



(19) 대한민국특허청(KR)
(12) 공개특허공보(A)

(11) 공개번호 10-2015-0029766
(43) 공개일자 2015년03월18일

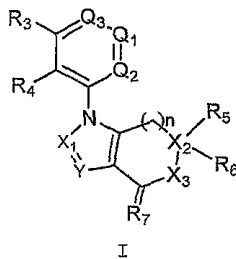
- (51) 국제특허분류(Int. Cl.)
C07D 209/24 (2006.01) C07D 405/12 (2006.01)
A61K 31/404 (2006.01) A61K 9/20 (2006.01)
A61K 9/08 (2006.01)
- (21) 출원번호 10-2015-7005119(분할)
(22) 출원일자(국제) 2006년02월27일
심사청구일자 없음
(62) 원출원 특허 10-2013-7020400
원출원일자(국제) 2006년02월27일
심사청구일자 2013년08월30일
(85) 번역문제출일자 2015년02월26일
(86) 국제출원번호 PCT/US2006/006988
(87) 국제공개번호 WO 2006/091963
국제공개일자 2006년08월31일
(30) 우선권주장
60/656,230 2005년02월25일 미국(US)
(뒷면에 계속)
- (71) 출원인
에사넥스, 인코포레이티드
미국 인디애나 인디애나폴리스 스위트 1680-에스
웨스트 워싱턴 스트리트 115 (우: 46204)
- (72) 발명자
후앙, 케네쓰 히
미국 27516 노쓰캐롤라이나 찰펠 힐 글렌모어 로
드 214
에아베스, 제론
미국 27517 노쓰캐롤라이나 찰펠 힐 유니트 씨 콜
플레이스 70
(뒷면에 계속)
- (74) 대리인
특허법인 남앤드남

전체 청구항 수 : 총 121 항

(54) 발명의 명칭 테트라히드로인돌론 및 테트라히드로인다졸론 유도체

(57) 요약

화학식 (I)의 화합물, 및 이의 약제학적으로 허용되는 염이 기술되어 있다:



(상기 식에서, R₁, R₂, R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, n, Q₁, Q₂, Q₃, Y 및 X₁ 내지 X₄는 본원에서 정의된 바와 같다)

본 발명의 화학식 (I)의 화합물은 세포 증식과 관련된 질환 및/또는 상태, 예컨대 암, 염증, 관절염, 혈관형성 등의 치료에 유용하다. 또한, 본 발명의 화합물을 포함하는 약제 조성물, 및 그러한 화합물을 사용하여 상기 언급된 상태를 치료하는 방법이 기술되어 있다.

(72) 발명자

빌, 제임스

미국 27502 노스캐롤라이나 아펙스 위버 크로썬 로드 8916

바타, 토마스

미국 27510 노스캐롤라이나 카르보로 페쓰웨이 드라이브 1532

갱, 리깅

미국 27519 노스캐롤라이나 캐리 텔리코 플레이스 201

힌클리, 린드세이

미국 19352 펜실베이니아 링쿨른 유니버시티 하이랜드 뷰 드라이브 201

한슨, 군나르

미국 75235 텍사스 달라스 포레스트 파크 로드 5720 아파트먼트 #5412

(30) 우선권주장

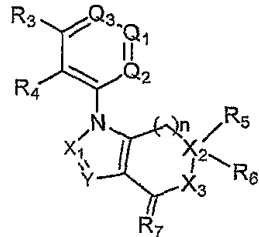
60/705,715 2005년08월04일 미국(US)

60/727,965 2005년10월18일 미국(US)

특허청구의 범위

청구항 1

하기 화학식의 화합물, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염:



상기 식에서,

R₃ 및 R₄는 독립적으로

(a) H,

(b) 할로, 또는

(c) C₁-C₁₅ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 6개 이하의 탄소 원자는 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에틸닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지는 않고, 여기서

R₂₂는

(i) 헤테로아릴,

(ii) 아릴,

(iii) 포화되거나 불포화된 C₃-C₁₀ 시클로알킬, 또는

(iv) 포화되거나 불포화된 C₂-C₁₀ 헤테로시클로알킬이며, 여기서

각각의 아릴, 헤테로아릴, 포화되거나 불포화된 시클로알킬, 또는 포화되거나 불포화된 헤테로시클로알킬은 독립적으로, 독립적으로 히드록시, 할로, 아미노, 시아노, 카르복시, 카르복사미도, 니트로, 옥소, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO-아릴, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, (C₁-C₆)알콕시, 또는 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노인 하나 이상의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

각각의 R₂₂는 C₆-C₁₀ 아릴 기, C₅-C₈ 포화 시클릭 기, 또는 C₅-C₁₀ 헤테로시클로알킬 기로 융합되거나 융합되지 않고;

여기서 각각의 (c)는 임의의 이용가능한 위치에서 C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기서

Z는 OR₀ 또는 -N(R₃₀)₂이고, 여기서

각각의 R₃₀은 독립적으로 -H 또는 C₁-C₆ 알킬이고, 또는 N(R₃₀)₂는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 아제파닐, 1,3- 또는 1, 4-디아제파닐, 또는 모르폴리닐이고, 이들의 각각은 히드록시, 아미노, 아미노알킬, C₁-C₆ 알킬, 모노- 또는 디(C₁-C₆)알킬아미노, C₁-C₆ 알콕시, 또는 할로겐으로 치환되거나 치환되지 않으며;

R_0 은 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_2-C_{10}$ 알케닐, $-C_2-C_{10}$ 알키닐, 아릴, 헤테로아릴, 또는 $-C_1-C_6$ 아실이고;

R_{23} 은

- (1) 헤테로아릴,
- (2) 아릴,
- (3) 포화되거나 불포화된 C_5-C_{10} 시클로알킬, 또는
- (4) 포화되거나 불포화된 C_5-C_{10} 헤테로시클로알킬이며,

R_{23} 기는 독립적으로 히드록시, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO$ -아릴, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, (C_1-C_6) 알콕시, 또는 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노인 하나 이상의 기로 치환되거나 치환되지 않거나;

R_3 및 R_4 는 이들이 결합되는 원자와 함께, Q_1 및 Q_2 를 함유하는 고리에 융합된 5 내지 12원의 모노-, 비- 또는 트리시클릭 고리 시스템을 형성하며, 여기서 이 5 내지 12원의 고리는 부분적으로 포화되거나 방향족이며, 산소, $S(O)_m$ (여기서, m 은 0, 1, 또는 2이다), 질소, 또는 NR_{33} (여기서, R_{33} 은 수소 또는 C_1-C_6 알킬이다) 중 하나 또는 두개를 함유하거나 함유하지 않으며;

R_7 은 O, S, NH, N-OH, N-NH₂, N-NHR₂₂, N-NH- (C_1-C_6) 알킬, N-O- (C_0-C_6) 알킬- R_{22} , N- (C_1-C_6) 알케녹시), 또는 N-(카르복시로 치환되거나 치환되지 않은 C_1-C_6 알콕시)이고;

Y 는 N 또는 CR_c 이고, 여기서

각각의 R_c 는 독립적으로 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_c$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서

각각의 알킬, 아릴, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 시아노, 니트로, 할로(C_1-C_6)알킬, 할로(C_1-C_6)알콕시, 카르복사미드, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기서

아릴 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 할로(C_1-C_6)알킬, 또는 카르복사미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

R_c 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_c$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서

R_c 는 -H, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이거나;

각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ 할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이며, 여기서

각각의 알킬, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 니트로, 할로(C_1-C_6)알킬, 할로(C_1-C_6)알콕시, 또는 카르복사미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

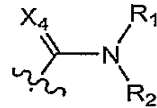
X_1 은 N 또는 CR_c 이고;

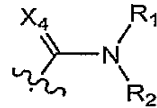
Q_1 , Q_2 및 Q_3 은 독립적으로 N 또는 CR_Q 이고, 여기서 Q_1 , Q_2 및 Q_3 중 하나 및 단 하나는 $C-R_{21}$ 이고, 여기서

각각의 R_Q 는 독립적으로 수소, 할로젠, $-N(R_{CN})_2$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 아릴, 또는 헤테

로아릴, 또는 R_{21} 이며, 여기서

각각의 알킬, 시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 할로 (C_1-C_6) 알킬, 할로 (C_1-C_6) 알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;



R_{21} 은 시아노, $-C(O)OH$, $-C(O)-O(C_1-C_6 \text{ 알킬})$, 또는 화학식 의 기이며, 여기서

R_1 및 R_2 는 독립적으로 H, 히드록시, C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알케닐, C_2-C_6 알키닐, 헤테로아릴, 아릴, C_3-C_8 시클로알킬, 헤테로시클로알킬이고, 여기서

각각의 알킬, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 니트로, 할로 (C_1-C_6) 알킬, 할로 (C_1-C_6) 알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 치환기로 치환되거나 치환되지 않거나;

R_1 및 R_2 는 이들 모두가 결합되는 질소와 함께, 독립적으로 O, N, S, 또는 $N(R_{CN})$ 인 하나 이상의 추가 헤테로원자를 함유하거나 함유하지 않는 헤테로시클로알킬을 형성하며;

X_4 는 O, S, NH, NOH, $N-NH_2$, $N-NH$ 아릴, $N-NH-(C_1-C_6 \text{ 알킬})$, 또는 $N-(C_1-C_6 \text{ 알콕시})$ 이며;

X_2 및 X_3 는 독립적으로 C, O, N, 또는 $S(O)_p$ 이며, 여기서

p는 0, 1, 또는 2이고;

n은 0, 1, 2, 3, 또는 4이며;

단 (i) X_2 가 C인 경우에,

R_5 및 R_6 는 독립적으로 H, C_1-C_6 알킬, 또는 아릴이고, 여기서 아릴은 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노, 니트로, 할로 (C_1-C_6) 알킬, 할로 (C_1-C_6) 알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 치환기로 치환되거나 치환되지 않으며,

여기서 임의의 2개의 인접한 치환된 아릴 위치는, 이들이 결합되는 탄소 원자들과 함께 불포화 시클로알킬 또는 헤테로시클로알킬을 형성하거나;

R_5 및 R_6 는 이들이 결합되는 탄소와 함께 3 내지 8원의 고리를 형성하고;

(ii) X_2 가 N인 경우에, R_6 은 부재하고, R_5 는 H 또는 C_1-C_6 알킬이며;

(iii) X_3 이 C인 경우에, 이것은 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬, 또는 모노- 또는 디- (C_1-C_6) 알킬아미노 (C_1-C_6) 알킬인 2개의 기로 치환되고;

(iv) X_2 가 O 또는 $S(O)_p$ 인 경우에, R_6 및 R_5 는 존재하지 않는다.

청구항 2

제 1항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이고;

R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이며, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2

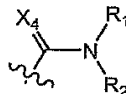
개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C_1-C_{10})알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물 또는 염.

청구항 3

제 1항 또는 제 2항에 있어서,

Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서



R_{21} 이 화학식

R_7 이 0이며;

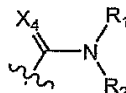
Y 가 CR_c 이고, 여기서

R_c 가 -H, -CH₃, 에틸, 시클로프로필, 또는 -CF₃인 화합물 또는 염.

청구항 4

제 1항에 있어서,

Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서



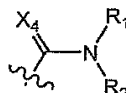
R_{21} 이 화학식

X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 5

제 1항에 있어서,

Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서



R_{21} 이 화학식

Q_1 및 Q_2 가 독립적으로, H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 6

제 1항 내지 제 5항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

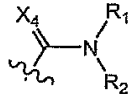
청구항 7

제 1항 내지 제 6항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 CR_c 인 화합물.

청구항 8

제 1항에 있어서,

Q₃이 CR₂₁이고, 여기서



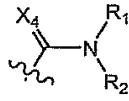
R₂₁이 화학식

X₁이 H 또는 C₁-C₆ 알킬로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 9

제 1항에 있어서,

Q₃이 CR₂₁이고, 여기서



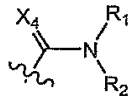
R₂₁이 화학식

X₂가 독립적으로 H 또는 C₁-C₄ 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 10

제 1항에 있어서,

Q₃이 CR₂₁이고, 여기서



R₂₁이 화학식

R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이며, 여기서

Z₁이 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서

p가 0, 1 또는 2이고;

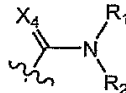
R₂₁이 C₁-C₁₄ 알킬 기이며, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R₂₁이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

청구항 11

제 1항에 있어서,

Q₃이 CR₂₁이고, 여기서



R_{21} 이 화학식

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{21}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이고, 여기서

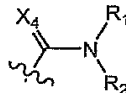
R_{21} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이며, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

청구항 12

제 1항에 있어서,

Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서



R_{21} 이 화학식

R_4 가 H, C_1-C_4 알킬 또는 할로젠인 화합물 또는 염.

청구항 13

제 8항 내지 제 12항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

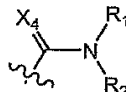
청구항 14

제 8항 내지 제 12항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 CR_c 인 화합물.

청구항 15

제 1항에 있어서,

Q_3 이 CR_{21} 이며, 여기서



R_{21} 이 화학식

X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

X_1 이 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C이고;

Q_1 및 Q_2 가 독립적으로, H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C이고;

R_7 이 0이고;

Y 가 CR_c 이고, 여기서

R_c 가 $-H$, $-CH_3$, 또는 $-CF_3$ 이고;

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서

p 가 0, 1 또는 2이며;

R_{Z1} 이 $-C_1-C_{14}$ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{Z2} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{Z3} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;

n 이 1 또는 2인 화합물 또는 염.

청구항 16

제 15항에 있어서,

R_1 및 R_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;

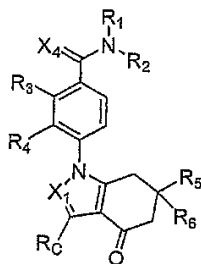
Q_1 및 Q_2 가 모두 CH이고;

X_2 가 2개의 독립적으로 선택된 C_1-C_4 알킬 기로 치환된 C이고;

n 이 1인 화합물 또는 염.

청구항 17

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물 또는 염:



청구항 18

제 17항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서

p 가 0, 1 또는 2이며;

R_{Z1} 이 $-C_1-C_{14}$ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

청구항 19

제 17항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이고; R_{Z1} 이 $-C_1-C_{14}$ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

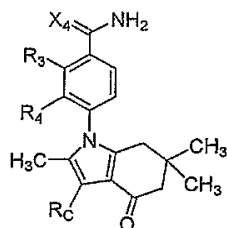
청구항 20

제 17항에 있어서,

R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물 또는 염.

청구항 21

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물 또는 염:



청구항 22

제 21항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서

p가 0, 1 또는 2이며;

R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐,

에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R₂₁이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

청구항 23

제 21항에 있어서,

R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이며, 여기서

Z₁이 -O- 또는 -NH-이고; R₂₁이 -C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R₂₁이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물 또는 염.

청구항 24

제 21항에 있어서, R₃, R₄, 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물 또는 염.

청구항 25

제 17항 내지 제 24항 중 어느 한 항에 있어서, X₄가 O인 화합물 또는 염.

청구항 26

제 17항 내지 제 24항 중 어느 한 항에 있어서, X₄가 N-OH인 화합물 또는 염.

청구항 27

제 1항 또는 제 2항에 있어서,

R₂₁이 시아노이고;

R₇이 O이고;

Y가 CR_c이며, 여기서 R_c가 H 또는 CH₃인 화합물 또는 염.

청구항 28

제 1항에 있어서,

R₂₁이 시아노이고, X₃이 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 29

제 1항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

Q_1 및 Q_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 30

제 1항, 제 17항, 제 51항 또는 제 55항 중 어느 한 항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고, X_1 이 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 31

제 1항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물 또는 염.

청구항 32

제 1항, 제 17항, 제 51항 또는 제 55항 중 어느 한 항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{21}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{21} 이 $-C_1-C_{14}$ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물 또는 염.

청구항 33

제 1항, 제 17항, 제 51항 또는 제 55항 중 어느 한 항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{21}$ 이고, 여기서

R_{21} 이 $-C_1-C_{14}$ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물 또는 염.

