

(19) 대한민국특허청(KR)  
(12) 특허공보(B1)(51) Int. Cl.<sup>5</sup>  
C07D 237/14(45) 공고일자 1990년03월31일  
(11) 공고번호 특허1990-0002059

(21) 출원번호	특1985-0007521	(65) 공개번호	특1986-0003232
(22) 출원일자	1985년10월12일	(43) 공개일자	1986년05월21일
(30) 우선권주장	59-213968 1984년10월12일 일본(JP)		
(71) 출원인	상교가부시끼가이샤 가와무라 요시부미		
	일본국 도오쿄도 주오구 니혼바시 혼쑈 3쑈메 5방 1고		
(72) 발명자	모리사와 야스히로		
	일본국 도오쿄도 시나가와구 히로마찌 1쑈메 2방 58고 상교가부시끼가이샤		
	가가구 쟁규쇼 나이		
	까따오까 미쓰루		
	일본국 도오쿄도 시나가와구 히로마찌 1쑈메 2방 58고 상교가부시끼가이샤		
	가가구 쟁규쇼 나이		
	꾸마꾸라 세이지		
	일본국 도오쿄도 시나가와구 히로마찌 1쑈메 2방 58고 상교가부시끼가이샤		
	가가구 쟁규쇼 나이		
	교께 히로유키		
	일본국 도오쿄도 시나가와구 히로마찌 1쑈메 2방 58고 상교가부시끼가이샤		
	가가구 쟁규쇼 나이		
	고바야시 신사꾸		
	일본국 도오쿄도 시나가와구 히로마찌 1쑈메 2방 58고 상교가부시끼가이샤		
	가가구 쟁규쇼 나이		
(74) 대리인	이준구, 백락신		

심사관 : 박병석 (책자공보 제1817호)

## (54) 피리다지논 유도체의 제조방법

## 요약

내용 없음.

## 명세서

[발명의 명칭]

피리다지논 유도체의 제조방법

[발명의 상세한 설명]

본 발명은 일련의 신규한 6-(4-치환페닐)-3(2H)-피리다지논 유도체의 제조방법에 관한 것이다. 본 발명의 화합물은 페닐기의 4위치에 치환체를 갖는 특징을 가지는데, 이 치환체는 치환된 카르보닐알콕시 또는 카르보닐알킬티오기들의 제한된 군에서 선택된다.

본 발명의 화합물들은, 심근수축작용(특히 심장의 수축강화로 야기되는 자극작용), 혈압항진억제작용, 위선분비 억제기능 및 혈소판 응집억제기능을 포함한 광범위한 치료작용을 나타내지만, 본 발명의 화합물의 가치는 심근수축의 결과에 따라 부각된다.

다양한 6-(치환페닐)-3(2H)-피리다지논 이 공지되어 있으며, 이들중 몇몇은 유용한 심장활성을 갖는 것으로 알려졌다. 예를 들어서, 심장활성 및 혈압 항진억제작용을 갖는 일본 특허 출원 공개(즉, 출원공개 되었음) 제1884/72 및 제8015/83과 같은 화합물이 있다. 다른 유사한 화합물에 대해서 영국 특허 출원 제1,383,906호(미국특허 출원 제3,975,388호 및 제4,088,762호와 동일함)에 기재되어 있으며, 이 출원서에 따르면 이들은 혈압강하작용을 갖는 것으로 나타났다. 영국특허 출원 제1,488,330호에서는 이 화합물들을  $\beta$ -아드레날린성 블록킹제로 사용된다고 설명하고 있다. 이와 같은 화합물들의 다른 예가 문헌[J. Het. Chem., 제11권, 제755페이지(1974)]에 제시되었으나, 합성공정의 자세한 사항 및 이 화합물의 용도에 관하여는 설명하고 있지 않다.

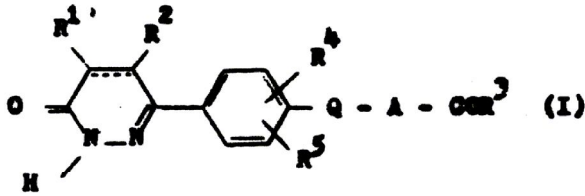
상술한 종래의 화합물들과 본 발명의 화합물들과의 차이점은, 본 발명의 화합물들은 모두 페닐기의 4위치에 카르보닐알콕시 또는 카르보닐알킬티오 치환체를 함유한다는 점이며, 놀랄만한 사실은 종래의 화합

물들 보다 대단히 우수한 심근 수축기능을 가진다는 점이다.

따라서 본 발명의 목적은 심근 수축기능을 가지고 있는 일련의 피리다지는 유도체를 제공하는 것이다.

본 발명의 또 다른 목적은 이와 같은 화합물들을 제조하는 방법을 제공하는 것이다.

본 발명의 화합물 및 조제학적으로 허용되는 산부가염들은 다음 일반식(I)로 표현할 수 있다.



