알킬,  $-SO_2$ 폐닐, 폐닐알킬, 나프틸- $CH_2-$ 이고, 여기서 아릴기는 독립적으로  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시, 할로겐, OH,  $NO_2$ ,  $NH_2$ ,  $NH(C_1-C_6)$ 알킬,  $N(C_1-C_6)Alk(C_1-C_6)Alk$ , 할로알킬, 또는 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$L_3$ 는 결합,  $-(C_1-C_4)Alk-O-$ ,  $-O-(C_1-C_4)Alk$ ,  $-(C_1-C_4)Alk-$ ,  $C(O)$ 이고;

$R_2$ 는 폐닐, 폐닐( $C_1-C_4$ )알킬, 또는  $C_1-C_6$  알킬이고, 여기서 폐닐 부분은 독립적으로 할로겐,  $C_1-C_4$  알킬,  $C_1-C_4$  알콕시,  $-SO_2-(C_1-C_4)$  알킬,  $CF_3$  또는  $OCF_3$ 인 총 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않고;

Q는 H, 폐닐, 나프틸, -페닐-피리딜, -페닐-, 피리딜, 피페리디닐, 피롤리디닐, 또는 피페라지닐이며, 여기서 상기 시클릭 기는 독립적으로 알콕시카르보닐, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알콕시, 할로겐, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub> 또는 폐닐인 1, 2, 3, 4, 또는 5개 기로 치환되거나 치환되지 않고,

여기서 R<sub>6</sub> 및 R<sub>7</sub>은 독립적으로 H, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> 알킬, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> 알카노일, 폐닐(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알카노일, 또는 SO<sub>2</sub>-페닐이고, 여기서 시클릭 기는 독립적으로 할로겐, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> 알콕시, NO<sub>2</sub>, OH, NH<sub>2</sub>, NH(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬, N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)알킬(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>) 알킬, C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알킬 또는 C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> 할로알콕시인 1, 2, 3, 또는 4개 기로 치환되거나 치환되지 않음을 특징으로 하는 화합물.

## 청구항 20.

제 1항에 따른 화합물 및 하나 이상의 약제학적으로 허용되는 담체, 용매, 보조제, 또는 부형제를 포함하는 약제 조성물.

## 청구항 21.

약제학적 허용 양의 제 1항에 따른 화합물을 치료가 필요한 환자에게 투여하는 것을 포함하여 당뇨병을 치료하는 방법.

## 청구항 22.

제 1항에 있어서, 하기임을 특징으로 하는 화합물 또는 이의 약제학적 허용 염:

N-[{4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

N-({4-[3-(4-메톡시페닐)-5-(4-펜틸페닐)-4,5-디하이드로-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-[{4-({[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메톡시페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

N-메틸-N-[(4-{5-(4-펜틸페닐)-3-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-4,5-디하이드로-1H-피라졸-1-일}페닐)술포닐]페닐알라닌;

N-({4-[3-(4-메톡시페닐)-5-(4-펜틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-메틸-N-[(4-{5-(4-펜틸페닐)-3-[4-(트리플루오로메톡시)페닐]-1H-피라졸-1-일}페닐)술포닐]페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-부톡시페닐)-3-(4-메톡시페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

2-벤질-4-옥소-4-[3-({[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]부탄산;

N-[{4-({[4-(3-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-이소프로필페닐)-3-(4-메톡시페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-[{4-((4-(3-클로로-4-메틸페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일)아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

N-[{4-((4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일)아미노}카르보닐)페닐]술포닐}-N-메틸페닐알라닌;

메틸(2S)-2-[4-((비페닐-4-일메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파노에이트;

N-{{4-({{4-(4-브로모페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

N-{{4-({{4-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}카르보닐)페닐]술포닐}페닐알라닌;

(2S)-2-[4-((비페닐-4-일메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

N-[(4-{[4,6-비스(4-메톡시페닐)파리미딘-2-일]아미노}페닐)술포닐]-N-메틸-L-페닐알라닌;

N-메틸-N-({4-[5-(4-펜틸페닐)-3-(트리플루오로메틸)-1H-파라졸-1-일]페닐)술포닐}페닐알라닌;

2-벤질-4-[4-({[2-나트로-4-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;

2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-({[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-({[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

(2S)-2-[3-((비페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

2-{4-{[(4-브로모페닐)술포닐]아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;

N-({4-[2-[(4-클로로벤조일)아미노]-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐)술포닐]-N-메틸페닐알라닌;

(2S)-2-[4-((2-나프틸메틸){[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

N-[(4-{4-브로모-3-(4-메톡시페닐)-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-파라졸-1-일}페닐)술포닐]-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-브로모페닐)-3-(4-메톡시페닐)-1H-파라졸-1-일]페닐)술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