청구항 34

제 1항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

R_4 가 H, C_1 - C_4 알킬 또는 할로겐인 화합물 또는 염.

청구항 35

제 1항에 있어서,

R_{21} 이 시아노이고;

X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1 - C_4 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

X_1 이 H 또는 C_1 - C_6 알킬로 치환된 C이고;

Q_1 및 Q_2 가 독립적으로 H 또는 C_1 - C_6 알킬로 치환된 C이고;

X_3 이 독립적으로 H 또는 C_1 - C_6 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

R_7 이 0이며;

Y가 CR_c 이고, 여기서 R_c 가 H 또는 CH_3 이며;

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며;

R_{Z1} 이 C_1 - C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1 - C_{10} 알킬, C_1 - C_{10} 할로알킬, C_2 - C_{10} 알케닐, C_2 - C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1 - C_6 알콕시, C_2 - C_{10} 알케닐옥시, C_2 - C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;

n 이 1 또는 2인 화합물 또는 염.

청구항 36

제 35항에 있어서,

R_1 및 R_2 가 독립적으로 H 또는 C_1 - C_4 알킬이고;

Q_1 및 Q_2 가 모두 CH이며;

X_2 가 2개의 독립적으로 선택된 C_1 - C_4 알킬 기로 치환된 C이고;

n 이 1인 화합물 또는 염.

청구항 37

제 1항에 있어서,

R_{21} 이 시아노인 화합물.

청구항 38

제 37항에 있어서, R_3 및 R_4 가 독립적으로 할로젠 또는 수소인 화합물.

청구항 39

제 38항에 있어서, R_3 이 할로젠인 화합물.

청구항 40

제 38항에 있어서, R_3 이 수소이고 R_4 가 할로젠인 화합물.

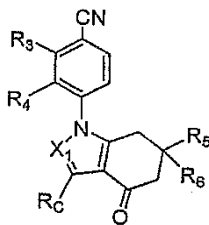
청구항 41

제 38항에 있어서, R_4 가 할로젠인 화합물.

청구항 42

제 1항에 있어서,

하기 화학식의 화합물:



상기 식에서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 할로젠 또는 수소이나,

단 R_3 및 R_4 중 하나 이상은 할로젠이다.

청구항 43

제 42항에 있어서, R_3 이 할로젠인 화합물.

청구항 44

제 42항에 있어서, R_4 가 할로젠인 화합물.

청구항 45

제 42항에 있어서, R_3 이 플루오로인 화합물.

청구항 46

제 42항에 있어서, R_4 가 플루오로인 화합물.

청구항 47

제 42항에 있어서, R_4 가 수소인 화합물.

청구항 48

제 42항에 있어서, R_3 이 수소인 화합물.

청구항 49

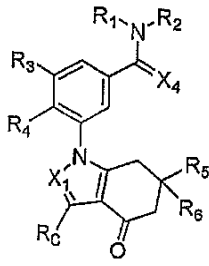
제 42항에 있어서, R_3 및 R_4 가 플루오로인 화합물.

청구항 50

제 42항에 있어서, R_3 및 R_4 가 각각 브로모 및 플루오로인 화합물.

청구항 51

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물 또는 염:



청구항 52

제 51항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며;

R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물 또는 염.

청구항 53

제 51항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

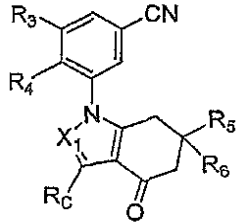
R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물 또는 염.

청구항 54

제 51항에 있어서, R_3 , R_4 , 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물 또는 염.

청구항 55

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물:



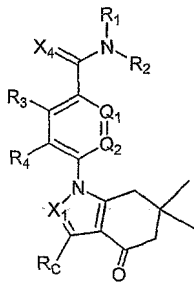
상기 식에서,

R_3 및 R_4 는 독립적으로 할로젠 또는 수소이나,

단 R_3 및 R_4 중 하나 이상은 할로젠이다.

청구항 56

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물:



청구항 57

제 56항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

청구항 58

제 57항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{21}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이며, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며;

R_{21} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 59

제 57항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 60

제 57항에 있어서, R_3 , R_4 , 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물.

청구항 61

제 57항에 있어서, R_3 및 R_4 가 모두 $-H$ 인 화합물.

청구항 62

제 1항에 있어서, Y가 CH인 화합물.

청구항 63

제 1항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

청구항 64

제 1항에 있어서, Y가 CR_c 이며, 여기서

R_c 가 메틸, 에틸, 시클로프로필, 또는 트리플루오로메틸인 화합물.

청구항 65

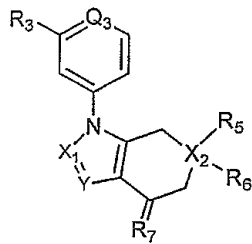
제 1항에 있어서, Y가 $C(CH_3)$ 인 화합물.

청구항 66

제 1항에 있어서, Y가 $C(CF_3)$ 인 화합물.

청구항 67

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물:



청구항 68

제 67항에 있어서, Q₃이 CR₂₁인 화합물.

청구항 69

제 67항에 있어서,

R₃이 -NH(R)-이며, 여기서 R이 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -C₁-C₁₀ 알킬-OR₀, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 70

제 69항에 있어서,

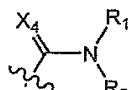
Q₃이 CR₂₁이고;

R₃이 -NH(R)이고, 여기서 R이 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -C₁-C₁₀ 알킬-OR₀, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 71

제 70항에 있어서,



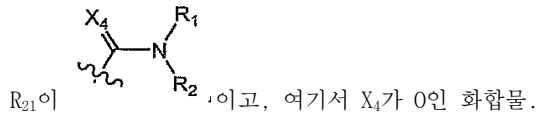
R₂₁이 시아노 또는 R₂₁이고, 여기서 X₄가 O인 화합물.

청구항 72

제 70항에 있어서, R_{21} 이 시아노인 화합물.

청구항 73

제 70항에 있어서,



청구항 74

제 73항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

청구항 75

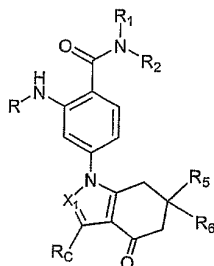
제 73항에 있어서, X_1 이 CR_c 인 화합물.

청구항 76

제 73항에 있어서, R_7 이 O인 화합물.

청구항 77

제 1항에 있어서, 하기 화학식의 화합물:



청구항 78

제 77항에 있어서,

R 이 $-R_{22}-R'$ 이며, 여기서

R' 가 C_1-C_{13} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R' 가 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-C_1-C_{10}$ 알킬- OR_0 , 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 79

제 78항에 있어서, X_1 이 CR_c 인 화합물.

청구항 80

제 79항에 있어서, R_1 및 R_2 가 수소인 화합물.

청구항 81

제 78항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

청구항 82

제 81항에 있어서, R_1 및 R_2 가 수소인 화합물.

청구항 83

제 17항 내지 제 20항, 제 27항 내지 제 34항, 제 38항 내지 제 55항, 또는 제 64항 내지 제 73항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 N인 화합물.

청구항 84

제 17항 내지 제 20항, 제 27항 내지 제 34항, 제 38항 내지 제 55항, 또는 제 64항 내지 제 73항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 CR_c 인 화합물.

청구항 85

제 17항 내지 제 20항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 N이고 X_4 가 0인 화합물.

청구항 86

제 17항 내지 제 20항 중 어느 한 항에 있어서, X_1 이 N이고 X_4 가 NOH인 화합물.

청구항 87

제 83항 내지 제 86항 중 어느 한 항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서

Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{Z1} 이 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 88

제 83항 내지 제 86항 중 어느 한 항에 있어서,

R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서

R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2

개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R₂₁이 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, C₁-C₆ 알콕시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물.

청구항 89

제 86항 또는 제 87항에 있어서, Y가 CR_c이고, R_c가 -H, C₁-C₄ 알킬, C₁-C₃ 할로알킬, 시클로프로필, 또는 시클로프로필(C₁-C₂)알킬인 화합물.

청구항 90

제 1항에 있어서,

2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴;

2-(4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-(테트라히드로-피란-4-아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-(2-메톡시-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-(3,4,5-트리메톡시-페닐아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

[2-[(피리딘-3-일메틸)-아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-(4-옥소-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-[4-(2-모프롤린-4-일-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;

2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴;

2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;

2-(테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(1-옥소-헥사히드로-1-테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(1,1-디옥소-헥사히드로-1-테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴;

2-(시클로펜트-3-엔일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시아닐리노)-벤즈아미드;

아미노-아세트산 4-[2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6, 7-테트라히드로-인돌-1-일)-페닐아미노]-시클로헥실 에스테르; 메탄설폰산 염;

디메틸아미노-아세트산 트랜스-4-[2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-페닐아미노]-시클로헥실 에스테르; 메탄설폰산 염;

2-[3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아미노]-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;

4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드;

2-브로모-4-(3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴;

4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)

- 2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드;
- 2-[3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 4-(3-시클로프로필메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-[2-(2-디메틸아미노-에톡시)-피리딘-4-일아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드, 메탄설폰산 염;
- 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-티오피란-4-일아미노)-벤즈아미드;
- 4-(3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-티오피란-4-일아미노)-벤즈아미드;
- 2-[(테트라히드로-푸란-2-일메틸)-아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-[3-(2-옥소-피롤리딘-1-일)-프로필아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-(알릴아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(시클로프로필아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(2-메톡시에틸아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-2-(페닐아미노)벤즈아미드;
- 2-(4-히드록시시클로헥실아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시페닐아미노)벤즈아미드;
- 2-(2-(디메틸아미노)에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(2-(디메틸아미노)에틸아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(피리딘-4-일메틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-2-(피리딘-3-일메틸아미노)벤즈아미드;
- 3차-부틸 4-(2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)페닐아미노)피페리딘-1-카르복실레이트;
- 2-아미노-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(알릴아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(1-메틸피페리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 3-부톡시-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(2,3-디히드로-1H-인덴-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드;
- 1-(2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)페닐)우레아;

2-브로모-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조니트릴;
 3-플루오로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조니트릴;
 3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(페닐아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-N'-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈이미다미드;
 2-벤질아미노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;
 3-프로프-2-이닐옥시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;
 2-에틸닐-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;
 2-(4-메톡시-페닐아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;
 2-시클로헥실아미노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드;
 2-(부틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-벤즈아미드; 또는
 4-메틸-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드인 화합물.

청구항 91

제 1항에 있어서,

3-(3-티에닐)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-메틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3-에티닐페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-클로로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-아닐리노-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-아닐리노-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)피리딘-2-카르복사미드;
 2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-피리딘-4-일-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 N-[2-(아미노카르보닐)-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]-L-발린;
 2-모르폴린-4-일-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(1H-이미다졸-1-일)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(3-클로로-2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;
 2-[(4-히드록시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(1-에틸-1H-피라졸-5-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(5-메틸이속사졸-3-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-(아미노카르보닐)페닐)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;
 2-[(6-메톡시피리딘-3-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(알릴아미노)-4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

3-브로모-4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드; 2-(알릴아미노)-4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(2-메톡시에틸)아미노]벤즈아미드;

2-({3-[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐}아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(모르폴린-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-모르폴린-4-일에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(피리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(아세틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(4-메틸피페라진-1-일)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(메톡시아세틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-에틸-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(부틸티오)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-({3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-메톡시페닐}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(피리딘-4-일티오)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[[1-페닐에틸]아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;

2-({2-[2-(디메틸아미노)에톡시]피리딘-4-일}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[[1-(N,N-디메틸글리실)피페리딘-4-일]아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-{{2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐}아미노}에틸)아미노]-2-옥소에틸아세테이트;

2-{{2-(글리콜로일아미노)에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-{{2-(메틸설포닐)에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-(시클로부틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[4-(2-히드록시-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;

- 2-(4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([2-메톡시-1-(메톡시메틸)에틸]아미노)벤즈아미드;
- 2-{[3-히드록시-1-(2-히드록시에틸)프로필]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([2-메톡시-1-(메톡시메틸)에틸]아미노)벤즈아미드;
- 2-{[3-(메틸설포닐)페닐]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([1-(메틸설포닐)피페리딘-4-일]아미노)벤즈아미드;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(4-히드록시-시클로헥실아미노)-벤즈아미드;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-[4-(2-히드록시-에톡시)-시클로헥실아미노]-벤즈아미드;
- 2-{[1-(3-모르폴린-4-일프로파노일)피페리딘-4-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-[4-(2-아미노-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-[(1-글리실피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-[4-(2-아미노-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
- 2-{[1-(메틸설포닐)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[3-(메틸설포닐)프로필]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([2-[(메틸설포닐)아미노]에틸]아미노)벤즈아미드;
- 4-(3-부트-3-엔-1-일-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[1-(메틸설포닐)피롤리딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-([2-[(디메틸아미노)설포닐]에틸]아미노)-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드; 또는
- 4-[3-(2-아미노-에틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일]-벤즈아미드인 화합물.

청구항 92

제 1항에 있어서,

- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤조산;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-[4-(메톡시)아미노]-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

4-[4-(히드록시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-메틸-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-클로로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조산;
 4-[4-(에톡시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-[6,6-디메틸-4-(페녹시이미노)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-[4-(이소부톡시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-{4-[(알릴옥시)이미노]-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일}벤즈아미드;
 4-{6,6-디메틸-4-[(테트라히드로-2H-피란-2-일옥시)이미노]-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일}벤즈아미드;
 4-{4-[(벤질옥시)이미노]-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일}벤즈아미드;
 4-[4-(히드록시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;
 4-[(4-(메톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-{4-[(알릴옥시)이미노]-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일}벤즈아미드;
 4-[4-(이소부톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일}벤즈아미드;
 4-{4-[(벤질옥시)이미노]-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일}벤즈아미드;
 3-[4-(메톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로벤조-1H-인돌-1-일]-4-메틸벤즈아미드;
 3-[4-(히드록시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]-4-메틸벤즈아미드;
 4-[6-(1,3-벤조디옥솔-5-일)-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤조산;
 4-[6-(1,3-벤조디옥솔-5-일)-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-[6-(1,3-벤조디옥솔-5-일)-4-(히드록시이미노)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 2-(트리플루오로메틸)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-메톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(부틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-에톡시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-메톡시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-에톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(2-히드록시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(2-에톡시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(테트라히드로푸란-3-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(4-플루오로페녹시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-{[2-(디메틸아미노)에틸]아미노}-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-아닐리노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

3-플루오로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(6,6-디메틸-4-옥소-2-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-클로로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(벤질아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-브로모-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-히드록시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-아미노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(3차-부틸티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(페닐티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(부틸티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(디메틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-메톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-에톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-프로폭시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(벤질옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-모르폴린-4-일에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(피리딘-2-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(피리딘-4-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-이소프로폭시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-피롤리딘-2-일에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(테트라히드로-2H-피란-2-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(테트라히드로-2H-피란-4-일옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(부틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-클로로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(1H-이미다졸-4-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조산;
 3-아닐리노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(벤질아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(3-히드록시프로폭시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(3-히드록시부톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2,3-디히드록시프로폭시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 N-부틸-4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-메틸부톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(펜틸옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

3-(3-메틸부톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N-페닐벤즈아미드;
 2-(시클로헥실아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
 3-(시클로헥실옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(펜트-4-엔-1-일옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(1,3-벤조디옥솔-5-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(헥실아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(4-히드록시부톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-[(3-메틸옥세탄-3-일)메톡시]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(4-아미노부톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(테트라히드로푸란-3-일옥시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-(테트라히드로푸란-2-일메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-[(1-에틸프로프-2-엔-1-일)옥시]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 3-(2-티에닐메톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(메틸설포닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(아세틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(아미노카르보닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(벤조일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(부티릴아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-에톡시-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)피리딘-2-카르복사미드;
 2-(피리딘-3-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(피리딘-2-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조산;
 2-[(3-에톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N'-히드록시벤젠카르복사미다미드;
 N'-히드록시-3-메틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복사미다미드;
 3-메틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-클로로-N-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복사미다미드;
 2,3-디플루오로-N-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복사미다미드;
 8-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2,3-디히드로-1,4-벤조디옥신-5-카르복사미드