위의 일반식(I)에서,  $R^1$  및  $R^2$ 는 수소원자 및  $C_1 \sim C_6$ 알킬기로된 군에서 각각 선택되며, Q는 산소원자 또는 황원자를 나타내고, A는  $C_1 \sim C_6$ 알킬렌기를 나타내며,  $R^3$ 은 히드록시기,  $C_1 \sim C_6$ 알콕시기, 아릴옥시기, 아릴콕시기{여기에서, 알킬부분은 1 내지 6개의 탄소원자를 가짐},  $-(NH)_n-NR^6R^7$  (여기에서 n는 0 또는 1이고,  $R^6$  및  $R^7$ 은 수소원자,  $C_1 \sim C_{10}$ 알킬기, 치환체군(a) 즉 할로겐원자, 히드록시기,  $C_1 \sim C_6$ 알콕시기, 아릴옥시기, 아미노기,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기, 아릴기 및 헤테로싸이클기로된 군에서 선택된 1 또는 2의 치환체를 갖는 아미노기, 카르복시기, 지방족 및 카르보싸이클릭 방향족아실기, 후술할 치환체군(b)에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_2 \sim C_8$ 지방족 카르복실 아실기, 지방족 및 카르보싸이클릭 방향족 카르복실아실아미노기,  $C_2 \sim C_7$ 알콕시카르보닐기, 아릴콕시카르보닐기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_6$ 알킬임),  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬기, 헤테로싸이클기, 아릴기,  $C_1 \sim C_6$ 알킬술폰닐기, 아릴술폰닐기, 술폰모일기, 카르바모일기, 1 또는 2의  $C_1 \sim C_6$ 알킬 치환체를 갖는 카르바모일기, 그리고 헤테로싸이클릭 치환체를 갖는 카르보닐기로된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된  $C_1 \sim C_{10}$ 알킬기,  $C_2 \sim C_6$ 알케닐기,  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬기, 아릴기 및 헤테로싸이클기로된 군에서 각각 선택되거나 또는  $R^6$  및  $R^7$ 은 이들의 부착된 질소원자와 함께 헤테로싸이클기를 형성함},  $-NH-NH-R^8$  (여기에서,  $R^8$ 은  $C_1 \sim C_8$ 지방족카르보닐아실기, 치환체들군(b), 즉 할로겐원자,  $C_1 \sim C_6$ 알콕시기,  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬기, 아릴기 및 헤테로싸이클로된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_2 \sim C_8$ 치환된 지방족 카르복실아실기,  $C_2 \sim C_7$ 알콕시카르보닐기, 신나모일기 또는 카르보싸이클릭 방향족 카르복실아실기임),

또는  $-NH=N-CH-R^9$  (여기에서,  $R^9$ 은  $C_1 \sim C_6$  알킬기, 10이상의 할로겐 치환기를 갖는  $C_1 \sim C_6$  알킬기 또는 아릴기)를 나타내고  $R^4$  및  $R^5$ 는 수소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기, 1 이상의 할로겐 치환체를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기, 할로겐원자,  $C_1 \sim C_6$ 알콕시기,  $C_1 \sim C_7$ 지방족카르복실아실옥시기, 아미노기, 모노- 및 디-알킬아미노기(여기에서, 각각의 알킬기는  $C_1 \sim C_6$ 알킬임),  $C_1 \sim C_7$ 지방족카르복실아실아미노기, 카르복시기,  $C_2 \sim C_7$ 알콕시카르보닐기, 카르바모일기, 1 또는 2의  $C_1 \sim C_6$ 알킬 치환체를 갖는 카르바모일기, 유레이도기, 알킬유레이도기(여기에서 알킬기는  $C_1 \sim C_6$ 알킬임), 티오유레이도기, 알킬티오유레이도기(여기에서, 알킬기는  $C_1 \sim C_6$ 알킬임), 시아노기 및 니트로기로된 군에서 각각 선택되며, 상기한 아릴기 및 아릴기를 함유하는 거의 아릴부분은  $C_6 \sim C_{14}$ 카르보싸이클아릴기로서, 이들은 치환되지 않았거나 치환체들의 군(a),  $C_1 \sim C_6$ 알킬기 및 치환체들의 군(a)에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기를 가지고, 상기한 헤테로싸이클기들은 5 내지 14개의 고리원자를 함유하며, 이들중에서 1 내지 5개의 질소, 산소 및 황원자로된 군에서 선택된 이종원자이며, 이 헤테로싸이클기들은 치환되지 않았거나 또는 상기 치환체들(a), 산소원자  $C_1 \sim C_6$ 알킬기 및 상기 치환체들(a)로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기로 된 군에서 선택된 치환체 1 이상을 가지며, 점선은 피리다지는 계의 4-와 5위치의 탄소원자들 사이에 존재하는 탄소-탄소 단일 또는 이중결합을 나타냄.

본 발명의 화합물을 제조하는 방법은 보다 더 상세히 후술하겠다.

본 발명의 또다른 목적은, 일반식(I)의 화합물 및 조제학적으로 허용되는 이들의 산부가염으로된 군에서 선택된 활성 화합물을 포유동물에 투여함으로써 포유동물의 심장질환을 치료하는 방법을 제공하는 것이다.

본 발명의 화합물에서,  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^5$ ,  $R^9$  또는 각종 치환체들이 위에서 정의한 바와 같이  $C_1 \sim C_6$ 알킬기인 경우에, 이 기들은 직쇄 또는 측쇄기일 수 있으며, 예를 들면 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 이소펜틸, 네오펜틸, t-펜틸, 헥실 및 이소헥실기가 있으며, 이들중에서  $C_1 \sim C_4$ 알킬기들, 특히 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸 및 sec-부틸기가 적합하며, 메틸 및 에틸기가 보다 더 적합하다.