2-{4-[(4-브로모벤조일)아미노]-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-

3-페닐프로파논산;

N-({4-[(6-브로모-4-페닐퀴나졸린-2-일)아미노]페닐)술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[2-[(시클로펜틸아세틸)아미노]-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐)술포닐]-N-메틸-L-페닐알라닌;

N-({4-[2-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐)술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-에틸페닐)-2-(6-메톡시피리딘-3-일)-1,3-티아졸-4-일]페닐)술포닐)-N-메틸-L-페닐알라닌;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{[4-(클로로-3-나트로페닐)술포닐]아미노}페녹시}-3-페닐프로파논산;

N-[(4-{[4-(4-클로로페닐)-5-(4-메틸페닐)-1,3-티아졸-2-일]아미노}페닐)술포닐]-N-메틸-L-페닐알라닌;

2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{[5-(디메틸아미노)-1-나프틸]술포닐}아미노}페녹시]-3-페닐프로파논산;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{[5-(클로로-3-메틸-1-벤조티엔-2-일)술포닐]아미노}페녹시}-3-페닐프로파논산;

2-벤질-4-[3-((2-나프틸메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;

N-[(4-{3-(4-클로로페닐)-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-파라졸-1-일}페닐)술포닐]-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[3-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-[(4-{4-브로모-3-(4-클로로페닐)-5-[4-(트리플루오로메틸)페닐]-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐]-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[4-브로모-3-(4-클로로페닐)-5-(4-에틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-브로모페닐)-3-(4-클로로페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[3-(4-클로로페닐)-5-(4-펜틸페닐)-1H-피라졸-1-일]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

2-{4-{{(4-브로모-3-플루오로페닐)술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;

2-(4-{{[4-브로모-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;

2-벤질-4-[3-((비)페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;

2-{4-{{[4-브로모-2-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노}-3-[(4-부틸페닐)아미노]페녹시}-3-페닐프로파논산;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{(3,4-디클로로페닐)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

디알릴 {2-옥소-2-[4-{{[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]에틸}[4-(트리플루오로메틸)벤질]말로네이트;

N-({4-[(6-օ)소프로필-4-페닐퀴나졸린-2-일]아미노]페닐}술포닐)-N-메틸페닐알라닌;

N-({4-[5-(4-클로로페닐)-2-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)-N-에틸-L-페닐알라닌;

N-((4-[5-(4-클로로페닐)-2-(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)페닐알라닌;

N-({4-[2,5-비]스(4-에틸페닐)-1,3-티아졸-4-일]페닐}술포닐)페닐알라닌;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{(3,4-디브로모페닐)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

2-벤질-4-(4-{{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

메틸 2-벤질-4-(3-{{(비)페닐-4-일메틸}{(3,4-디클로로페닐)술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-(3-{{(3,4-디클로로벤질){(3,4-디클로로페닐)술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-{3-[[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질](2-나프틸술포닐)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-(3-[(비)페닐-4-일메틸](2-나프틸술포닐)아미노]페닐)-4-옥소부타노에이트;

2-벤질-4-{3-[(비)페닐-4-일메틸](2-나프틸술포닐)아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

2-(3-[(4-브로모페닐)아미노]-4-{{(4-부틸페닐)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

메틸 2-벤질-4-{3-[(2-나프틸메틸)(2-나프틸술포닐)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

2-벤질-4-{3-[(2-나프틸메틸)(2-나프틸술포닐)아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

4-(3-[(2-안트릴술포닐)(2-나프틸메틸)아미노]페닐)-2-벤질-4-옥소부탄산;

메틸 2-벤질-4-{3-[[4-(디메틸아미노)-3-플루오로페닐]술포닐](2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-[3-([4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-{3-[[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}(2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

2-벤질-4-[3-([4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;

메틸 2-벤질-4-(3-{{4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질}{(3,4-디플루오로페닐)술포닐}아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-[3-([4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질]{[4-(디메틸아미노)-3-플루오로페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부타노에이트;

(2S)-2-[4-({4-(메톡시카르보닐)벤질}{(4-(트리플루오로메톡시)페닐)술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

2-벤질-4-옥소-4-[4-({4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]부탄산;

2-[3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-({[2-니트로-4-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

N-{{4-[(4-부틸페닐)아미노]-3-({[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페닐]술포닐}-N-메틸-L-페닐알라닌;

벤질 (2S)-2-[4-({(5-니트로-2-푸릴)메틸}{[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파노에이트;

(2R)-2-[4-({[4-클로로-2-(트리플루오로메틸)퀴놀린-5-일]메틸}{[3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}아미노)페녹시]-3-페닐프로파논산;

2-(4-[(4-부틸페닐)아미노]-3-({4-(트리플루오로메톡시)벤조일}아미노)페녹시)-3-페닐프로파논산;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-{{(4-클로로페닐)술포닐}아미노}페녹시)-3-페닐프로파논산;