드;

2-펜틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

3-펜틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-부톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-아닐리노-N'-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복스이미다미드;

2-{[4-(트리플루오로메톡시)페닐]아미노}-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-클로로-4-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-클로로-4-메틸페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-클로로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,4-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-플루오로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,5-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2,5-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-에톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-페녹시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(페닐티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(시클로프로필아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(프로프-2-인-1-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

3-(프로필티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

N-히드록시-3-(프로필티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복스이미다미드;

N-[2-(아미노카르보닐)-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]-L-페닐알라닌;

3-부톡시-4-[4-(히드록시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-(디에틸아미노)에틸 3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조에이트;

2-[(2-클로로-3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3-클로로-2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;

4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;

2-[(3,4,5-트리플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-메틸페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(2,3-디히드로-1H-인덴-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-프로필페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-이소프로필페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(3-히드록시프로프-1-인-1-일)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-클로로-3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(4-옥소-2-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2,4,5-트리플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,4,5-트리메톡시벤질)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-플루오로-3-메틸페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-히드록시-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-플루오로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2,4-디플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,4-디플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-아닐리노-4-{5-[(디메틸아미노)메틸]-2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일}벤즈아미드;

4-[4-(히드록시이미노)-2-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;

2-[(4-(벤질옥시)페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(1,3-디옥솔란-2-일메틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-(2-히드록시에톡시)에틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-히드록시부틸)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3-모르폴린-4-일프로필)아미노]벤즈아미드;

2-[(피리딘-2-일메틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-(디에틸아미노)-4-에톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-(디플루오로메톡시)페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,4-디메톡시벤질)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

- 2-[(3-히드록시프로필)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(알릴아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-[4-(히드록시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;
- 2-[(3-메톡시프로필)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(피리딘-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[3-(1H-이미다졸-1-일)프로필]아미노}-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[2-(1H-이미다졸-1-일)에틸]아미노}-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(이속사졸-3-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[(피리딘-3-일메틸)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)프탈아미드;
- 3-브로모-N'-히드록시-4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤젠카르복시이미다미드;
- 4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)프탈산;
- 2-[(10-아미노데실)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(알릴아미노)-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(2,3-디히드로-1H-인텐-1-일아미노)-4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(시클로프로필아미노)-4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 3-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[3-(3-히드록시프로폭시)-4-메톡시페닐]아미노}-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(알릴아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-(시클로프로필아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-에틸-2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[(2-{2-[2-(2-아미노에톡시)에톡시]에틸}아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드];
- 2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-아닐리노-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;
- 2-아닐리노-4-(2,3-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드;
 2-[(2-(디메틸아미노)에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-(디메틸아미노)에틸)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-브로모-5-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 (4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐)아미노]피페리딘-1-일)아세트산;
 2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(피리딘-4-일메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(3-이소부틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-아미노-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(알릴아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 3-부톡시-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(2,3-디히드로-1H-인덴-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(아미노카르보닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3-모르폴린-4-일프로필)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-(2-모르폴린-4-일에톡시)시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(8-메틸-8-아자비시클로[3.2.1]옥트-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-(3-에틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-(시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

- 2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-(시클로프로필아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-(시클로프로필아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3,4-디메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3,4-디메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3-[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]아미노}-2-옥소에틸 아세테이트;
 2-[(3-메톡시프로필)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-{[3-(1H-이미다졸-1-일)프로필]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]아미노}시클로헥실 글리시네이트;
 2-[(2-아미노에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]아미노}시클로헥실 아세테이트;
 4-(3-에틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]벤즈아미드;
 2-[(1,4-디옥산-2-일메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-푸릴메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-푸릴메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-피페라진-1-일에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 2-[(2-피페라진-1-일에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
 2-[(3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-메톡시페닐]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 2-(알릴아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐]아미노}시클로헥실 글리시네이트;
 2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
 4-[4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
 4-(3-에틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N'-히드록시-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]벤젠카르복시이미다미드;
 2-{[2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-

일)벤즈아미드;

2-{{2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-{{2-(디메틸아미노)에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-{{2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐}아미노}시클로헥실 N,N-디메틸글리시네이트;

3-클로로-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤조산;

2-(피리딘-3-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(피리딘-4-일티오)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-글리실피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

N-히드록시-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

N-(2-메톡시에틸)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-{{1-페닐에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-에틸피페리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-{{1-페닐에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-{{1-페닐에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(4-메톡시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-{{3-(2-옥소피롤리딘-1-일)프로필}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-{{3-[[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐]아미노}-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-(2,1,3-벤조티아디아졸-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-클로로페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-{{2-[2-(디메틸아미노)에톡시]피리딘-4-일}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)벤즈아미드;

2-{{2-히드록시-2,3-디히드로-1H-인텐-1-일}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

3-{{2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐}아미노}벤조산;

4-{{2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐}아미노}시클로헥실 N,N-디메틸글리시네이트;

2-[(1-옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)옥시]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-

1-일)벤즈아미드;

2-[(1,1-디옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)옥시]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인
다졸-1-일)벤즈아미드;

4-(3-메틸-4-옥소-5,6,7,8-테트라히드로시클로헥타[b]피롤-1(4H)-일)-2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)벤
즈아미드;

2-{2-(메틸티오)에틸}아미노-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-({3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-메톡시페닐}아미노)-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-
테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-({2-[2-(디메틸아미노)에톡시]피리딘-4-일}아미노)-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테
트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

4-({2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐}아미노)시클로
헥실 (아세틸옥시)아세테이트;

2-(테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤
즈아미드;

2-[(1-옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인
다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1,1-디옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-
1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-({3-(아미노카르보닐)페닐}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아
미드;

2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(2,2,2-트리플루오로에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아
미드;

2-({3,4-디히드록시시클로펜틸}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈
아미드;

2-[(6-메톡시피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-
테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-메틸-6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인
다졸-1-일)벤즈아미드;

4-({2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐}아미노)시클로
헥실 메톡시아세테이트;

2-({1-[3-(디메틸아미노)프로필]-6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-
4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-({2-(2-옥소피롤리딘-1-일)에틸}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-
일)벤즈아미드;

2-({3-(트리플루오로메톡시)페닐}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤
즈아미드;

4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(테트라히드로-2H-피란-
4-일아미노)벤즈아미드;

4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로
헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(테트라히드로-2H-티오

피란-4-일아미노)벤즈아미드;

4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노)벤즈아미드;

2-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

N-(2-아미노페닐)-3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

2-[(2-옥소피페리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 L-알라니네이트;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 D-알라니네이트;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 L-알라니네이트;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 D-알라니네이트;

1-[4-(아미노카르보닐)-3-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)페닐]-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-3-카르복실산;

5-브로모-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(3-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 카르복실산;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]시클로헥실 글리시네이트;

4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 L-발리네이트;

2-[(2,6-디히드록시테트라히드로-2H-피란-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1-옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)아미노]벤즈아미드;

4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1-옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)아미노]벤즈아미드;

2-(시클로헥스-3-엔-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(3,4-디히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

- 2-([4-(트리플루오로메톡시)페닐]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-([2-(아미노카르보닐)-5-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐]아미노)시클로헥실 글리시네이트;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(3-에틸페닐)아미노]벤즈아미드;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[[3-(2-옥소피롤리딘-1-일)프로필]아미노]벤즈아미드;
- 4-(트리플루오로메틸)-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-([3-(메틸티오)페닐]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-(트리플루오로메틸)-3-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 3-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드;
- 2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(피페리딘-4-일아미노)벤즈아미드;
- 2-[(1-아세틸피페리딘-4-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 2-[(1-벤질피페리딘-4-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 4-([2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐]아미노)-N,N-디메틸피페리딘-1-카르복사미드;
- 2-브로모-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-N'-히드록시벤젠 카르복사이미다미드;
- 2-[(1-벤질피롤리딘-3-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1-페닐피페리딘-4-일)아미노]벤즈아미드;
- ({[1-[4-(아미노카르보닐)-3-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)페닐]-6,6-디메틸-3-(트리플루오로메틸)-1,5,6,7-테트라히드로-4H-인다졸-4-일리덴]아미노}옥시)아세트산;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[[2-히드록시-1,1-비스(히드록시메틸)에틸]아미노]벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[테트라히드로푸란-3-일아미노]벤즈아미드;
- 4-([2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐]아미노)시클로헥실 L-알라니네이트; 메탄설포네이트
- 4-([2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐]아미노)시클로헥실 L-발리네이트 메탄설포네이트;
- 2-[알릴(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-아미노-프로피온산 4-[2-카르바모일-5-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-페닐아미노]시클로헥실 에스테르;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(4-피리딘-2-일피페라진-1-일)벤즈아미드;

2-[(2,3-디히드록시프로필)(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)(2-옥소에틸)아미노]벤즈아미드;

2-[(2,3-디히드록시프로필)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-[(2,3-디히드록시프로필)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤조산;

2-(아세톡시메틸)-2-(2-카르바모일-5-(6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐아미노)프로판-1,3-디일 디아세테이트;

2-[(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]-2-(히드록시메틸)프로판-1,3-디일 디아세테이트;

2-[(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]-3-히드록시-2-(히드록시메틸)프로필 아세테이트;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)(2-히드록시에틸)아미노]벤즈아미드;

2-[(4-[2,2,2-트리플루오로-1-히드록시-1-(트리플루오로메틸)에틸]페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-[3-(4-메틸피페라진-1-일)프로파노일]피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-이소니코티노일피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-(피리딘-3-일카르보닐)피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-(1-아자비시클로[2.2.2]옥트-3-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-(메틸설포닐)피롤리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-베타-알라닐피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-프롤릴피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[(1-아세틸피롤리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

3-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐)아미노]-N,N-디메틸피롤리딘-1-카르복사미드;

[[2-카르바모일-5-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-페닐]-(4-히드록시-시클로헥실)-아미노]-아세트산;

- 2-{[4-(히드록시메틸)페닐]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-{[3-히드록시시클로헥실]아미노}벤즈아미드;
- 2-{[테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[4-(알릴옥시)시클로헥실]아미노}-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 2-[(1-이소니코티노일아제티딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[1-(피리딘-3-일카르보닐)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[1-(3-모르폴린-4-일프로파노일)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[1-[3-(4-메틸피페라진-1-일)프로파노일]아제티딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-{[3-(메틸티오)프로필]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-[테트라히드로푸란-3-일]아미노}벤즈아미드;
- 2-{[2-메톡시-1-메틸에틸]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-(테트라히드로-2H-피란-2-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
- 2-[[4-(알릴옥시)시클로헥실](3,5-디메톡시벤질)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 2-[[4-(2,3-디히드록시프로폭시)시클로헥실](3,5-디메톡시벤질)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 4-{3-[(벤질옥시)메틸]-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일}벤즈아미드;
- 2-({2-[(디메틸아미노)설포닐]에틸}아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 2-[피롤리딘-3-일아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드 히드로클로라이드;
- 2-{[1-아세틸피롤리딘-3-일]아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
- 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-{[4-(2-옥소에톡시)시클로헥실]아미노}벤즈아미드;
- 2-{[4-(2,3-디히드록시프로폭시)시클로헥실]아미노}-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-({2-[(이소프로필설포닐)아미노]에틸}아미노)벤즈아미드;
- 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-{[4-(2-히드록시에톡시)시클로헥실]아미노}벤즈아미드;

{[4-(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]시클로헥실]옥시}아세트산;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-({2-[(페닐설폰일)아미노]에틸}아미노)벤즈아미드;

2-{{2-(모르폴린-4-일설폰일)에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[3-(2-아미노에틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-{메틸[테트라히드로푸란-3-일]아미노}벤즈아미드;

2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노]벤즈아미드;

4-브로모-2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

4-(3-에틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-{[2-(히드록시이미노)에틸]옥시}시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3-이소부틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-(3-시클로프로필-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

4-[3-(아미노메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드 메탄설폰네이트 (염);

2-[(1-메틸-2-옥소-2-피페리딘-1-일에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

4-[3-(2-아미노에틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3-이소프로필-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;

2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-(테트라히드로푸란-3-일아미노)벤즈아미드;

4-[3-(시클로프로필메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]벤즈아미드;

2-[(4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(2,3,6,6-테트라메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

4-[3-(시클로프로필메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드; 또는

2-{{2-(디메틸아미노)-2-옥소에틸}아미노}-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드인 화합물.

청구항 93

제 1항에 따른 하나 이상의 화합물 또는 염, 및 약제학적으로 허용되는 용매, 담체, 부형제, 보조제 또는 이의 조합물을 포함하는 약제 조성물.

청구항 94

암, 염증 또는 관절염을 치료하는 방법으로서,

치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 환자에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 95

용기에, 제 1항의 화합물을 사용하는 방법에 관한 지시서와 함께 상기 화합물을 포함하는 패키지.

청구항 96

세포 증식과 관련된 질환 또는 상태를 치료하는 방법으로서,

치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 환자에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 97

제 96항에 있어서, 질환 또는 상태가 암, 염증, 또는 관절염인 방법.

청구항 98

HSP-90에 대한 클라이언트 단백질이거나 이 클라이언트 단백질에 간접적으로 영향을 미치는 단백질의 질환 또는 질병을 앓는 피검체를 치료하는 방법으로서,

치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 피검체에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 99

제 97항에 있어서, 질환이 염증성 질환, 감염, 자가면역 질환, 뇌졸중, 허혈, 심장 질환, 신경계 질환, 섬유유전 질환, 증식 질환, 종양, 백혈병, 신생물, 암, 암종, 대사 질환, 및 악성 질환으로 구성되는 군으로부터 선택되는 방법.

청구항 100

제 98항에 있어서, 섬유유전 질환이 피부경화증, 다발근육염, 전신 루푸스, 류마티스 관절염, 간 경화, 켈로이드 형성, 사이질 콩팥염 및 폐 섬유증으로 구성되는 군으로부터 추가로 선택되는 방법.

청구항 101

플라스모듐 (*Plasmodium*) 종으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염으로부터 피검체를 보호하는 방법으로서,

유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을, 상기 유기체로의 노출로 인해 감염의 위험이 있는 피검체에게 투여하는 방법.

청구항 102

피검체에게서, 플라스모듐 종으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염의 수준을 감소시키는 방법으로서,

유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을, 감염된 피검체에게 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 103

후생동물 기생충으로 감염된 환자를 치료하는 방법으로서,

유효량의 제 1항의 화합물 또는 염을 투여하는 것을 포함하는 방법.

청구항 104

제 101항 또는 제 102항에 있어서, 종이 플라스모듐 팔시파룸 (*Plasmodium falciparum*)인 방법.

청구항 105

제 103항에 있어서, 후생동물 기생충이 플라스모듐 팔시파룸인 방법.

청구항 106

하나 이상의 제 1항의 화합물 또는 염, 및 약제학적으로 허용되는 용매, 담체, 부형제, 보조제 또는 이들의 조합물을 포함하는 약제 조성물.

청구항 107

치료가 필요한 환자에서 암, 염증 또는 관절염 치료용 약물을 제조하기 위해, 단독으로 또는 동일한 질환에 대해 처방된 다른 치료제와 함께 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 108

용기에, 제 1항의 화합물의 사용 방법에 대한 지시서와 함께 상기 화합물을 포함하는 패키지.

청구항 109

치료가 필요한 환자에서, 세포 증식과 관련된 질환 또는 상태 치료용 약물을 제조하기 위해 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 110

제 109항에 있어서, 질환 또는 상태가 암, 염증, 또는 관절염인 용도.

청구항 111

치료가 필요한 피검체에서, HSP-90에 대한 클라이언트 단백질이거나 이의 클라이언트 단백질에 간접적으로 영향을 미치는 단백질의 질환 또는 질병 치료용 약물을 제조하기 위해 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 112

제 111항에 있어서, 질환이 염증성 질환, 감염, 자가면역 질환, 뇌졸중, 허혈, 심장 질환, 신경계 질환, 섬유유전 질환, 증식 질환, 종양, 백혈병, 신생물, 암, 암종, 대사 질환 및 악성 질환으로 구성되는 군으로부터 선택되는 용도.