$R^6$  또는  $R^7$ 이  $C_1 \sim C_{10}$ 알킬기인 경우에도 마찬가지로 직쇄 또는 측쇄기일 수 있으며, 예를 들면 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소부틸, sec-부틸, t-부틸, 펜틸, 이소펜틸, 네오펜틸, t-펜틸, 헥실,

이소핵실, 헵틸, 옥틸, 노닐 및 데실기들이 있다.  $R^6$  또는  $R^7$ 로 나타낸 알킬기가 치환되지 않은 경우에는 앞서 정의한 군에서 탄소원자 1 내지 8개를 갖는 기들을 선택하는 것이 적합하다.

한편,  $R^6$  또는  $R^7$ 로 나타낸 기가 치환된 경우에는, 탄소원자 1 내지 6개를 갖는 기들을 선택하는 것이 적합하며, 탄소원자 2 내지 4개를 갖는 것이 보다 더 적합하다.

$R^4$ ,  $R^5$  또는  $R^9$ 가 1 이상의 할로겐 치환체를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기를 나타내는 경우에, 이 할로겐 치환체를 불소, 염소, 브롬 및 요오드원자 중에서 선택하는 것이 적합하며, 불소 및 염소원자보다 더 적합하다. 알킬기 자체는 직쇄 또는 측쇄 알킬기이며, 이와 같은 기들의 예를 들면 특히  $R^4$  및  $R^5$ 로 나타낸 기들에 관하여 상기한 기들이 있으며, 알킬기로는  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 예를 들어서 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필 또는 부틸기가 보다 더 적합하다.

할로겐 치환체들이 수는 치환 가능한 탄소원자의 수에 의하여 제한을 받으며, 치환된 알킬기는 모노할로 알킬기부터 피할로알킬기까지는 망라한다. 일반적으로, 가장 일반적으로 사용가능한 할로알킬기들은 1, 2 또는 3개의 할로겐원자를 함유하며, 이와 같은 사실에 의거하여 모노-, 디- 및 트리-할로알킬기들이 적합하지만 완전히 할로겐화 할 때까지 할로겐원자를 함유할 수 있다는 것도 주지하여야 한다. 적합한 할로알킬기의 예를 들면 플루오로메틸, 클로로메틸, 트리플루오로메틸, 2-클로로에틸, 2, 2, 2-트라이클로로에틸 및 4-플루오로부틸기가 있으며, 트리플루오로메틸기가 보다 더 적합하다.

$R^6$  및(또는)  $R^7$ 이 알케닐기인 경우에, 이 기는 탄소원자 2 내지 6개(3 또는 4개가 보다 적합함)를 갖는 직쇄 또는 측쇄기이다. 이와 같은 기들의 예를 들면 비닐, 알릴, 1-프로페닐, 이소프로페닐, 메탈릴, 1-부테닐, 2-부테닐, 3-부테닐, 1-펜테닐, 2-펜테닐, 3-펜테닐, 4-펜테닐, 1-헥세닐, 2-헥세닐, 3-헥세닐, 4-헥세닐 및 5-헥세닐기와 함께 이 기들과 동족의 측쇄가 있다.

이들 중에서 알릴 및 메탈릴기들이 특히 적합하다.

$R^3$ , 치환체(a), 치환체(b),  $R^4$  또는  $R^5$ 가 알콕시기를 나타낼 경우에 이 기는 탄소원자 1 내지 6개를 가지며 직쇄 또는 측쇄 알콕시기일 수 있다.

예를 들면, 메톡시, 에톡시, 프로폭시, 이소프로폭시, 부톡시, 이소부톡시, sec-부톡시, t-부톡시, 펜틸옥시, 이소펜틸옥시, 네오펜틸옥시, t-펜틸옥시, 헥실옥시 및 이소헥실옥시기가 있으며, 이들 중에서  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기들 및 특히 메톡시 및 에톡시기가 보다 더 적절하다.

$R^3$  또는 치환체(a)가 아릴옥시기를 나타내거나 또는 치환체(a)의 치환된 아미노기 상의 치환체,  $R^6$ ,  $R^7$ , 치환체(b) 또는  $R^9$ 가 아릴기인 경우에, 이 아릴기는 6 내지 14개(6 내지 10개가 적합함)의 고리탄소원자를 갖는 카르보싸이클릭아릴기이다. 이 아릴기는 모노싸이클릭 또는 융합된 폴리싸이클릭기(바이싸이클릭기가 적합함)일 수 있으며, 페닐, 1-나프틸 또는 2-나프틸기보다 더 적합하다.

이 기들은 치환될 수도 있고 치환되지 않을 수도 있다. 이 기가 치환된 경우에, 최소의 치환체 수는 물론 1이고, 최대의 수는 치환 가능한 탄소원자의 수 및 치환체의 성질에 따라 다르며, 일반적으로 치환체들과 비교하여 상세히 후술한 바와 같이 입체장애가 따를 수도 있다. 가능한 치환체의 성질을 치환된 아릴 또는 아릴옥시기들에 관하여 앞에서는 보다 일반적으로 정의하였으나, 적합한 치환체들은  $C_1 \sim C_6$ ( $C_1 \sim C_4$ 가 적합함) 알킬기, 치환된  $C_1 \sim C_6$ ( $C_1 \sim C_4$ 가 적합함) 알킬기(할로겐 치환된 알킬기가 보다 더 적합함),  $C_1 \sim C_6$ ( $C_1 \sim C_4$ 가 적합함) 알콕시기, 히드록시기 및 할로겐원자가 있다. 알킬, 치환된 알킬 및 알콕시기의 예는 상기한 바와 같다.