N-{{4-[(6-브로모-4-페닐퀴나졸린-2-일)(카르복시메틸)아미노]페닐}술포닐}-N-메틸페닐알라닌;

2-(3-[(4-부틸페닐)아미노]-4-((3-시아노-4-플루오로페닐)술포닐}아미노)페녹시)-3-페닐프로파논산;

4-[4-((4-클로로벤질){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소-2-(피리딘-3-일메틸)부탄산;

2-벤질-4-[4-((비페닐-4-일메틸){[4-(트리플루오로메톡시)페닐]술포닐}아미노)페닐]-4-옥소부탄산;

2-벤질-4-{4-[(4-메톡시)-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐}(1-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

2-벤질-4-(4-{{(3,4-디클로로페닐)술포닐}{[4-(트리플루오로메톡시)벤질]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

2-벤질-4-(4-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3-플루오로-4-메톡시페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

메틸 2-벤질-4-{3-[(3,4-디클로로페닐)술포닐](2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

메틸 2-벤질-4-(3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부타노에이트;

2-벤질-4-(3-{[4-클로로-3-(트리플루오로메틸)벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

2-벤질-4-(3-{{비}페닐-4-일메틸][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-4-옥소부탄산;

메틸 4-(3-((4-벤조일벤질][(3,4-디클로로페닐)술포닐]아미노}페닐)-2-벤질-4-옥소부타노에이트;

2-벤질-4-{3-[(3,4-디클로로페닐)술포닐](4-이소프로필벤질)아미노]페닐}-4-옥소부탄산;

4-(4-디벤조[b,d]푸란-4-일페닐)-4-옥소-2-[3-(트리플루오로메틸)벤질]부탄산;

2-벤질-4-{3-[[4-메톡시]-3-(트리플루오로메틸)페닐]술포닐)(2-나프틸메틸)아미노]페닐)-4-옥소부탄산;

메틸 2-벤질-4-{3-[(3,4-디플루오로페닐)술포닐](2-나프틸메틸)아미노]페닐}-4-옥소부타노에이트;

N-{{4-(2-브로모-5-디벤조[b,d]푸란-4-일-1,3-티아졸-4-일)페닐}술포닐}페닐알라닌;

N-{{4-(5-브로모-2-디벤조[b,d]푸란-4-일-1,3-티아졸-4-일)페닐}술포닐}페닐알라닌;

2-{4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠술포닐아미노}-3-페닐-프로피온산;

2-(4-[4-(3-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠술포닐아미노}-3-페닐-프로피온산;

2-(4-[4-(2-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]벤젠술포닐아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일카르바모일]-벤젠술포닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[2-(2-시클로펜틸-아세틸아미노)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[2-(4-클로로-벤조일아미노)-5-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[4-(4-클로로-페닐)-5-p-톨릴-티아졸-2-일아미노]-벤젠술포닐)-메틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[5-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐)-에틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-{4-[5-(4-클로로-페닐)-2-(4-에틸-페닐)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐아미노}-3-페닐-프로피온산;

2-((4-[2-(4-클로로-페닐)-5-(6-메톡시-피리딘-3-일)-티아졸-4-일]-벤젠술포닐)-에틸-아미노)-3-페닐-프로피온산;

2-[4-(5-브로모-2-디벤조푸란-4-일-티아졸-4-일)-벤젠술포닐아미노]-3-페닐-프로피온산;

2-[4-(2-디벤조푸란-4-일-티아졸-4-일)-벤젠술포닐아미노]-3-페닐-프로피온산;

(4-{2-[(8-클로로-디벤조푸란-4-카르보닐)-아미노]-5-에틸-티아졸-4-일}-페녹시)-페닐-아세트산;  
[4-(2-벤조[b]티오펜-3-일-5-에틸-티아졸-4-일)-페녹시]-페닐-아세트산;  
[4-(2-디벤조푸란-4-일-5-에틸-티아졸-4-일)-페녹시]-페닐-아세트산.

SEQUENCE LISTING

<110> Van Zandt, Michael

<120> Substituted Phenylalkanoic Acids For The Treatment Of Diabetes

<130> 03-334-B

<140> tba

<141> 2004-04-14

<150> 60/463,102

<151> 2003-04-14

<160> 1

<170> PatentIn version 3.0

<210> 1

<211> 12

<212> PRT

<213> Artificial sequence

<220>

<221> MISC\_FEATURE

<222> (5) .. (5)

<223> phosphotyrosine

<220>

<221> MISC\_FEATURE

<222> (9) .. (10)

<223> phosphotyrosine

<400> 1

Thr Arg Asp Ile Tyr Glu Thr Asp Tyr Tyr Arg Lys  
1                        5                        10