청구항 113

제 112항에 있어서, 섬유유전 질환이 피부경화증, 다발근육염, 전신 루푸스, 류마티스 관절염, 간 경화, 켈로이드 형성, 사이질 콩팥염 및 폐 섬유증으로 구성되는 군으로부터 추가로 선택되는 용도.

청구항 114

플라스모뎀 중으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염으로부터 피검체 보호용 약물을 제조하기 위해 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 115

치료가 필요한 피검체에서, 플라스모뎀 중으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염 수준 감소용 약물을 제조하기 위해 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 116

후생동물 기생충으로 감염된 환자 치료용 약물을 제조하기 위해 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 117

제 114항 또는 제 115항에 있어서, 종이 플라스모뎀 팔시파름인 용도.

청구항 118

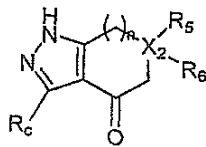
제 116항에 있어서, 후생동물 기생충이 플라스모듐 팔시파툼인 용도.

청구항 119

곰팡이 감염을 앓는 환자 치료용 약물을 제조하기 위해 사용되며, 단독으로 또는 공지된 항곰팡이제와 함께 사용되는, 치료학적 유효량의 제 1항의 화합물 또는 염의 용도.

청구항 120

하기 화학식의 화합물:



상기 식에서,

R_c 는 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{c'}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서

각각의 알킬, 아릴, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_6)알킬아미노, 시아노, 니트로, 할로(C_1-C_6)알킬, 할로(C_1-C_6)알콕시, 카르복스아미드, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않고, 여기서

아릴 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_6)알킬아미노, 할로(C_1-C_6)알킬, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

$R_{c'}$ 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{c''}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서

$R_{c''}$ 는 $-H$, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이거나;

각각의 R_{CN} 은 독립적으로 $-H$, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ 할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, $-$ 헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, $-$ 아릴, 또는 $-$ 헤테로아릴이며, 여기서

각각의 알킬, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_6)알킬아미노, 니트로, 할로(C_1-C_6)알킬, 할로(C_1-C_6)알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

R_5 및 R_6 는 독립적으로 H , C_1-C_6 알킬, 또는 아릴이고, 여기서

아릴은 독립적으로 C_1-C_6 알킬, C_1-C_6 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C_1-C_6)알킬아미노, 니트로, 할로(C_1-C_6)알킬, 할로(C_1-C_6)알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 치환기로 치환되거나 치환되지 않으며,

여기서 임의의 2개의 인접한 치환된 아릴 위치는, 이들이 결합되는 탄소 원자들과 함께 불포화 시클로알킬 또는 헤테로시클로알킬을 형성하거나;

R_5 및 R_6 은 이들이 결합되는 탄소와 함께 3 내지 8원의 고리를 형성하고;

n 은 0, 1, 2, 3 또는 4이다.

청구항 121

제 94항에 있어서, (a) 하나 이상의 추가적인 항암제 또는 조성물, 또는 (b) 방사선 치료의 투여를 추가로 포함

하고, 암의 치료를 위한 방법.

명세서

기술분야

- [0001] 본 발명은 벤젠, 피리딘 및 피리다진 유도체, 및 보다 구체적으로는 세포 증식과 관련된 질환 및/또는 상태, 예컨대 암, 염증 및 염증 관련 질환, 및 혈관형성과 관련된 질환의 치료 및/또는 예방에 유용한 그러한 화합물에 관한 것이다. 본 발명의 화합물은 또한 감염 질환, 특히 곰팡이 감염의 치료 및/또는 예방에 유용하다.

배경기술

- [0002] 암은 비정상적인 세포 증식에 의해 특징된다. 암 세포는, 전형적으로 다른 조직을 침투하여 모세혈관 내증식을 유도하고 이로써 증식되는 암세포에 부적절하게 혈액이 공급되게 하는 것을 포함하여, 숙주를 위험하게 하는 다수의 특성을 나타낸다. 암세포의 특징은, 정상 세포에서 세포 분열을 조절하고 이들이 궁극적으로 숙주 세포를 치사시킬 때까지 계속적으로 분열하는 제어 메커니즘에 대한 이들의 비정상적인 반응에 있다.

- [0003] 혈관형성은 정상 조건 하에서는 고도로 조절되는 과정이지만, 다수의 질환이 계속적으로 미조절된 혈관형성에 의해 유발된다. 미조절된 혈관형성은 특정 질환을 직접 발병시키거나, 현재 병리학적 상태를 악화시킬 수 있다. 예를 들어, 안구의 혈관신생은 실명의 가장 일반적인 원인으로 추정될 뿐만 아니라, 다수 안 질환의 주 원인으로 여겨지고 있다. 또한, 특정의 현존하는 상태에서, 예를 들어 관절염에서, 새로 형성된 모세혈관은 관절을 침입하고 연골을 파괴하거나, 당뇨병의 경우에는, 망막에서 새로 형성된 모세혈관이 유리체를 침입하여 출혈을 일으키고 실명을 야기한다. 고형 종양의 성장 및 전이는 또한 혈관형성에 따라 달라진다 [참조: Folkman, J., Cancer Research, 46, 467-473 (1986), Folkman, J., Journal of the National Cancer Institute, 82, 4-6 (1989)]. 예를 들어, 2 mm 초과로 성장한 종양은 이들 자신의 혈액 공급을 얻어야 하며 신생 모세혈관의 성장을 유도함으로써 혈액 공급받음이 밝혀졌다. 일단 이러한 신생 혈관이 종양 내에 매립되게 되기만 하면, 이들은 종양 세포가 순환계로 유입되고 원격 위치, 예컨대 간, 폐 또는 폐로의 전이되게 하는 수단을 제공한다 [참조: Weidner, N., et al., The New England Journal of Medicine, 324(1), 1-8 (1991)]. 미조절된 혈관형성 조건 하에서, 혈관형성을 제어, 진압 및/또는 억제하도록 설계된 치료 방법은 이들 상태 및 질환의 완치 또는 완화를 유도할 수 있었다.

- [0004] 염증은 다양한 질환, 예컨대 통증, 두통, 열, 관절염, 천식, 기관지염, 생리통, 건염, 윤활낭염, 건선, 습진, 화상, 피부염, 염증성 장 증후군, 크론 병, 위염, 과민성 장 증후군, 궤양성 결장염, 혈관 질환, 흡킨스 병, 피부경화증, 류마티스 열, 제 I 형 당뇨병, 중증 근육무력증, 사르코이드 증, 콩팥 증후군, 베체트 증후군, 다발 근육염, 과민증, 결막염, 잇몸염, 외상후 팽창, 심근허혈 등과 관련된다.

- [0005] 열 쇼크 단백질 90 (HSP-90)은 사이클린-의존성 키나아제 CDK4를 포함하는 다수의 진행 단백질 키나아제의 활성화를 위해 필요한 세포 사페론 단백질이다. 겔다나마이신, HSP-90의 단백질 재폴딩 활성 억제제가 항증식 및 항종양 활성을 갖는 것으로 입증되었다.

- [0006] HSP-90은 정상적인 폴딩, 세포 성장 및 생존에 대한 다수의 핵심적인 조절제의 세포내 배치 및 단백질분해 전환 (turnover)을 안내하는 분자 사페론이다. 이의 기능은 종양 형성 동안에 파괴되어 악성 세포전환을 가능케 하고 신속한 체내 확산을 촉진시키며, 돌연변이 단백질이 기능을 유지 또는 심지어 기능을 획득케 한다. HSP-90의 억제는 그러한 과정을 완속시키므로 이에 따라 잠재적인 치료적 용도를 갖는다 [참조: Whitesell L, Lindquist, SL, Nature Rev. Cancer, 2005, 10, 761-72].

- [0007] 안사마이신 항생제, 예를 들어 허비마이신 A (HA), 겔다나마이신 (GM), 및 17-알릴아미노겔다나마이신 (17-AAG)은 HSP-90의 N-말단 포켓에 치밀하게 결합하여, HSP-90과 정상적으로 상호작용하는 기질을 탈안정화시킴으로써 이들의 항암 효과를 나타내는 것으로 사료된다 [참조: Stebbins, C. et al. Cell 1997, 89, 239-250]. 이 포켓은 고도로 보존되며, DNA 기라아제의 ATP-결합 위치에 약한 상동성을 지닌다 [참조: Stebbins, C. et al., supra; Grenert, J. P. et al. J. Biol. Chem. 1997, 272, 23843-50].

- [0008] 시험관내 및 생체내 연구로부터, 안사마이신 및 기타 HSP-90 억제제에 의한 이 N-말단 포켓 점유되면 HSP-90의 기능이 변경되고 단백질 폴딩이 억제됨이 입증되었다. 고농도에서, 안사마이신 및 기타 HSP-90 억제제는 단백질 기질의 HSP-90으로의 결합을 억제함이 입증되었다 [참조: Scheibel, T. H. et al., Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1999, 96, 1297-302; Schulte, T. W. et al., J. Biol. Chem. 1995, 270, 24585-8; Whitesell, L., et

al. Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1994, 91, 8324-8328]. 안사마이신은 또한 샤페론 관련된 단백질 기질의 ATP-의존적인 분리를 억제시키는 것으로 입증되었다 [참조: Schneider, C. L. et al., Proc. Natl. Acad. Sci., USA 1996, 93, 14536-41; Sepp-Lorenzino et al., J. Biol. Chem. 1995, 270, 16580-16587]. 이 경우에, 기질은 프로테아좀에서의 유비퀴틴-의존 과정에 의해 분해된다 [참조: Schneider, C. L., supra; Sepp-Lorenzino, L., et al. J. Biol. Chem. 1995, 270, 16580-16587; Whitesell, L. et al. Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1994, 91, 8324-8328]. HSP-90 기질의 탈안정화는 종양 및 비형질전환된 세포에서 유사하게 일어나며, 이는 하위 그룹의 시그널링 조절제, 예를 들어 Raf (참조: Schulte, T. W. et al., Biochem. Biophys. Res. Commun. 1997, 239, 655-9; Schulte, T. W., et al., J. Biol. Chem. 1995, 270, 24585-8), 핵 스테로이드 수용체 (참조: Segnitz, B.; U. Gehring J. Biol. Chem. 1997, 272, 18694-18701; Smith, D. F. et al. Mol. Cell Biol. 1995, 15, 6804-12), v-Src (참조: Whitesell, L., et al. Proc. Natl. Acad. Sci. USA 1994, 91, 8324-8328) 및 특정 막 티로신 키나아제 (참조: Sepp-Lorenzino, L. et al. J. Biol. Chem. 1995, 270, 16580-16587), 예컨대 EGF 수용체 (EGFR) 및 HER2/Neu (참조: Hartmann, F., et al. Int. J. Cancer 1997, 70, 221-9; Miller, P. et al. Cancer Res. 1994, 54, 2724-2730; Minnaugh, E. G., et al. J. Biol. Chem. 1996, 271, 22796-801; Schnur, R. et al. J. Med. Chem. 1995, 38, 3806-3812), CDK4 및 돌연변이 p53 (참조: Erlichman et al. Proc. AACR 2001, 42, abstract 4474)에 대해 특히 효과적인 것으로 확인되었다. 이들 단백질의 안사마이신 유도된 손실은 특정 조절 경로를 선택적으로 파괴시키고, 세포 주기의 특이적인 상들에서 성장을 억제시켰으며 (참조: Muise-Heimericks, R. C. et al. J. Biol. Chem. 1998, 273, 29864-72), 및 아포토시스, 및/또는 그렇게 처리된 세포의 분화 (참조: Vasilevskaya, A. et al. Cancer Res., 1999, 59, 3935-40)를 초래한다. 따라서, HSP-90의 억제제는 다수 유형의 암 및 증식성 질환의 치료 및/또는 예방에 대해 매우 유망할 뿐만 아니라, 전형적인 항생제로서도 유망하다.

[0009] HSP-90의 억제는 또한 샤페론 HSP 70의 발현을 조절하는 것으로 공지되어 있다. HSP 70의 상향 조절은 하기 질환들을 포함하나 그것들에 한정되지 않는 광범위한 신경퇴행성 질환의 치료에 대해 치료적으로 이로운 것으로 사료된다: 알츠하이머 병; 파킨슨 병; 루이 체 (Lewy bodies) 치매; 근위축성 측삭 경화증 (ALS); 폴리글루타민 병; 헌팅톤 병; 척수 및 연수 근 위축증 (SBMA); 및 척수소뇌성 실조증 (SCA1-3,7). 따라서, 본 발명에 기술된 화합물은 상기한 신경퇴행성 질환의 치료에 대해 잠재적인 치료적 용도를 갖는다 [참조: Muchowski, P.J., Wacker J. L., Nat. Rev. Neurosci. 2005, 6, 11-22.; Shen H. Y., et al. J. Biol. Chem. 2005, 280, 39962-9].

[0010] HSP-60의 억제는 독립적인 치료로서 그리고 표준 항-곰팡이 치료제, 예컨대 아졸 부류의 약물과 함께 사용한 경우 모두에서 항-곰팡이 활성을 지닌다. 따라서, 본 발명에 기술된 화합물은 생명 위협성 전신 곰팡이 감염 (참조: Cowen, L. E., Lindquist, S., Science 2005, 309, 2185-9)을 포함하나 이에 한정되지 않는 곰팡이 감염의 치료를 위한 잠재적인 치료적 용도를 갖는다.

[0011] HSP-90의 억제는 또한 항-말라리아 활성을 가지므로, 이 단백질의 억제제는 항말라리아 약물로서 유용하다.

[0012] 따라서, 당업계에서는 암, 염증 및 염증 관련 질환, 미세화된 혈관형성과 관련된 상태 또는 질환을 치료하기 위한 신규 방법이 계속적으로 요구되고 있다.

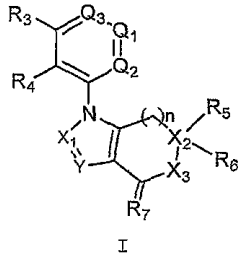
발명의 내용

해결하려는 과제

[0013] 발명의 개요

[0014] 광범위한 양태에서, 본 발명은 하기 표시된 화학식 (I)의 화합물, 이 화합물을 함유하는 약제 조성물, 및 세포 증식과 관련된 질환 및/또는 상태, 예컨대 암, 염증, 관절염, 혈관형성 등의 치료에서 상기 화합물 또는 조성물을 사용하는 방법을 포함한다.