할로겐원자의 예에는 불소, 염소, 브롬 및 요오드원자가 있다. 적합한 아릴 및 아릴옥시기에는 페닐 및 펜옥시기가 있으며, 이 경우에 가장 적합한 치환체들은 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸 및 메톡시기와 불소 및 염소원자가 있다.

$R^3$ 가 아랄킬옥시기인 경우에, 아릴부분은 앞단락에서 설명한 아릴기들 중의 어느 한 기일 수 있으며, 알킬부분은  $C_1 \sim C_6$ 알킬기(앞에서 예를 들었음)이며,  $C_1 \sim C_3$ 알킬기(예를 들면, 메틸, 에틸 또는 프로필기)가 보다 적합하며, 메틸 또는 에틸기가 가장 적합하다. 앞서 정의한 아릴기와 같이, 아랄킬옥시기의 아릴부분은 치환될 수도 있고 치환되지 않을 수도 있다. 적합한 아랄킬옥시기의 예를 들면, 벤질옥시, p-메틸벤질옥시, p-브로모벤질옥시, m-클로로벤질옥시, p-메톡시벤질옥시 및 펜에틸옥시기들이 있다.

치환체(a), 치환체(b),  $R^4$  또는  $R^5$ 가 할로겐 원자인 경우에 이에는 불소, 염소, 브롬 또는 요오드원자가 있다.

치환체(a)가 모노-또는 디치환아미노기인 경우에, 이 치환체 또는 치환체들은  $C_1 \sim C_6$ 알킬기, 아릴기(이 두기들은 앞서 정의한 바와 같음) 및 헤테로싸이클릭기(하기에서 일반적인 헤테로싸이클릭기와 비교하여 보다 자세히 정의함)로 된 군에서 선택된다.

치환체(a)가 지방족 또는 방향족 아실아미노기, 치환체(a) 또는  $R^8$ 이 지방족아실기 또는 치환된 지방족아실기, 치환체(a) 또는  $R^8$ 이 임의로 치환된 방향족 아실기,  $R^4$  또는  $R^6$ 가 지방족아실옥시기이거나  $R^4$  또는  $R^5$ 가 지방족 아실아미노기인 경우에, 이들의 아실부분은 하기와 같다. 특히 지방족아실기는 지방족 카르복실아실기로서, 이 기는 포화 또는 불포화 될 수 있으며 탄소원자 1 내지 8개를 갖는다(예외로, 치환체(a) 또는  $R^8$ 로 표시한 치환된 지방족 아실기는 탄소원자 2 내지 8를 가지며, 불포화 지방족아실기는 필수

적으로 최소한 3개의 탄소원자를 가짐). 포화된 기의 예에는 포르밀, 아세틸, 프로피오닐, 부티릴, 이소부티릴, 발레릴, 이소발레릴, 피발로일, 헥사노일, 이소헥사노일, 헵타노일 및 옥타노일이 있다.  $C_1 \sim C_5$  포화지방족 아실기가 적합(특히, 포르밀, 아세틸, 프로피오닐, 부틸릴, 발레릴 및 이소발레릴)하며, 아세틸기가 가장 적합하다.

불포화지방족아실기의 경우에, 이들은 필수적으로 최소한 3개의 탄소원자를 가지며, 본 발명에 사용된 것들은 3 내지 8개의 탄소원자(3 또는 4개의 탄소원자가 적합함)를 갖는다. 이와 같은 불포화지방족아실기들에는 아크릴로일, 메타크릴로일, 크로토노일, 이소크로토노일 및 프로피올로일기들이 있다. 치환된 지방족아실기 상에 있는 치환체들은 치환체(a) 및 본 명세서에서 예들든 것과 같이 일반적으로 정의된 것들 모두가 해당될 수 있다. 방향족 아실기의 경우에, 방향족부분은 아실기들에 관하여 위에서 정의한 것들이 적합하며, 예를 들면 벤조일, p-메톡시벤조일, 벤조옥시카르보닐 및 p-브로모벤질옥시카르보닐기들과 같은 아릴카르보닐기 및 아릴알킬옥시카르보닐기(여기에서, 상기 아릴카르보닐 및 아릴알킬옥시카르보닐기들의 아릴부분들은 치환되지 않았거나 할로겐원자, 술폰모일기,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기 및  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체들을 가짐)가 있다.

치환체(a),  $R^8$ ,  $R^4$  또는  $R^5$ 는 알콕시카르보닐기를 나타낼 경우에, 알콕시부분은,  $C_1 \sim C_6$ 알콕시기(그 예는 위에 주어진 것과 같음)이며, 직쇄 또는 측쇄기일 수 있으며, 따라서 알콕시카르보닐기는  $C_2 \sim C_7$ 기이다. 적합한 알콕시카르보닐기들은 메톡시카르보닐 및 에톡시카르보닐기이다.

치환체(a),  $R^6$ ,  $R^7$ , 치환체(b) 또는  $R^6$  및  $R^7$ 이 이들이 부착된 질소원자와 함께 헤테로싸이클기를 이룰 경우에 이 기는 5 내지 14개의 고리원자를 함유하는 기로서 이 고리원자들 중에서 1 내지 5개의 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된다. 이 헤테로싸이클기는 5 내지 8개의 고리원자를 갖는 것이 보다 더 적합하며, 이 고리원자들 중에서 1 내지 3개는 상기 이종원자들이다. 가장 적합한 경우는, 이 헤테로싸이클기가 5 내지 7개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 상기 이종원자임)를 갖는 경우이다. 이 헤테로싸이클기는 방향족기인 경우가 적합하나 방향족기가 아닐 수도 있으나, 방향족기가 아닌 경우에 이 고리원자들은 완전히 포화된 것일수도 있고, 몇 개의 불포화된 고리원자들을 함유할 수도 있다.

이와 같은 방향족이 아닌 헤테로싸이클기의 예에는 테트라히드로푸릴, 테트라히드로피라닐, 테트라히드로티오푸릴, 테트라히드로티오피라닐, 아지리디닐, 아제티디닐, 피롤리디닐, 피페리디닐, 헥사히드로아제피닐, 이미다졸리디닐, 옥사졸리디닐, 티아졸리디닐, 모르폴리닐(모르폴리노 포함), 티오모르폴리닐(티오모르폴리노 포함) 및 피페라지닐기들이 있으며, 이 모든 기들은 상기한 바와 같이 치환되거나, 또는 치환되지 않을 수도 있다. 보다 상세히 후술한 바와 같이 이와 같은 치환된 헤테로싸이클기들 상에 있는 치환체들의 수는 중요하지 않으며, 이와 같은 치환체들의 예는 상기한 바와 같다.

방향족 헤테로싸이클기가 아닌 경우에, 적합한 치환체들은 페닐기, 치환된 페닐기(여기에서 치환체들은 할로겐원자,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기 및 트리플루오로메틸기로 된 군에서 선택된 1 이상의 기 또는 원자임),  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 치환된 알킬기(여기에서, 치환체들은 히드록시기, 페닐기 및 할로겐원자,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기 및 트리플루오로메틸기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된 페닐기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체임),  $C_1 \sim C_6$ 알카노일기, 치환된  $C_2 \sim C_6$ 알카노일기(여기에서, 치환체들은 헤테로싸이클기,  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬기, 할로겐원자,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기 및 페닐기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체임),  $C_2 \sim C_5$ 알콕시카르보닐기, 아릴알킬옥시카르보닐기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬이고, 아릴부분은  $C_6 \sim C_{10}$ 알릴과 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체들로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴임),  $C_3$  및  $C_4$ 알카노일기, 벤조일기, 치환된 벤조일기(여기에서, 치환체는 할로겐원자, 술폰모일기,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기 및  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기로 된 군에서 선택된 1가지 이상의 치환체임), 헤테로싸이클릭아실기,  $C_1 \sim C_4$ 알알킬술폰닐기, 아릴술폰닐기(여기에서, 아릴부분은  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴 또는 할로겐원자,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기 및 트리플루오로메틸기로 된 군에서 선택된 1가지 이상의 치환체를 갖는  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴임), 알킬카르바모일기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬임), 헤테로싸이클기 및 산소원자이다.

헤테로싸이클기 상에 있는 치환체가 산소원자인 경우에, 이 산소원자가 공유결합에 의하여 고리탄소원자에 부착될 수 있는데, 이 경우에는 "옥소"기(=O)로 지칭되며, 이 산소원자가 배위결합에 의하여 예컨대 황원자(즉, S→O)에 부착될 수도 있으며, 물론 1 또는 2개의 산소원자 또는 원자들이 이와 같은 방법으로 고리의 황원자에 부착될 수도 있다.

방향족이 아닌 헤테로싸이클기상에 있는 치환체의 적합한 예에는, 메틸, 에틸, 페닐, 메톡시카르보닐, 에톡시카르보닐, 벤질, 산소, 히드록시에틸, 클로로페닐, 메톡시페닐, 트리플루오로메틸페닐, 피리디닐, 벤즈히드릴, 클로로벤즈히드릴, 디플루오로벤즈히드릴, 포르밀, 아세틸, 발레릴, 3-부테노일, 클로로부티릴, 에톡시, 아세틸, 벤질옥시카르보닐, 메탄술폰, 톨루엔술폰, 벤조일, 클로로벤조일, 메톡시벤조일, 니코티노일, 이소니코티노일, 테노일, 푸로일, 메틸카르바모일, p-클로로-m-술폰모일벤조일, 프로피오닐, 이소부티릴, 옥타노일, 페닐프로피오닐, 시클로로헥실프로피오닐, 헵타노일 및 디메톡시벤조일기들이 있다.

특히 치환된 방향족이 아닌 헤테로싸이클기로 적합한 것들에는 N-치환된 피페라지닐기 및 임의로 N-치환된 2, 5-디메틸피페라지닐 및 2, 6-디메틸-피페라지닐기가 있으며, 여기에서 N-치환체들은 상기한 치환체들 중에서 선택된다.

방향족 헤테로싸이클기의 경우에, 이들은 5 또는 6개의 고리원자(이중에서 1 또는 2개는 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된 이종원자임)를 갖는 것이 적합하다. 이와 같은 기들은 치환되지 않을 수도 있고, 1가지 또는 그 이상의 상기한 치환체를 가질 수도 있다. 방향족 헤테로싸이클기의 경우에 적합한

치환체들은  $C_1 \sim C_4$ 알킬기들이며, 메틸 또는 에틸기가 특히 적합하다. 이와 같이 치환 및 치환되지 않은 방향족 헤테로싸이클기에는 푸릴, 티에닐, 피롤릴, 1-메틸피롤린, 피리딜, 2-메틸피리딜, 3-에틸피리딜, 옥사졸릴, 티아졸릴 및 피리미디닐기들이 있으며, 이들중에서 푸릴, 티에닐 및 피리딜기들이 적합하다.