[0015] 본 발명은 하기 화학식 (I)의 화합물, 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염을 제공한다:



[0016]

[0017]

[0018]

[0019]

[0020]

[0021]

[0022]

[0023]

[0024]

[0025]

[0026]

[0027]

[0028]

[0029]

[0030]

[0031]

[0032]

[0033]

상기 식에서,

R₃ 및 R₄는 독립적으로

(a) H,

(b) 할로, 또는

(c) C₁-C₁₅ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 6개 이하의 탄소 원자는 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에틸닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지는 않고, 여기서

R₂₂는

(i) 헤테로아릴,

(ii) 아릴,

(iii) 포화되거나 불포화된 C₃-C₁₀ 시클로알킬, 또는

(iv) 포화되거나 불포화된 C₂-C₁₀ 헤테로시클로알킬이며, 여기서

각각의 아릴, 헤테로아릴, 포화되거나 불포화된 시클로알킬, 또는 포화되거나 불포화된 헤테로시클로알킬은 독립적으로, 독립적으로 히드록시, 할로, 아미노, 시아노, 카르복시, 카르복사미도, 니트로, 옥소, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO-아릴, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, (C₁-C₆)알콕시, 또는 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노인 하나 이상의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;

각각의 R₂₂는 C₆-C₁₀ 아릴 기, C₅-C₈ 포화 시클릭 기, 또는 C₅-C₁₀ 헤테로시클로알킬 기로 융합되거나 융합되지 않고;

여기서 각각의 (c)는 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기서

Z는 OR₀ 또는 -N(R₃₀)₂이고, 여기서

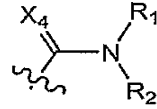
각각의 R₃₀은 독립적으로 -H 또는 C₁-C₆ 알킬이고, 또는 N(R₃₀)₂는 피롤리디닐, 피페리디닐, 피페라지닐, 아제파닐, 1,3- 또는 1, 4-디아제파닐, 또는 모르폴리닐이고, 이들의 각각은 히드록시, 아미노, 아미노알킬, C₁-C₆ 알킬, 모노- 또는 디(C₁-C₆)알킬아미노, C₁-C₆ 알콕시, 또는 할로젠으로 치환되거나 치환되지 않으며;

R₀은 -H, -C₁-C₁₀ 알킬, -C₂-C₁₀ 알케닐, -C₂-C₁₀ 알키닐, 아릴, 헤테로아릴, 또는 -C₁-C₆ 아실이고;

R₂₃은

- [0034] (1) 헤테로아릴,
- [0035] (2) 아릴,
- [0036] (3) 포화되거나 불포화된 C₅-C₁₀ 시클로알킬, 또는
- [0037] (4) 포화되거나 불포화된 C₅-C₁₀ 헤테로시클로알킬이며,
- [0038] R₂₃ 기는 독립적으로 히드록시, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO-아릴, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, (C₁-C₆)알콕시, 또는 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노인 하나 이상의 기로 치환되거나 치환되지 않거나;
- [0039] R₃ 및 R₄는 이들이 결합되는 원자와 함께, Q₁ 및 Q₂를 함유하는 고리에 융합된 5 내지 12원의 모노-, 비- 또는 트리시클릭 고리 시스템을 형성하며, 여기서 이 5 내지 12원의 고리는 부분적으로 포화되거나 방향족이며, 산소, S(O)_m (여기서, m은 0, 1, 또는 2이다), 질소, 또는 NR₃₃ (여기서, R₃₃은 수소 또는 C₁-C₆ 알킬이다) 중 하나 또는 두개를 함유하거나 함유하지 않으며;
- [0040] R₇은 O, S, NH, N-OH, N-NH₂, N-NHR₂₂, N-NH-(C₁-C₆ 알킬), N-O-(C₀-C₆)알킬-R₂₂, N-(C₁-C₆ 알케녹시), 또는 N-(카르복시로 치환되거나 치환되지 않은 C₁-C₆알콕시)이고;
- [0041] Y는 N 또는 CR_c이고, 여기서
- [0042] 각각의 R_c는 독립적으로 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, -C(O)R_{c'}, C₁-C₁₀ 알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬(C₁-C₁₀)알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0043] 각각의 알킬, 아릴, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 시아노, 니트로, 할로(C₁-C₆)알킬, 할로(C₁-C₆)알콕시, 카르복사미드, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며, 여기서
- [0044] 아릴 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 할로(C₁-C₆)알킬, 또는 카르복사미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0045] R_{c'}는 -C₁-C₆ 알킬, -OR_{c'}, 또는 -N(R_{CN})₂이며, 여기서
- [0046] R_{c'}는 -H, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이거나;
- [0047] 각각의 R_{CN}은 독립적으로 -H, -C₁-C₁₀ 알킬, -C₁-C₁₀ 할로알킬, -C₃-C₇ 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, -C₁-C₆ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이며, 여기서
- [0048] 각각의 알킬, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 니트로, 할로(C₁-C₆)알킬, 할로(C₁-C₆)알콕시, 또는 카르복사미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0049] X₁은 N 또는 CR_c이고;
- [0050] Q₁, Q₂ 및 Q₃는 독립적으로 N 또는 CR_Q이고, 여기서 Q₁, Q₂ 및 Q₃ 중 하나 및 단 하나는 C-R₂₁이고, 여기서
- [0051] 각각의 R_Q는 독립적으로 수소, 할로젠, -N(R_{CN})₂, C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴, 또는 R₂₁이며, 여기서
- [0052] 각각의 알킬, 시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시,

아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 할로(C₁-C₆)알킬, 할로(C₁-C₆)알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 기로 치환되거나 치환되지 않으며;



R₂₁은 시아노, -C(O)OH, -C(O)-O(C₁-C₆ 알킬), 또는 화학식  의 기이며, 여기서

R₁ 및 R₂는 독립적으로 H, 히드록시, C₁-C₆ 알킬, C₂-C₆ 알케닐, C₂-C₆ 알키닐, 헤테로아릴, 아릴, C₃-C₈ 시클로알킬, 헤테로시클로알킬이고, 여기서

각각의 알킬, 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 및 헤테로아릴 기는 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 니트로, 할로(C₁-C₆)알킬, 할로(C₁-C₆)알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 치환기로 치환되거나 치환되지 않거나;

R₁ 및 R₂는 이들 모두가 결합되는 질소와 함께, 독립적으로 O, N, S, 또는 N(R_{CH})인 하나 이상의 추가 헤테로원자를 함유하거나 함유하지 않는 헤테로시클로알킬을 형성하며;

X₄는 O, S, NH, NOH, N-NH₂, N-NH아릴, N-NH-(C₁-C₆ 알킬), 또는 N-(C₁-C₆ 알콕시)이며;

X₂ 및 X₃은 독립적으로 C, O, N, 또는 S(O)_p이며, 여기서

p는 0, 1, 또는 2이고;

n은 0, 1, 2, 3, 또는 4이며;

단 (i) X₂가 C인 경우에,

R₅ 및 R₆는 독립적으로 H, C₁-C₆ 알킬, 또는 아릴이고, 여기서 아릴은 독립적으로 C₁-C₆ 알킬, C₁-C₆ 알콕시, 할로젠, 히드록시, 아미노, 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노, 니트로, 할로(C₁-C₆)알킬, 할로(C₁-C₆)알콕시, 또는 카르복스아미드인 1 내지 4개의 치환기로 치환되거나 치환되지 않으며,

여기서 임의의 2개의 인접한 치환된 아릴 위치는, 이들이 결합되는 탄소 원자들과 함께 불포화 시클로알킬 또는 헤테로시클로알킬을 형성하거나;

R₅ 및 R₆는 이들이 결합되는 탄소와 함께 3 내지 8원의 고리를 형성하고;

(ii) X₂가 N인 경우에, R₆은 부재하고, R₅는 H 또는 C₁-C₆ 알킬이며;

(iii) X₃이 C인 경우에, 이것은 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬, 또는 모노- 또는 디-(C₁-C₆)알킬아미노(C₁-C₆)알킬인 2개의 기로 치환되고;

(iv) X₂가 O 또는 S(O)_p인 경우에, R₆ 및 R₅는 존재하지 않는다.

본 발명은 또한 본 발명의 화합물을 제조하는 데 유용한 중간체를 포함한다.

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

본 발명은 추가로, 치료가 필요한 환자에게 화학식 (I)의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용되는 염, 또는 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 포함하는 약제 조성물을 투여하는 것을 포함하여, 상기 환자에게 암, 염증, 관절염, 혈관형성 및 감염과 같은 질환을 치료하는 방법을 제공한다.

본 발명은 또한 암, 염증, 관절염, 혈관형성 또는 감염 치료용의 약물을 제조하기 위한 화학식 (I)에 따른 화합물 또는 염의 용도를 제공한다.

본 발명은 또한 본 발명의 화합물을 제조하는 방법, 및 이 방법에 사용된 중간체를 제공한다.

본 발명은 또한 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 환자에게 투여하는 것을 포함

하여, 세포 증식과 관련된 질환 또는 상태를 치료하는 방법을 제공한다.

- [0074] 본 발명은 또한 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 환자에게 투여하는 것을 포함하여, 세포 증식과 관련된 질환 또는 상태를 치료하는 방법으로서, 상기 상태의 질환이 암, 염증 또는 관절염인 치료 방법을 제공한다.
- [0075] 본 발명은 추가로, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 피검체에게 투여하는 것을 포함하여, HSP-90에 대한 클라이언트 단백질이거나 이의 클라이언트 단백질에 간접적으로 영향을 미치는 단백질의 질환 또는 질병을 앓는 피검체를 치료하는 방법을 제공한다.
- [0076] 본 발명은 추가로, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 피검체에게 투여하는 것을 포함하여, HSP-90에 대한 클라이언트 단백질이거나 이의 클라이언트 단백질에 간접적으로 영향을 미치는 단백질의 질환 또는 질병을 앓는 피검체를 치료하는 방법으로서, HSP-90 매개된 질환이 염증성 질환, 감염, 자가면역 질환, 뇌졸중, 허혈, 심장 질환, 신경계 질환, 섬유유전 질환, 증식 질환, 종양, 백혈병, 신생물, 암, 암종, 대사 질환 및 악성 질환으로 구성되는 군으로부터 선택되는 치료 방법을 제공한다.
- [0077] 본 발명은 추가로, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 치료가 필요한 피검체에게 투여하는 것을 포함하여, HSP-90에 대한 클라이언트 단백질이거나 이의 클라이언트 단백질에 간접적으로 영향을 미치는 단백질의 섬유 질환을 앓는 피검체를 치료하는 방법으로서, 섬유유전 질환이 피부경화증, 다발근육염, 전신 루푸스, 류마티스 관절염, 간 경화, 켈로이드 형성, 사이질 콩팥염 및 폐 섬유증으로 구성되는 군으로부터 선택되는 치료 방법을 제공한다.
- [0078] 본 발명은 플라스모디움 (*Plasmodium*) 종, 바람직하게는 플라스모듐 팔시파룸 (*Plasmodium falciparum*)으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염으로부터 피검체를 보호하는 방법을 제공한다. 이 방법은 화학식 (I)의 화합물 또는 염을, 바람직하게는 유효량으로, 이 유기체에 노출되어 감염의 위험이 있는 피검체에게 투여하는 것을 포함한다.
- [0079] 본 발명은 추가로 피검체에서 감염 수준을 감소시키는 방법으로서, 상기 감염이 플라스모디움 종, 바람직하게는 플라스모듐 팔시파룸으로부터 선택된 유기체에 의해 야기되는 방법을 제공한다. 이 방법은 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 감염된 피검체에게 투여하는 것을 포함한다.
- [0080] 본 발명은 추가로 후생동물 기생충에 감염된 환자를 치료하는 방법을 제공한다. 이 방법은 상기 기생충을 치사시키는 데 효과적인 양의 본 발명의 화합물을 투여하는 것을 포함한다.
- [0081] 본 발명은 추가로 후생동물 기생충으로 감염된 환자를 치료하는 방법으로서, 상기 기생충이 플라스모디움 팔시파룸인 방법을 제공한다. 이 방법은 상기 기생충을 치사시키는 데 효과적인 양의 본 발명의 화합물 또는 염을 투여하는 것을 포함한다.
- [0082] 본 발명은 추가로, 화학식 (I)의 화합물 또는 이를 함유하는 조성물을 이 화합물 또는 조성물의 사용에 대한 지시서가 내장된 키트로 제공한다.
- [0083] 본 발명은 추가로, 치료의 전반적인 유효성을 증가시키기 위해 질환을 치료하는 데 효과적인 것으로 알려진 치료법 또는 다른 약물과 함께 또는 단독으로 투여될 수 있는 화합물을 제공한다.
- [0084] 본 발명은 추가로, 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염, 및 임의로 항-곰팡이 제제 또는 약물을 투여하는 것을 포함하여, 치료가 필요한 환자에서 곰팡이 감염을 치료하는 방법을 제공한다.

과제의 해결 수단

- [0085] 화학식 (I)에서, R_3 및 R_4 는 상기 주지된 바와 같이 독립적으로 (a) 수소, (b) 할로, 또는 (c) 탄소수 1 내지 15개의 알킬 기이다. 상기 알킬 기 중의 탄소 원자 모두, 그러나 이들의 약 6개 이하는 독립적으로 화학식 (I)과 관련하여 상기 기재된 다양한 기로 대체될 수 있다.
- [0086] 따라서, 알킬 기가 메틸, 즉, 탄소 원자 1개의 알킬 기인 경우에, 상기 탄소 원자가 예를 들어 질소 또는 황으로 대체되면, 생성되는 기는 알킬 기가 아니라 그 대신 각각 아미노 또는 티오 기가 될 것이다. 마찬가지로, 대체되는 탄소 원자가 알킬 기를 종결시키는 경우, 종결 기는 페리미디닐, 아미노, 페닐 또는 히드록시와 같은 다른 부분이 될 것이다.
- [0087] 탄소 원자의, 예를 들어 산소, 질소 또는 황 기로의 대체는, 대체되는 원자 가를 충족하는 데 필요한 수소 또는

다른 원자 수의 적절한 조정을 필요로 할 것이다. 따라서, 대체가 N 또는 0에 의해 이루어지는 경우, 대체되는 원자에 결합되는 기의 수는 각각 질소 또는 산소의 원자수를 충족시키도록 하나 또는 두개까지 감소될 것이다. 유사한 고찰이, 에테닐 및 에티닐로의 대체에 대해서도 당업자에게는 용이하게 자명할 것이다.

[0088] 따라서, 본원에서 허용된 대체는, 하기한 것들을 포함하나 이들에 한정되지 않는 것들을 포함하는, 화학식 (I) 과 관련하여 정의된 용어 "C₁-C₁₅ 알킬"을 초래한다:

[0089] 아미노, 히드록시, 페닐, 벤질, 프로필아미노에톡시, 부톡시에틸아미노, 피리드-2-일프로필, 디에틸아미노메틸, 펜틸설폰닐, 메틸설폰아미도에틸, 3-[4-(부틸피리미딘-2-일)에틸]페닐, 부톡시, 디메틸아미노, 4-(2-(벤질아미노)-에틸)피리딜, 부트-2-엔일아미노, 4-(1-(메틸아미노)펜트-3-엔-2-일티오)페닐, 2-(N-메틸-헥산아미도)에톡시메틸, 및 4-(((3-메톡시-4-(4-메틸-1H-이미다졸-2-일)부트-1-엔일)(메틸)아미노)-메틸)페닐.

[0090] 화학식 (I)의 화합물의 바람직한 화합물에는,

[0091] R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이며, 여기서 Z₁이 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이고; R₂₁은 C₁-C₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0092] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0093] 화학식 (I)의 더욱 바람직한 화합물에는,

[0094] R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이며, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이고; R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0095] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0096] 화학식 (I)의 화합물의 추가의 바람직한 화합물에는,

[0097] R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R₂₁이며, 여기서 R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0098] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0099] 화학식 (I)의 화합물의 가장 바람직한 화합물에는,

- [0100] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{21}$ 이며, 여기서 R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0101] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, C_1-C_6 알콕시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.
- [0102] 화학식 (I)의 화합물의 추가의 바람직한 화합물에는,
- [0103] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-OR_{21}$ 이며, 여기서 R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0104] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아틸, $-SO_2$ -아틸, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아틸, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.
- [0105] 화학식 (I)의 화합물의 가장 바람직한 화합물에는,
- [0106] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-OR_{21}$ 이며, 여기서 R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0107] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, C_1-C_6 알콕시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.
- [0108] 화학식 (I)의 바람직한 화합물에는, X_1 이 C_1-C_6 알킬, 보다 바람직하게는 C_1-C_3 알킬로 치환되거나 치환되지 않은 탄소인 화합물이 포함된다. 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, X_1 이 C_1-C_6 알킬로 치환되거나 치환되지 않은 탄소이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 $-H$, C_1-C_6 알킬, C_1-C_3 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 또는 C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_6)알킬인 화합물이다. 보다 바람직하게는, 화학식 (I)의 화합물에서, X_1 은 C_1-C_2 알킬로 치환되거나 치환되지 않은 탄소이고, Y가 CR_c 이고, 여기서 R_c 는 $-H$, C_1-C_4 알킬, C_1-C_3 할로알킬, 시클로프로필, 또는 시클로프로필(C_1-C_2)알킬인 화합물이다.
- [0109] 화학식 (I)의 더욱 더 바람직한 화합물은, X_1 이 CH인 화합물이다. 화학식 (I)의 화합물의 다른 더욱 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 $-H$, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬, C_3-C_5 시클로알킬, 또는 C_3-C_5 시클로알킬(C_1-C_2)알킬인 화합물이다. 화학식 (I)의 화합물의 더욱 더 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 $-H$, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 시클로프로필 또는 시클로프로필메틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 메틸, 에틸, 또는 시클로프로필인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 메틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 에틸인 화합물

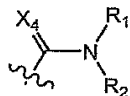
이다. 화학식 (I)의 화합물의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 시클로프로필인 화합물이다.