상기 "치환된"기들의 경우에, 본 발명에서 이 치환체들의 수는 중요하지 않지만, 대신에 치환가능한 자리의 수 및 입체장애는 중요하다. 예를 들어서, 치환체들이 비교적 작은 기들이거나 원자들인 경우에는, 치환 가능한 자리의 수에 의해서만 제한을 받을 수 있으며, 이들 모든 자리를 치환시킬 수 있다. 한편, 1가지 또는 그 이상의 치환체들이 비교적 "거대한"기인 경우에는, 입체장애를 고려하여야하며 따라서 이 치환체들의 수가 제한을 받을 수 있다. 이와 같은 사실은 당분야에서 숙련된 자들에게는 잘 알려져 있으므로 본 명세서 상에서는 더 이상 언급하지 않겠다.

A는  $C_1 \sim C_6$ 알킬렌기, 즉 이가의 포화된 지방족 탄화수소기가 그중에서 1원자가 Q가 나타난 원자에 부착되어 있으며, 다른 1원자가  $-COR^3$ 기에 부착되어 있다. 서로 다른 탄소원자들 또는 동일한 탄소원자들 상에서 자유원자가 존재할 수도 있으며, 이 경우에 이 기들은 때때로 "알킬리덴"기로 지칭된다. 이 알킬렌기는 직쇄 또는 측쇄일 수 있다. 이 알킬렌기들의 예를 들면, 메틸렌, 에틸리덴, 에틸렌, 프로필렌, 트리메틸렌, 프로필리덴, 테트라메틸렌, 1-메틸트리메틸렌, 2-메틸트리메틸렌, 3-메틸트리메틸렌, 펜타메틸렌 및 헥사메틸렌 기들이 있으며, 이들 중에서 메틸렌, 에틸렌, 트리메틸렌 및 테트라메틸렌기들이 적합하다.

$R^1$  및  $R^2$ 는 수소원자 또는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기이다.  $R^1$  및  $R^2$ 중의 어느 한 기가 수소이고 나머지 한 기가  $C_1 \sim C_6$ 알킬기(특히 메틸기)인 화합물들이 특히 적합하다.

본 발명의 화합물로 적합한 부류는 다음과 같다.

(1) 일반식(I)의 화합물 및 이들의 염에서, Q는 산소원자이고, A가  $C_1 \sim C_4$ 알킬렌기이며,  $R^3$ 은  $C_1 \sim C_4$ 알킬시기, 2, 5-디알킬피롤릴기(여기에서 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬임) 또는  $-(NH)_nNR^6R^7$ 기, 여기에서, n는 0 또는 1이고,  $R^6$  및  $R^7$ 은 수소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기,  $C_3 \sim C_6$ 알케닐기,  $C_5$  및  $C_6$ 시클로알킬기, 페닐기, 1 이상의 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 치환체를 갖는 페닐기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된 이종원자임)를 갖는 헤테로싸이클기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된 이종원자임)를 가지며 상기한 치환체(a), 산소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기 및 1 이상의 상기 치환체(a)를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된 헤테로싸이클기, 그리고 치환체들(a') 즉, 할로겐원자, 히드록시기,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기, 디알킬아미노기(여기에서, 알킬기는  $C_1 \sim C_4$ 알킬기임),  $C_2$  또는  $C_3$ 알콕시카르보닐기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된 이종원자임)를 갖는 헤테로싸이클기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자로 된 군에서 선택된 이종원자임)를 가지며 상기한 치환체(a), 산소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기 및 상기한 치환체(a), 페닐기 및 1 이상의 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 치환체를 갖는 페닐기를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된  $C_1 \sim C_4$ 알킬기로 된 군에서 각각 선택된 기이며,  $R^4$  및  $R^5$ 는 수소원자,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 할로겐원자 및 니트로기로 된 군에서 각각 선택되는 화합물.

(2) 일반식(I)의 화합물 및 이들의 염에서,  $R^1$  및  $R^2$ 는 수소원자 및 메틸기 중에서 각각 선택되며, Q는 산소원자이고, A가  $C_1 \sim C_4$ 알킬렌기이며,  $R^3$ 이  $-(NH)_nNR^6R^7$ 의 기로서, 여기에서, n는 0이고,  $R^6$  및  $R^7$ 은 수소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기,  $C_5$  및  $C_6$ 시클로알킬기, 2, 5-디메틸피롤릴기,  $C_3$  및  $C_4$ 알케닐기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자 중에서 선택된 이종원자임)를 갖는 헤테로싸이클기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자 중에서 선택된 이종원자임)를 가지며 상기 치환체(a), 산소원자,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기 및 1 이상의 상기 치환체(a)를 갖는  $C_1 \sim C_6$ 알킬기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된 헤테로싸이클기, 그리고 치환체들(a') 즉,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기,  $C_2$  및  $C_3$ 알콕시카르보닐기, 모르폴리노기, 티오모르폴리노기, 피페라지닐, 호모피페라지닐기, 페닐기, 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐기, 피리딜기 및 치환체들(c) 즉, 페닐기, 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체들로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐기,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 히드록시 치환체, 페닐 치환체 및 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐 치환체들로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 포르밀기,  $C_2 \sim C_8$ 알카노일기,  $C_2 \sim C_5$ 알콕시카르보닐기, 아릴알콕시카르보닐기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬이고, 아릴부분은  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴 또는 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴임),  $C_3$  및  $C_4$  알케노일기, 벤조일기, 할로겐, 술파모일,  $C_1 \sim C_4$ 알킬 및  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 치환기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 벤조일기, 헤테로싸이클릭 아실기,  $C_1 \sim C_4$ 알킬술폰닐기, 아릴술폰닐기(여기에서 아릴부분은  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴 또는 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_6 \sim C_{10}$ 아릴임) 알킬카르바모일기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬임) 및 치환된  $C_2 \sim C_6$  알카노일기{여기에서, 치환체

는 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시,  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬, 페닐 및 헤테로싸이클 치환체로 된 군에서 선택됨)로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 4위치에 갖는 1-피페라지닐기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된  $C_1 \sim C_4$ 알킬기로 된 군에서 각각 선택되며,  $R^4$ 는 수소원자이고, 그리고  $R^5$ 는 3위치에 있는 수소원자 또는 할로겐, 니트로 또는 메틸기인 화합물.

(3) 일반식(1)의 화합물 및 이들의 염에서, Q는 산소원자이고, A는 메틸렌기이며,  $R^1$ 은 수소원자이고,  $R^2$ 는 수소원자 또는 메틸기이며,  $R^3$ 은  $-NHR^7$ 기이고,  $R^7$ 은  $C_3$  또는  $C_4$ 알케닐기,  $C_1 \sim C_6$ 알킬기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개는 질소 이종원자임)를 갖는 헤테로싸이클기(여기에서, 이 헤테로싸이클기는 치환되지 않았거나  $C_1 \sim C_4$ 알킬기 및 페닐알킬기(여기에서, 페닐 부분은 치환되지 않았거나 그 자체가 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체로된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 가지며, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬임)로된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 가짐}, 또는 치환체들( $a''$ ) 즉,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시기, 모르폴리노기, 티오모르폴리노기, 1-피페라지닐기, 페닐기, 할로겐, 알킬 및 알콕시 치환체 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐기, 피리딜기 및 치환체들( $c'$ ) 즉, 페닐기, 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체들 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐기,  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 히드록시 치환체, 페닐 치환체 및 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체들 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_1 \sim C_4$ 알킬기, 포르말기,  $C_2 \sim C_5$ 알카노일기,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시, 할로겐, 페닐,  $C_3 \sim C_7$ 시클로알킬 및 헤테로싸이클 치환체 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_2 \sim C_5$ 알카노일기,  $C_2 \sim C_5$ 알콕시카르보닐기, 아릴킬옥시카르보닐기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_3$ 알킬이고, 아릴부분은 페닐 또는 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 페닐임),  $C_3$  및  $C_4$ 알케노일기, 벤조일기, 할로겐, 술파모일,  $C_1 \sim C_4$ 알킬 및  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 치환체 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 벤조일기, 5 또는 6개의 고리원자(이들중에서 1 또는 2개의 질소, 산소 및 황원자 중에서 선택된 이종원자임)를 가지는 헤테로싸이클기(여기에서, 이 헤테로싸이클기는 치환되지 않았거나 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬 및  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 치환체들 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 가짐),  $C_1 \sim C_4$ 알킬술폰닐기,  $C_6 \sim C_{10}$ 카르보싸이클 아릴술폰닐기, 할로겐,  $C_1 \sim C_4$ 알킬,  $C_1 \sim C_4$ 알콕시 및 트리플루오로메틸 치환체들 중에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는  $C_6 \sim C_{10}$ 카르보싸이클아릴술폰닐기, 그리고 알킬카르바모일기(여기에서, 알킬부분은  $C_1 \sim C_4$ 알킬임)로 된 군에서 선택된 치환체를 4위치에 갖는 1-피페라지닐기로 된 군에서 선택된 1 이상의 치환체를 갖는 치환된  $C_1 \sim C_4$ 알킬기이며,  $R^4$ 는 수소원자이고,  $R^5$ 는 3위치에 있는 할로겐원자 또는 메틸기를 나타내는 화합물.

본 발명의 화합물들은 염기성 질소원자를 함유하고 있으므로 산부가염의 형성할 수 있다. 이 염들의 성질은 본 발명에서는 중요하지 않으나, 단 이 염들의 치료의 목적으로 사용될 경우에, 이들은 조제학적으로 허용 가능해야 한다. 즉, 당분야에서 숙련된 자들에게는 잘 알려진 바와 같이, 유리염기와 비교하여 독성이 크지 않거나, 허용불가능한 만큼 독성이 크거나, 활성이 감소되거나 허용불가능한 만큼 활성이 감소되지 않아야만 한다. 이와 같은 염들을 형성하는 데에 각종 산들을 사용할 수 있으며, 예를 들면, 염화수소산, 브롬화수소산, 요오드화수소산, 인산, 메타포스포산, 질산 또는 황산과 같은 무기산; 그리고 초산, 옥살산, 타르타르산, 구연산, 벤조산, 글루콜산, 글루콘산, 글루쿠론산, 숙신산, 말레산 또는 푸마르산과 같은 유기산에 있다. 이와 같은 산부가염들은 통상의 방법으로 제조할 수 있다.

하기 표에 본 발명의 화합물의 예들을 기재 하였으며, 본 표에서는 편의를 위하여 각 화합물들에 번호를 지정하여 구별하였다. 다음의 표에서 숫자 다음에 "a"로 표시하여 구별한 화합물들은 피리다진고리의 4- 및 5 위치 사이에 탄소-탄소 단일 결합이 있으며, 한편 숫자 다음에 "b"로 표시하여 구별한 화합물들을 피리다진고리의 4- 및 5위치 사이에 이중결합을 갖는 화합물들이다.

하기 표에서는 다음의 약자를 사용한다.