[0110] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, X_1 이 CH이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 -H, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬, 또는 C_3-C_7 시클로알킬이며, R_3 이 아미노 또는 알킬이 치환되거나 치환되지 않은 아릴, 치환되거나 치환되지 않은 헤테로시클로알킬, 또는 치환되거나 치환되지 않은 시클로알킬 기로 치환된 C_1-C_3 알킬아미노 또는 아미노인 화합물이다. 이들 시클릭 기에 대한 바람직한 치환기는 히드록시, C_1-C_3 알콕시, 옥소, 할로, C_1-C_3 알킬, 아미노, 모노- 또는 디- C_1-C_3 알킬아미노, 및 니트로이다. 보다 바람직하게, 이들 시클릭 기에 대한 임의적인 치환기는 히드록시, C_1-C_3 알콕시 및 옥소이다. 이들 시클릭 기는 상기 치환기 중 1 내지 4개, 바람직하게는 1 내지 3개로 치환되거나 치환되지 않는다.

[0111] 화학식 (I)의 더욱 더 바람직한 화합물은 X_1 이 N인 화합물이다. 화학식 (I)의 화합물의 다른 더욱 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 -H, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬, C_3-C_5 시클로알킬, 또는 C_3-C_5 시클로알킬(C_1-C_2)알킬인 화합물이다. 화학식 (I)의 더욱더 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 -H, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 또는 시클로프로필메틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 메틸, 에틸, 또는 시클로프로필인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 트리플루오로메틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 메틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 에틸인 화합물이다. 화학식 (I)의 다른 특히 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고 Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 시클로프로필인 화합물이다.

[0112] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, X_1 이 N이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 -H, C_1-C_3 알킬, C_1-C_3 할로알킬, 또는 C_3-C_7 시클로알킬이며, R_3 이, 아미노 또는 알킬이 치환되거나 치환되지 않은 아릴, 치환되거나 치환되지 않은 헤테로시클로알킬, 또는 치환되거나 치환되지 않은 시클로알킬 기로 치환된 C_1-C_3 알킬아미노 또는 아미노인 화합물이다. 이들 시클릭 기에 대한 바람직한 치환기는 히드록시, C_1-C_3 알콕시, 옥소, 할로, C_1-C_3 알킬, 아미노, 모노- 또는 디- C_1-C_3 알킬아미노, 및 니트로이다. 보다 바람직하게, 이들 시클릭 기에 대한 임의적인 치환기는 히드록시, C_1-C_3 알콕시, 및 옥소이다. 이들 시클릭 기는 상기 치환기 중 1 내지 4개, 바람직하게는 1 내지 3개로 치환되거나 치환되지 않는다.

[0113] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은 Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서,



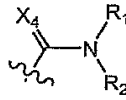
[0114] R_{21} 은 화학식

[0115] R_7 은 0이며;

[0116] Y는 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 수소, C_1-C_3 알킬, C_3-C_5 시클로알킬, 트리플루오로메틸, 또는 C_3-C_5 시클로알킬(C_1-C_2)알킬인 화합물이다. 그러한 화합물은 본원에서 화학식 (II)의 화합물이다.

[0117] 화학식 (II)의 다른 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 이 상기 주지된 바와 같이, 독립적으로 (a) 수소, (b) 할로, 또는 (c) 탄소수 1 내지 15개의 알킬 기인 것들이다. 상기 알킬 기 중의 탄소 원자의 모두 그러나 이들의 약 6개 이하는 독립적으로 화학식 (I)과 관련하여 상기 기재된 다양한 치환기로 치환될 수 있다.

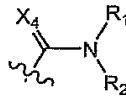
[0118] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, Q_3 이 CR_{21} 이고, 여기서



[0119] R₂₁은 화학식 (I)의 기이고;

[0120] X₃은 R_{9a} 및 R_{9b}로 치환된 C이고, 여기서 R_{9a} 및 R_{9b}는 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬인 화합물이다. 그러한 화합물은 하기된 화학식 (III)의 화합물이다.

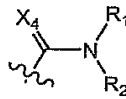
[0121] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, Q₃이 CR₂₁이고, 여기서



[0122] R₂₁은 화학식 (I)의 기이고;

[0123] Q₁ 및 Q₂는 독립적으로, 각각 R_{10a} 및 R_{10b}로 치환된 C이고, 여기서 R_{10a} 및 R_{10b}는 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬인 화합물이다. 그러한 화합물은 하기된 화학식 (IV)의 화합물이다.

[0124] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, Q₃이 CR₂₁이며, 여기서



[0125] R₂₁은 화학식 (I)의 기이고;

[0126] X₁은 R₁₁로 치환된 C이고, 여기서 R₁₁은 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, -C(O)R_{C'}, C₁-C₁₀ 알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, C₃-C₇시클로알킬(C₁-C₁₀)알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서

[0127] R_{C'}는 -C₁-C₆ 알킬, -OR_{C'}, 또는 -N(R_{CN})₂이며, 여기서

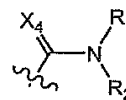
[0128] R_{C'}는 -H, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;

[0129] 각각의 R_{CN}은 독립적으로 -H, -C₁-C₁₀ 알킬, -C₁-C₁₀-할로알킬, -C₃-C₇ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, -C₁-C₆ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴인 화합물이다. 그러한 화합물은 이하에서 화학식 (V)의 화합물이다.

[0130] 화학식 (V)의 바람직한 화합물은, R₁₁이 수소, 할로젠, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, C₃-C₇시클로알킬(C₁-C₁₀)알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴인 화합물이다.

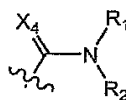
[0131] 화학식 (V)의 더욱 바람직한 화합물은 R₁₁이 H 또는 C₁-C₆ 알킬인 화합물이다.

[0132] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은 Q₃이 CR₂₁이며, 여기서



[0133] R₂₁이 화학식 (I)의 기이고, X₁이 N인 화합물이다. 그러한 화합물은 이하에서 화학식 (Va)의 화합물이다.

[0134] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은 Q₃이 CR₂₁이며, 여기서



[0135] R₂₁이 화학식 (I)의 기이고,

[0136] X₂가 R₅ 및 R₆으로 치환된 C이고, 여기서 R₅ 및 R₆은 독립적으로 H 또는 C₁-C₄ 알킬인 화합물이다. 그러한 화합

물은 이하에서 화학식 (VI)의 화합물이다.

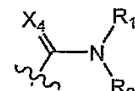
[0137] 화학식 (I) 내지 (VI) 중 임의의 것의 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서 Z_1 이 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이고; 및 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0138] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0139] 본 발명의 더욱 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이며, 여기서 R_{Z1} 이 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0140] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화학식 (I-VI)의 화합물이 포함된다.

[0141] 본 발명의 더욱 바람직한 화합물은, R_4 가 H, C_1-C_4 알킬 또는 할로젠인 화학식 (I-VI)의 화합물이다. 화학식 (II-VI)의 바람직한 화합물에는, X_1 이 C_1-C_3 알킬 (바람직하게는 메틸)로 치환되거나 치환되지 않은 탄소이고, Y가 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 C_1-C_2 알킬, 트리플루오로메틸, 시클로프로필, 또는 시클로프로필(C_1-C_2)알킬인 화합물이 포함된다. 더욱 바람직하게는 화학식 (II-VI)의 화합물에서, X_1 은 CH이고 Y는 CR_c 이며, 여기서 R_c 는 C_1-C_2 알킬 (바람직하게는 메틸)이다.



[0142] 본 발명의 더욱 바람직한 화합물은 Q_3 이 CR_{21} 이며, 여기서 R_{21} 이 화학식

[0143] X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

[0144] X_1 은 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C이고;

[0145] Q_1 및 Q_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C이고;

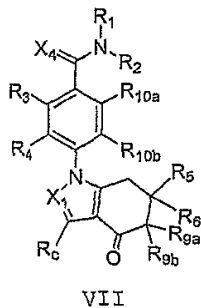
[0146] R_7 이 O이고;

[0147] Y가 CR_c 이고, 여기서

[0148] R_c 는 $-H$, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필이고;

[0149] R_3 및 R_4 는 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

- [0150] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C_1-C_{10})알킬아미노, -OC_{1-C₁₀} 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0151] n 이 1 또는 2인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0152] 본 발명의 더욱 바람직한 화합물은,
- [0153] R_1 및 R_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;
- [0154] Q_1 및 Q_2 가 모두 CH이고;
- [0155] X_2 가 2개의 독립적으로 선택된 C_1-C_4 알킬 기로 치환된 C이고;
- [0156] n 이 1인 화학식 (I)의 화합물이다.
- [0157] 본 발명의 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (VII)의 화합물이 포함된다:



- [0158]
- [0159] 상기 식에서, X_1 및 R_c 는 화학식 (I)에서 정의된 바와 같고;
- [0160] R_5 및 R_6 은 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;
- [0161] R_{11} 은 H 또는 C_1-C_6 알킬이고;
- [0162] R_{10a} 및 R_{10b} 는 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬이고;
- [0163] R_{9a} 및 R_{9b} 는 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬이고;
- [0164] R_3 및 R_4 는 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z R_{Z1} 이고, 여기서 Z_1 은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0165] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C_1-C_6)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C_1-C_6)알킬, -SO₂-아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C_1-C_{10})알킬아미노, -OC_{1-C₁₀} 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0166] n 은 1 또는 2이다.
- [0167] 화학식 (VII)의 바람직한 화합물에는,
- [0168] R_1 및 R_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬이고;

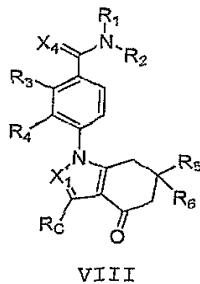
[0169] R_{10a} 및 R_{10b} 가 모두 CH이고;

[0170] R_5 및 R_6 이 독립적으로 C_1 - C_4 알킬인 화합물이 포함된다.

[0171] 화학식 (VII)의 다른 바람직한 화합물에는 X_1 이 N인 화합물이 포함된다.

[0172] 화학식 (VII)의 다른 바람직한 화합물에는, X_1 이 CR_c 이고, 여기서 R_c 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다. 이러한 양태의 바람직한 하나의 구체예에서, X_1 로부터 유도된 R_c 기는 수소, 메틸, 또는 트리플루오로메틸이고, Y로부터 유도된 R_c 기는 화학식 (I)과 관련하여 주어진 정의를 포함한다.

[0173] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (VIII)의 화합물이 포함된다:



[0174] 상기 식에서,
 [0175]
 [0176] R_c 는 H, C_1 - C_6 알킬, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필이고;

[0177] R_1 - R_6 , X_1 , 및 X_4 는 화학식 (I)에 대해서와 동일한 정의를 포함한다.

[0178] 화학식 (VIII)의 바람직한 화합물에는 X_1 이 N인 화합물이 포함된다.

[0179] 화학식 (VIII)의 바람직한 화합물에는 X_1 이 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다. 이러한 양태의 바람직한 일 구체예에서, X_1 로부터 유도된 R_c 기는 수소, 메틸, 또는 트리플루오로메틸이고, Y로부터 유도된 R_c 기는 화학식 (I)과 관련하여 주어진 정의를 포함한다.

[0180] 화학식 (VIII)의 바람직한 화합물에는,

[0181] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{21}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{21} 은 C_1 - C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0182] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1 - C_{10} 알킬, C_1 - C_{10} 할로알킬, C_2 - C_{10} 알케닐, C_2 - C_{10} 알키닐, 히드록시, 카복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, C_1 - C_6 알콕시, 모노- 또는 디- $(C_1$ - $C_{10})$ 알킬아미노, $-OC_1$ - C_{10} 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0183] 화학식 (VIII)의 바람직한 화합물에는,

[0184] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{21}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{21} 은 C_1 - C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

- [0185] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH-아릴$, $-SO_2-아릴$, $-SO-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-아릴$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(C_1-C_{10})알킬아미노$, $-OC_1-C_{10}알킬-Z$, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0186] X_4 가 0인 화합물이 포함된다.
- [0187] 화학식 (VIII)의 바람직한 화합물에는,
- [0188] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0189] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH-아릴$, $-SO_2-아릴$, $-SO-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-아릴$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(C_1-C_{10})알킬아미노$, $-OC_1-C_{10}알킬-Z$, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0190] X_4 가 N-OH인 화합물이 포함된다.
- [0191] 화학식 (VIII)의 다른 바람직한 화합물에는,
- [0192] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0193] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH-아릴$, $-SO_2-아릴$, $-SO-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-아릴$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(C_1-C_{10})알킬아미노$, $-OC_1-C_{10}알킬-Z$, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.
- [0194] 화학식 (VIII)의 다른 바람직한 화합물에는,
- [0195] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0196] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2NH-아릴$, $-SO_2-아릴$, $-SO-(C_1-C_6)알킬$, $-SO_2-아릴$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(C_1-C_{10})알킬아미노$, $-OC_1-C_{10}알킬-Z$, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않고;
- [0197] X_4 가 0인 화합물이 포함된다.
- [0198] 화학식 (VIII)의 다른 바람직한 화합물에는,

- [0199] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0200] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0201] X_4 가 N-OH인 화합물이 포함된다.
- [0202] 화학식 (VIII)의 더욱 바람직한 다른 화합물은,
- [0203] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0204] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.
- [0205] 화학식 (VIII)의 더욱 다른 바람직한 다른 화합물은,
- [0206] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0207] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0208] X_4 가 O인 화합물이다.
- [0209] 화학식 (VIII)의 더욱 다른 바람직한 다른 화합물은,
- [0210] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0211] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;

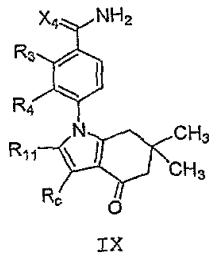
[0212] X_4 가 N-OH인 화합물이다.

[0213] 화학식 (VIII)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물이다.

[0214] 화학식 (VIII)의 다른 바람직한 화합물은, R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하며; X_4 가 O인 화합물이다.

[0215] 화학식 (VIII)의 다른 바람직한 화합물은, R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하며; X_4 가 N-OH인 화합물이다.

[0216] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은 하기 화학식 (IX)의 화합물이다:



[0217] IX

[0218] 상기 식에서,

[0219] R_{11} 은 수소 또는 메틸, 바람직하게는 수소이고;

[0220] R_c 는 H, C_1 - C_2 알킬, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필이고;

[0221] R_3 , R_4 및 X_4 는 화학식 (I)에 대해서와 동일한 정의를 포함한다. 화학식 (IX)의 바람직한 화합물에는, R_c 가 C_1 - C_2 알킬, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필인 화합물이 포함된다.

[0222] 화학식 (IX)의 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1 - C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0223] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1 - C_{10} 알킬, C_1 - C_{10} 할로알킬, C_2 - C_{10} 알케닐, C_2 - C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1 - C_6 알콕시, C_2 - C_{10} 알케닐옥시, C_2 - C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화합물이 포함된다.

[0224] 화학식 (IX)의 바람직한 화합물에는, R_c 가 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필이고; R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1 - C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0225] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1 - C_{10} 알킬, C_1 - C_{10} 할로알킬, C_2 - C_{10} 알케닐, C_2 - C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1 - C_6 알콕시, C_2 - C_{10} 알케닐옥시, C_2 -

C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0226] X₄가 0인 화합물이 포함된다.

[0227] 화학식 (IX)의 바람직한 화합물에는, R_c가 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸 또는 시클로프로필이고; R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 0 원자, 2개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0228] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0229] X₄가 N-OH인 화합물이 포함된다.

[0230] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 0 원자, 2개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0231] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0232] 화학식 (IX)의 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 0 원자, 2개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0233] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않고;

[0234] X₄가 0인 화합물이 포함된다.