Ac	아세틸
Boz	벤조일
Bu	부틸
iBu	이소부틸
sBu	sec-부틸
Bz	벤질
iBy <sub>1</sub>	이소부틸릴
Bzhy	벤즈히드릴
c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	시클로프로필
c-C <sub>4</sub> H <sub>7</sub>	시클로부틸
c-C <sub>5</sub> H <sub>9</sub>	시클로펜틸
c-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	시클로헥실

c-C <sub>7</sub> H <sub>13</sub>	시클로헥틸
Diz	퍼히드로-1, 4-디아제핀-1-일 (=호모피페지닐)
Et	에틸
Fo	포르밀
Fur	2-푸릴
Imid	1-이미다졸릴
Me	메틸
Mes	메탄술포닐
Mor	모르폴리노
Octo	옥타노일
Ph	페닐
Pip	피페리딜
Piz	1-피페라지닐
Pr	프로필
iPr	이소프로필
Pyr	피리딜
Pyrd	1-피롤리디닐
Pyrr	1-피롤릴
Thi	2-티에닐
Thid	1, 3-티아졸린-3-일
Thiz	1, 3-티아졸릴
Thz	퍼히드로-1, 4-티아진-4 -일(티오모르폴리노)
Tos	p-톨루엔술포닐
Va	발레릴

위의 약자들 중의 하나로 구별한 기를 이를 이루는 수개의 원자들 중의 하나를 통하여 분자의 나머지 부분에 부착시킬 경우에, 부착되는 위치는 이 기의 약자앞에 적절한 숫자를 넣어 나타낸다. 예를 들면, 피리딜기의 경우에는 3-Pry, 2-Pry 등으로 표시될 수 있다. 상기 약자들 중의 한가지로 표시한 기가 치환될 경우에 치환체 또는 치환체들에 대한 적절한 표시는 치환된 기의 앞에 위치시키며, 치환체가 부착된 치환된 기의 위치 번호를 앞에 위치시킨다.

예를 들면, 4위치에 에틸 치환체를 갖는 3-피리딜기는 4-Et-3-Py로 표시한다.

화합물번호	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup>
1a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOH	3-Cl	H
2a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> COOH	3-Cl	H
3a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	H	H
4a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> COOEt	H	H
5a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	2-Cl	H
6a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-Cl	H
7a/b	Me	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-Cl	H
8a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-Cl	H
9a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-Me	H
10a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-OMe	H
11a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	3-NO <sub>2</sub>	H
12a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> COOEt	2-Cl	3-Cl
13a/b	H	H	OCH(Me)COOEt	3-Cl	H
14a/b	H	H	OCH(Et)COOEt	3-Cl	H
15a/b	H	H	O(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COOEt	3-Cl	H
16a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	3-Cl	H
17a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONH <sub>2</sub>	3-Cl	H
18a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHNH <sub>2</sub>	3-Cl	H
19a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHNH <sub>2</sub>	3-Cl	H
20a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHMe	H	H
21a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHMe	3-Cl	H
22a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHMe	3-Cl	H
23a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHMe	2-Cl	3-Cl
24a/b	H	H	OCH(Me)CONHMe	3-Cl	H
25a/b	H	Me	OCH(Me)CONHMe	3-Cl	H
26a/b	H	H	OCH(Et)CONHMe	3-Cl	H
27a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHEt	H	H
28a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHEt	3-Cl	H
29a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHEt	3-Cl	H
30a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONEt <sub>2</sub>	3-Cl	H
31a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONEt <sub>2</sub>	3-Cl	H
32a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHPr	H	H
33a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHPr	3-Cl	H
34a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHPr	3-Cl	H
35a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHPr	3-F	H
36a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHPr	H	H
37a/b	H	H	OCH(Me)CONHPr	3-Cl	H
38a/b	H	H	OCH(Et)CONHPr	3-Cl	H
39a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONPr <sub>2</sub>	3-Cl	H
40a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHPr	3-Cl	H
41a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHPr	3-Cl	H
42a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHPr	H	H
43a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHBu	3-Cl	H
44a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHBu	3-Cl	H
45a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHBu <sub>2</sub>	3-Cl	H
46a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHBu	3-Cl	H
47a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHBu	3-Cl	H
48a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONiBu <sub>2</sub>	3-Cl	H
49a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHtBu	3-Cl	H
50a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CON(Me)Bu	3-Cl	H
51a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	3-Cl	H
52a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	3-Cl	H
53a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	3-Cl	H
54a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>6</sub> H <sub>13</sub>	3-Cl	H
55a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	3-Cl	H
56a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>8</sub> H <sub>17</sub>	3-Cl	H
57a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHC <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	3-Cl	H
58a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	3-Cl	H
59a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	3-Cl	H
60a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> Cl	3-Cl	H
61a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	H	H
62a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	3-Cl	H
63a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt	3-Cl	H
64a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt	3-Cl	H
65a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OEt	3-Me	H
66a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	3-Cl	H
67a/b	H	Me	OCH <sub>2</sub> CONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OMe	H	H
68a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	3-Cl	H
69a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	2-Cl	3-Cl
70a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONH(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> OH	3-Cl	H
71a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OPh	3-Cl	H
72a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> O(4-OMePh)	3-Cl	H
73a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NHMe	3-Cl	H
74a/b	H	H	OCH <sub>2</sub> CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Cl	H
75a/b	H	H	OCH(Me)CONHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NEt <sub>2</sub>	3-Cl	H