[0235] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 0 원자, 2개의 S 원자, 또는 0 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0236] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂,

-SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0237] X₄가 N-OH인 화합물이 포함된다.

[0238] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 다른 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R_{Z1}이고, 여기서 R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0239] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0240] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 다른 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R_{Z1}이고, 여기서 R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0241] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0242] X₄가 O인 화합물이 포함된다.

[0243] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R_{Z1}이고, 여기서 R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0244] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0245] X₄가 N-OH인 화합물이 포함된다.

[0246] 화학식 (IX)의 다른 바람직한 화합물에는, R₃, R₄ 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물이 포함된다.

[0247] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₃, R₄ 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하며; X₄가 O인 화합물이 포함된다.

[0248] 화학식 (IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₃, R₄ 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하며; X₄가 N-OH인 화합물이 포함된다.

[0249] 화학식 (I-IX)의 바람직한 화합물에는 X₄가 O인 화합물이 포함된다.

- [0250] 화학식 (I-IX)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는 X_4 가 N-OH인 화합물이 포함된다.
- [0251] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, R_{21} 이 시아노이고, R_7 이 O이며, Y가 CR_C 이고, 여기서 R_C 가 H, 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필인 화합물이다.
- [0252] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물은, R_{21} 이 시아노이고; R_7 이 O이며; Y가 CR_C 이고, 여기서 R_C 가 H, 메틸, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필인 화합물이다.
- [0253] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R_{21} 이 시아노이고, X_3 이 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물이 포함된다.
- [0254] 화학식 (I)의 더욱 바람직한 화합물은, R_{21} 이 시아노이고, Q_1 및 Q_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C인 화합물이다.
- [0255] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_{21} 이 시아노이고, X_1 이 H 또는 C_1-C_6 알킬로 치환된 C인 화합물이다.
- [0256] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_{21} 이 시아노이고, X_2 가 독립적으로 H 또는 C_1-C_4 알킬인 2개의 기로 치환된 C인 화합물이다.
- [0257] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물에서, R_{21} 은 시아노이고, R_3 및 R_4 는 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0258] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는다.
- [0259] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물에서, R_{21} 은 시아노이고, R_3 및 R_4 는 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0260] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는다.
- [0261] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물에서, R_{21} 은 시아노이고, R_3 및 R_4 는 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0262] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-

C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않는다.

[0263] 화학식 (I)의 다른 더욱 바람직한 화합물은, R₂₁이 시아노이고, R₄가 H, C₁-C₄ 알킬 또는 할로젠인 화합물들이다.

[0264] 화학식 (I)의 특히 바람직한 화합물에는,

[0265] R₂₁이 시아노이고;

[0266] X₂가 독립적으로 H 또는 C₁-C₄ 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

[0267] X₁은 H 또는 C₁-C₆ 알킬로 치환된 C이고;

[0268] Q₁ 및 Q₂는 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬로 치환된 C이고;

[0269] X₃은 독립적으로 H 또는 C₁-C₆ 알킬인 2개의 기로 치환된 C이고;

[0270] R₇은 0이며;

[0271] Y는 CR_c이고, 여기서 R_c가 H 또는 CH₃이며;

[0272] R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0273] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

[0274] n이 1 또는 2인 화합물이 포함된다.

[0275] 그러한 화합물은 본원에서 화학식 (X)의 화합물로 지칭된다.

[0276] 화학식 (X)의 바람직한 화합물에는,

[0277] R₁ 및 R₂가 독립적으로 H 또는 C₁-C₄ 알킬이고;

[0278] Q₁ 및 Q₂가 모두 CH이며;

[0279] X₂가 2개의 독립적으로 선택된 C₁-C₄ 알킬 기로 치환된 C이고;

[0280] n이 1인 화합물이 포함된다.

[0281] 화학식 (I)의 특히 바람직한 화합물에는 R₂₁이 시아노인 화합물이 포함된다. 그러한 화합물은 이하에서 화학식 (XI)의 화합물로 지칭된다.

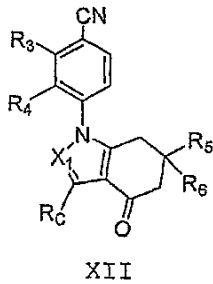
[0282] 화학식 (XI)의 바람직한 화합물은, R₃ 및 R₄가 독립적으로 할로젠 또는 수소인 화합물이다.

[0283] 화학식 (XI)의 바람직한 화합물은 R₃이 할로젠인 화합물이다.

[0284] 화학식 (XI)의 바람직한 화합물은 R₃이 수소이고 R₄가 할로젠인 화합물이다.

[0285] 화학식 (XI)의 바람직한 화합물은 R₄가 할로젠인 화합물이다.

[0286] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (XII)의 화합물이 포함된다:



[0287]

[0288] 상기 식에서, R₃ 및 R₄는 독립적으로 할로젠 또는 수소이며, 단 R₃ 및 R₄ 중 하나 이상은 할로젠이며, X₁, R_c, R₅ 및 R₆은 화학식 (I)에서 정의된 바와 같다.

[0289] 화학식 (XII)의 바람직한 화합물에는 X₁이 N인 화합물이 포함된다.

[0290] 화학식 (XII)의 화합물에는, X₁이 CR_c이고, 여기서 R_c는 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다.

[0291] 화학식 (XII)의 바람직한 화합물은 R₃이 할로젠인 화합물이다.

[0292] 화학식 (XII)의 다른 바람직한 화합물은, R₄가 할로젠인 화합물이다.

[0293] 화학식 (XII)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₃이 플루오로이고 R₄가 수소 또는 플루오로인 화합물이다.

[0294] 화학식 (XII)의 특히 바람직한 화합물은, R₄가 플루오로이고 R₃이 수소, 브로모, 또는 플루오로인 화합물이다.

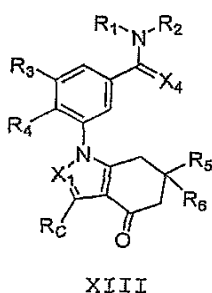
[0295] 화학식 (XII)의 다른 특히 바람직한 화합물은 R₄가 수소인 화합물이다.

[0296] 화학식 (XII)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R₃이 수소인 화합물이다.

[0297] 화학식 (XII)의 특히 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 플루오로인 화합물이 포함된다.

[0298] 화학식 (XII)의 바람직한 화합물은, R₃ 및 R₄가 각각 브로모, 플루오로인 화합물이다.

[0299] 화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (XIII)의 화합물이 포함된다:



[0300]

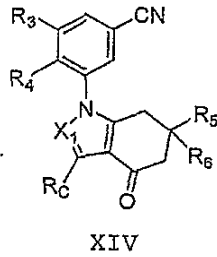
[0301] 상기 식에서, R₁-R₆, X₄, X₁, 및 R_c는 화학식 (I)에서 정의된 바와 같다.

[0302] 화학식 (XIII)의 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로

인접하지 않으며,

- [0303] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.
- [0304] 화학식 (XIII)의 다른 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0305] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.
- [0306] 화학식 (XIII)의 다른 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서 R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0307] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.
- [0308] 화학식 (XIII)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물이다.
- [0309] 더욱 바람직한 양태에서, 화학식 (XIII)의 이전에 기술된 바람직한 구체예에는, X_1 이 N 또는 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다.
- [0310] 더욱 바람직한 양태에서, 화학식 (XIII)의 이전에 기술된 바람직한 구체예에는 X_1 이 N인 화합물이 포함된다.
- [0311] 더욱 바람직한 양태에서, 화학식 (XIII)의 이전에 기술된 바람직한 구체예에는, X_1 이 CR_c 이며, 여기서 R_c 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다.

[0312] 화학식 (I)의 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (XIV)의 화합물이 포함된다:



[0313] 상기 식에서, R_c는 -H, -CH₃, -CF₃, 또는 시클로프로필이고;

[0314]

[0315] R₃ 및 R₄는 독립적으로 할로겐 또는 수소이며, 단 R₃ 및 R₄ 중 하나 이상은 할로겐이고, R₅ 및 R₆은 화학식 (I)에서 정의된 바와 같다.

[0316] 화학식 (II) 내지 (XIV)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₂₁이 시아노이고; R₇이 O이며; Y가 CH 또는 C(CH₃)인 화합물이다.

[0317] 화학식 (II) 내지 (XIV)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₂₁이 시아노이고; R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이고, 여기서 Z₁은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0318] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.

[0319] 화학식 (II) 내지 (XIV)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₂₁이 시아노이고; R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0320] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알키닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0321] 화학식 (II) 내지 (XIV)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는, R₂₁이 시아노이고; R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R₂₁이고, 여기서 R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0322] R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂,

-SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.

다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CR_c이고, 여기서 R_c가 -H, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, 또는 C₃-C₇ 시클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CH인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

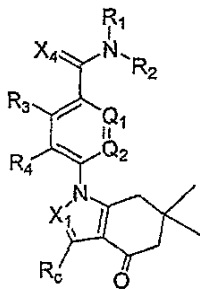
다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CR_c이고, 여기서 R_c가 C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, 또는 C₃-C₇ 시클로알킬인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CR_c이고, 여기서 R_c가 메틸, 에틸, 트리플루오로메틸, 또는 시클로프로필인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CR_c이고, 여기서 R_c가 메틸인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

다른 양태에서, 본 발명은 Y가 CR_c이고, 여기서 R_c가 시클로프로필인 화학식 (I)의 화합물을 포함한다.

화학식 (I)의 더욱 다른 바람직한 화합물에는 하기 화학식 (XV)의 화합물이 포함된다:



XV

상기 식에서, X_1 - X_4 , Q_1 , Q_2 , R_c , 및 R_1 - R_4 는 화학식 (I)에서 정의된 바와 같다.

화학식 (XV)의 바람직한 화합물은 Q₁ 및 Q₂가 각각 독립적으로 수소 또는 C₁-C₆ 알킬인 화합물이다.

화합식 (XV)의 다른 바람직한 화합물은, R_c가 C₁-C₆ 알킬, C₃-C₇ 시클로알킬, C₁-C₆ 할로알킬, C₃-C₇시클로알킬 (C₁-C₆)알킬, 또는 헤테로시클로알킬인 화합물이다.

화합식 (XV)의 더욱 바람직한 화합물에는, R_c가 C₃-C₇ 시클로알킬, C₁-C₆ 할로알킬, 헤테로시클로알킬, 또는 C₃-C₇ 시클로알킬(C₁-C₆)알킬인 화합물이 포함된다.

화합식 (XV)의 특히 바람직한 화합물에는 R_c 가 C_1 - C_3 알킬, C_3 - C_5 시클로알킬, C_3 - C_5 시클로알킬(C_1 - C_3)알킬, 또는 C_1 - C_2 할로알킬인 화합물이 포함된다.

화학식 (XV)의 추가의 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O-, -NH-, -S(O)_p-, 또는 -S(O)₂NH-이고, 여기서 p는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며.

R₂₁은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂,

$-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0338] 화학식 (XV)의 다른 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-\text{Z}_1\text{R}_{21}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-\text{O}-$ 또는 $-\text{NH}-$ 이며; R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0339] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-\text{SH}$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0340] 화학식 (XV)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-\text{N}(\text{H})\text{R}_{21}$ 이고, 여기서 R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0341] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-\text{SH}$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.

[0342] 화학식 (XV)의 더욱 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, $-\text{N}(\text{H})-\text{R}_{22}-\text{R}_{22}$ 이고, 여기서

[0343] R_{22} 은 C_1-C_{13} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0344] R_{22} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-\text{SH}$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다. 그러한 화합물은 본원에서 화학식 (XVa)의 화합물로 지칭된다.

[0345] 화학식 (XVa)의 바람직한 화합물은 X_1 이 N인 화합물이다.

[0346] 화학식 (XVa)의 바람직한 화합물은 R_{22} 가 헤테로아릴, 아릴, 포화된 C_3-C_{10} 시클로알킬, 또는 포화된 C_2-C_{10} 헤테로시클로알킬인 화합물이다.

[0347] 화학식 (XVa)의 더욱 바람직한 화합물은, R_{22} 가 헤테로아릴, 아릴, 포화된 C_3-C_{10} 시클로알킬, 또는 포화된 C_2-C_{10} 헤테로시클로알킬이며; X_1 이 N인 화합물이다.

[0348] 화학식 (XVa)의 특히 바람직한 화합물은 R_{22} 가 포화된 C_3-C_{10} 시클로알킬, 또는 포화된 C_2-C_6 헤테로시클로알킬인 화합물이다.

[0349] 화학식 (XVa)의 특히 바람직한 화합물은, R_{22} 가 포화된 C_3-C_7 시클로알킬, 또는 포화된 C_2-C_6 헤테로시클로알킬인

며; X_1 이 N인 화합물이다.

[0350] 화학식 (XV)의 바람직한 화합물은 X_1 이 N인 화합물이다. 그러한 화합물은 본원에서 화학식 (XVI)의 화합물로 지칭된다.

[0351] 화학식 (XVI)의 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0352] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0353] 화학식 (XVI)의 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0354] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않고; X_4 가 0인 화합물이 포함된다.

[0355] 화학식 (XVI)의 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$, $-NH-$, $-S(O)_p-$, 또는 $-S(O)_2NH-$ 이고, 여기서 p 는 0, 1 또는 2이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0356] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않고; X_4 가 N-OH인 화합물이 포함된다.

[0357] 화학식 (XVI)의 다른 바람직한 화합물에는, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서 Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며; R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0358] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$,

-SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이 포함된다.

[0359] 화학식 (XVI)의 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0360] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알킬닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며; X₄가 0인 화합물이 포함된다.

[0361] 화학식 (XVI)의 다른 바람직한 화합물에는, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R_{Z1}이고, 여기서 Z₁은 -O- 또는 -NH-이며; R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0362] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알킬닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며; X₄가 N-OH인 화합물이 포함된다.

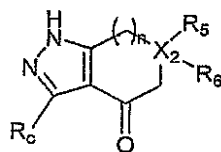
[0363] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R_{Z1}이고, 여기서 R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0364] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알킬닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않은 화합물이다.

[0365] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -N(H)R_{Z1}이고, 여기서 R_{Z1}은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

[0366] R_{Z1}은 임의의 이용가능한 위치에서, C₁-C₁₀ 알킬, C₁-C₁₀ 할로알킬, C₂-C₁₀ 알케닐, C₂-C₁₀ 알킬닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, -S-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH₂, -SO₂NH-(C₁-C₆)알킬, -SO₂NH-아릴, -SO₂-아릴, -SO-(C₁-C₆)알킬, -SO₂-아릴, C₁-C₆ 알콕시, C₂-C₁₀ 알케닐옥시, C₂-C₁₀ 알킬닐옥시, 모노- 또는 디-(C₁-C₁₀)알킬아미노, -OC₁-C₁₀ 알킬-Z, 또는 R₂₃으로 치환되거나 치환되지 않으며;

- [0367] X_4 가 0인 화합물이다.
- [0368] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은, R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-N(H)R_{21}$ 이고, 여기서 R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0369] R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0370] X_4 가 N-OH인 화합물이다.
- [0371] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하는 화합물이다.
- [0372] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하고; X_4 가 0인 화합물이다.
- [0373] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 , R_4 및 이들이 결합되는 탄소가 6원 고리를 형성하고; X_4 가 N-OH인 화합물이다.
- [0374] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 및 R_4 가 모두 -H인 화합물이다.
- [0375] 화학식 (XVI)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 및 R_4 가 모두 -H이고; X_4 가 0인 화합물이다.
- [0376] 화학식 (XVIII)의 더욱 다른 바람직한 화합물은 R_3 및 R_4 가 모두 -H이고; X_4 가 N-OH인 화합물이다.
- [0377] 다른 양태에서, 본 발명은 하기 화학식 (XXII)의 화합물을 제공한다:

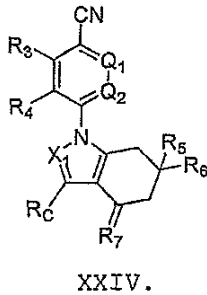


XXII.

- [0378]
- [0379] 화학식 (XXII)의 바람직한 화합물에는, R_c 가 C_1-C_6 알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_1-C_6 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_6)알킬, 또는 헤테로시클로알킬인 화합물이 포함된다.
- [0380] 화학식 (XXII)의 더욱 바람직한 화합물에는, R_c 가 C_3-C_7 시클로알킬, C_1-C_6 할로알킬, 헤테로시클로알킬, 또는 C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_6)알킬이고; X_2 가 탄소이며; R_5 및 R_6 이 C_1-C_6 알킬인 화합물이 포함된다.
- [0381] 화학식 (XXII)의 특히 바람직한 화합물에는 R_c 가 C_1-C_3 알킬, C_3-C_5 시클로알킬, C_3-C_5 시클로알킬(C_1-C_3)알킬, 또는 C_1-C_2 할로알킬인 화합물이 포함된다.
- [0382] 화학식 (XXII)의 특히 바람직한 화합물에는 R_c 가 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 퍼플루오로프로필, 2,2,2-트리플루오로에틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 퍼플루오로에틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합물이 포함된다.
- [0383] 바람직한 양태에서, 본 발명은, Q_3 이 C- R_{21} 인 화학식 (I)의 화합물을 제공한다.

[0384] 더욱 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, Q₃이 -C-R₂₁이며, 여기서 R₂₁이 시아노인 화합물을 제공한다.

[0385] 더욱 바람직한 양태에서, 본 발명은 하기 화학식 (XXIV)의 화합물을 제공한다:

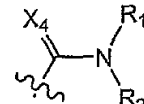


[0386]

[0387] 다른 바람직한 양태에서, 본 발명은, X₁이 N인 화학식 (I)의 화합물을 제공한다.

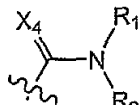
[0388] 더욱 바람직한 양태에서, 본 발명은,

[0389] Q₃이 C-R₂₁이고, 여기서 R₂₁이 -C(O)OH, -C(O)-O(C₁-C₆ 알킬), 또는 화학식



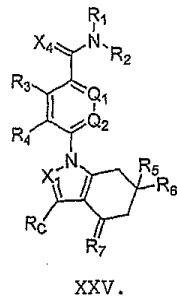
의 기인 화학식 (I)의 화합물을 제공한다.

[0390] 다른 더욱 바람직한 양태에서, 본 발명은



[0391] Q₃이 C-R₂₁이고, 여기서 R₂₁이 화학식

[0392] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 하기 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다:



[0393]

[0394] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, X₁이 N인 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.

[0395] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X₁이 N이고;

[0396] R₃ 및 R₄가 독립적으로 수소, 할로, 또는 -Z₁R₂₁이고, 여기서

[0397] Z₁은 -O- 또는 -NH-이며;

[0398] R₂₁은 C₁-C₁₄ 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R₂₂, 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO₂ 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

- [0399] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0400] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X_1 이 N이고;
- [0401] R_4 가 H이고,
- [0402] R_3 이 수소, 할로 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이며, 여기서
- [0403] Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며;
- [0404] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0405] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0406] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X_1 이 N이고;
- [0407] R_4 가 H이고;
- [0408] R_3 이 $-N(H)R_{Z1}$ 이며, 여기서
- [0409] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0410] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0411] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X_1 이 N이고;
- [0412] R_4 가 H이고;
- [0413] R_3 이 $-N(H)R_{Z1}$ 이며, 여기서
- [0414] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0415] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복스아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$,

$-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않고;

R_c 는 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화합식 (XXV)의 화합물을 제공한다.

바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X_1 이 N이고;

R_3 이 H이고,

R_4 가 수소, 할로 또는 $-\text{Z}_1\text{R}_{21}$ 이며, 여기서

Z_1 은 $-\text{O}-$ 또는 $-\text{NH}-$ 이며;

R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-\text{SH}$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.

바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은 X_1 이 N이고;

R_3 이 H이고,

R_4 가 수소, 할로 또는 $-\text{Z}_1\text{R}_{21}$ 이며, 여기서

Z_1 은 $-\text{O}-$ 또는 $-\text{NH}-$ 이며;

R_{21} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,

R_{21} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-\text{SH}$, $-\text{S}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}_2$, $-\text{SO}_2\text{NH}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2\text{NH}-\text{아릴}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, $-\text{SO}-(\text{C}_1-\text{C}_6)\text{알킬}$, $-\text{SO}_2-\text{아릴}$, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- $(\text{C}_1-\text{C}_{10})\text{알킬아미노}$, $-\text{OC}_1-\text{C}_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않고;

R_c 가 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸 또는 트리플루오로메틸인 화합식 (XXV)의 화합물을 제공한다.

바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,

X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서

R_{11} 은 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-\text{C}(\text{O})\text{R}_c$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서

R_c 는 $-\text{C}_1-\text{C}_6$ 알킬, $-\text{OR}_c$, 또는 $-\text{N}(\text{R}_{\text{CN}})_2$ 이며, 여기서

- [0434] R_{C^*} 는 -H, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0435] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴인 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0436] 더욱 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0437] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서
- [0438] R_{11} 이 수소, 할로젠, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴인 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0439] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0440] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서
- [0441] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{C^*}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0442] R_{C^*} 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{C^*}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0443] R_{C^*} 는 -H, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0444] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이고;
- [0445] R_3 및 R_4 가 독립적으로 수소, 할로, 또는 $-NZ_1R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0446] Z_1 은 -O- 또는 -NH-이며;
- [0447] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0448] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0449] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0450] X_1 이 CR_{11} 이고, 여기서
- [0451] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{C^*}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0452] R_{C^*} 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{C^*}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0453] R_{C^*} 는 -H, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0454] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이고;
- [0455] R_4 가 H이고;

- [0456] R_3 이 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0457] Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이며;
- [0458] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0459] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0460] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0461] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서
- [0462] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{C^*}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0463] R_{C^*} 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{C^*}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0464] R_{C^*} 는 $-H$, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0465] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 $-H$, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, $-$ 헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, $-$ 아릴, 또는 $-$ 헤테로아릴이고;
- [0466] R_4 가 H이고;
- [0467] R_3 이 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0468] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0469] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않은 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0470] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0471] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서
- [0472] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{C^*}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0473] R_{C^*} 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{C^*}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0474] R_{C^*} 는 $-H$, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;

- [0475] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이고;
- [0476] R_4 가 H이고;
- [0477] R_3 이 $-N(H)R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0478] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0479] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0480] R_C 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0481] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0482] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서
- [0483] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_{C'}$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0484] $R_{C'}$ 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_{C'}$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0485] $R_{C'}$ 는 -H, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0486] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 -H, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이고;
- [0487] R_3 이 H이고;
- [0488] R_4 가 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0489] Z_1 은 -O- 또는 -NH-이고;
- [0490] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{22} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0491] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복사아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, -SH, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH$ -아릴, $-SO_2$ -아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2$ -아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{23} 으로 치환되거나 치환되지 않는 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0492] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은,
- [0493] X_1 이 CR_{11} 이며, 여기서

- [0494] R_{11} 이 수소, 할로젠, 시아노, 니트로, $-C(O)R_C$, C_1-C_{10} 알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, C_3-C_7 시클로알킬(C_1-C_{10})알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며, 여기서
- [0495] R_C 는 $-C_1-C_6$ 알킬, $-OR_C$, 또는 $-N(R_{CN})_2$ 이며, 여기서
- [0496] R_C 는 $-H$, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_3-C_7 시클로알킬, 헤테로시클로알킬, 아릴, 또는 헤테로아릴이며;
- [0497] 각각의 R_{CN} 은 독립적으로 $-H$, $-C_1-C_{10}$ 알킬, $-C_1-C_{10}$ -할로알킬, $-C_3-C_7$ 시클로알킬, -헤테로시클로알킬, $-C_1-C_6$ 아실, -아릴, 또는 -헤테로아릴이고;
- [0498] R_3 이 H이고;
- [0499] R_4 가 수소, 할로, 또는 $-Z_1R_{Z1}$ 이고, 여기서
- [0500] Z_1 은 $-O-$ 또는 $-NH-$ 이고;
- [0501] R_{Z1} 은 C_1-C_{14} 알킬 기이고, 여기서 이 알킬 기 중의 탄소 원자의 5개 이하가 독립적으로 R_{Z2} , 카르보닐, 에테닐, 에티닐, 또는 N, O, S, SO_2 또는 SO 로부터 선택된 부분으로 치환되거나 치환되지 않으며, 단, 2개의 O 원자, 2개의 S 원자, 또는 O 및 S 원자는 서로 바로 인접하지 않으며,
- [0502] R_{Z1} 은 임의의 이용가능한 위치에서, C_1-C_{10} 알킬, C_1-C_{10} 할로알킬, C_2-C_{10} 알케닐, C_2-C_{10} 알키닐, 히드록시, 카르복시, 카르복시아미도, 옥소, 할로, 아미노, 시아노, 니트로, $-SH$, $-S-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH_2$, $-SO_2NH-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2NH-$ 아릴, $-SO_2-$ 아릴, $-SO-(C_1-C_6)$ 알킬, $-SO_2-$ 아릴, C_1-C_6 알콕시, C_2-C_{10} 알케닐옥시, C_2-C_{10} 알키닐옥시, 모노- 또는 디- (C_1-C_{10}) 알킬아미노, $-OC_1-C_{10}$ 알킬-Z, 또는 R_{Z3} 으로 치환되거나 치환되지 않으며;
- [0503] R_C 가 수소, 메틸, 에틸, 시클로프로필, 시클로프로필메틸, 플루오로메틸, 디플루오로메틸, 또는 트리플루오로메틸인 화학식 (XXV)의 화합물을 제공한다.
- [0504] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게 약제학적으로 허용되는 양의 화학식 (I)의 화합물 또는 염, 또는 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 포함하는 약제 조성물을 투여하는 것을 포함하여, 암을 치료하는 방법을 포함한다.
- [0505] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게서 암, 염증 또는 관절염 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0506] 다른 양태에서, 본 발명은, 용기에 화학식 (I)의 화합물의 사용 방법에 관한 지시서와 함께 상기 화합물 또는 염을 포함하는 패키지를 포함한다.
- [0507] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게서, 세포 증식과 관련된 질환 또는 상태 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0508] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게서, 세포 증식과 관련된 질환 또는 상태 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것으로서, 상기 질환 또는 상태가 암, 염증 또는 관절염인 용도를 포함한다.
- [0509] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게서, 열 쇼크 단백질 90의 활성화에 관한 질환 또는 질병 치료용 약물을 제조하기 위해 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0510] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 환자에게서, 열 쇼크 단백질 90 및/또는 이의 클라이언트 단백질의 활성화에 관한 질환 또는 질병 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 단독으로 또는 다른 치료제와 함께 사용하는 것으로서, HSP-90 매개된 질환이 염증성 질환, 감염, 자가면역 질환, 뇌졸중, 허혈, 심장 질환, 신경계 질환, 섬유유전 질환, 증식 질환, 종양, 백혈병, 신생물, 암, 암중, 대사 질환 및 악성 질환으로 구성되는 군으로부터 선택되는 용도를 포함한다.
- [0511] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, 하나 이상의 다른 치료제와 함께, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 투여하는 것을 포함하여, 그러한 치료가 필요한 피검체에게서 암을 치료하는 방법을 포함한다.

- [0512] 더욱 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, 하나 이상의 다른 항암제와 함께, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 투여하는 것을 포함하여, 그러한 치료가 필요한 피검체에게서 암을 치료하는 방법을 포함한다.
- [0513] 다른 바람직한 양태에서, 본 발명은, 방사선 치료와 함께, 그러한 치료가 필요한 피검체에게 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 투여하는 것을 포함하여 암을 치료하는 방법을 포함한다.
- [0514] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 피검체에서, 열 쇼크 단백질 90의 활성화와 관련된 섬유유전 질환 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것에 있어서, 상기 섬유유전 질환이 피부경화증, 다발근육염, 전신 루푸스, 류마티스 관절염, 간 경화, 켈로이드 형성, 사이질 콩팥염 및 폐 섬유증으로 구성되는 군으로부터 선택되는 용도를 포함한다.
- [0515] 다른 양태에서, 본 발명은, 플라스모디움 종으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염으로부터 피검체 보호용의 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0516] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, 플라스모디움 팔시파룸에 의해 야기된 감염으로부터 피검체 보호용의 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0517] 다른 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 피검체에서, 플라스모디움 종으로부터 선택된 유기체에 의해 야기된 감염 수준 감소용의 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0518] 바람직한 하나의 양태에서, 본 발명은, 치료가 필요한 피검체에서, 플라스모디움 팔시파룸에 의해 야기된 감염 수준 감소용의 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0519] 다른 양태에서, 본 발명은, 후생동물 기생충으로 감염된 환자 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0520] 하나의 바람직한 양태에서, 본 발명은, 플라스모디움 팔시파룸인 후생동물 기생충에 의해 감염된 환자 치료용 약물을 제조하기 위해, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0521] 다른 양태에서, 본 발명은, 곰팡이 감염증으로 감염된 환자 치료용 약물을 제조하기 위해, 하나 이상의 공지된 항-곰팡이 약물과 함께, 치료학적 유효량의 화학식 (I)의 화합물 또는 염을 사용하는 것을 포함한다.
- [0522] **정의**
- [0523] 용어 "알콕시"는 산소 결합을 통해 모 분자 부분에 결합된 지시된 수의 탄소 원자의 알킬 기를 나타낸다. 알콕시 기의 예로는 메톡시, 에톡시, 프로폭시 및 이소프로폭시가 있다.
- [0524] 본원에 사용된 용어 "알킬"은, 지시된 수의 탄소 원자로 된 그러한 알킬 기를 의미한다. 상기 알킬 기는 직쇄 또는 분지쇄일 수 있다. "알킬"의 예로는 메틸, 에틸, 프로필, 이소프로필, 부틸, 이소-, 2차- 및 3차-부틸, 펜틸, 헥실, 헵틸, 3-에틸부틸 등이 있다.
- [0525] 본원에 사용된 용어 "알케닐"은, 탄소수 2 내지 10개이고, 2개의 수소의 제거로 형성된 탄소-탄소 이중 결합을 하나 이상 함유하는, 직쇄 또는 분지쇄 탄화수소를 의미한다. 알케닐의 대표 예에는 에테닐, 2-프로페닐, 2-메틸-2-프로페닐, 3-부테닐, 4-펜테닐, 5-헥세닐, 2-헵테닐, 2-메틸-1-헵테닐 및 3-데세닐이 있으나 이들에 한정되는 것은 아니다.
- [0526] 용어 "알케녹시"는, 산소 원자를 통해 모 기에 결합된 알케닐 기를 의미한다.
- [0527] 본원에 사용된 용어 "알키닐"은, 탄소수 2 내지 10개를 함유하며, 하나 이상의 탄소-탄소 삼중 결합을 함유하는, 직쇄 또는 분지쇄 탄화수소 기를 의미한다. 알키닐의 대표 예에는 아세틸레닐, 1-프로피닐, 2-프로피닐, 3-부티닐, 2-펜티닐 및 1-부티닐이 포함되나 이들에 한정되는 것은 아니다.
- [0528] 용어 "아릴"은, 하나 이상의 방향족 고리를 함유하는 방향족 탄화수소 고리 시스템을 의미한다. 이 방향족 고리는 임의로 융합될 수 있거나, 그렇지 않으면 다른 방향족 탄화수소 고리 또는 비방향족 탄화수소 고리에 결합될 수 있다. 아릴 기의 예로는 페닐, 나프틸, 1,2,3,4-테트라히드로나프탈렌 및 비페닐이 있다. 아릴 기의 바람직한 예에는 페닐, 나프틸, 및 안트라세닐이 포함된다. 더욱 바람직한 아릴 기는 페닐 및 나프틸이다. 가장 바람직한 것은 페닐이다. 본 발명의 아릴 기는 본원에 제공된 다양한 기로 치환될 수 있다. 따라서, 아릴 고

리 시스템 내에 존재하고 치환에 이용될 수 있는 임의의 탄소 원자는 다양한 고리 치환기, 예컨대 할로젠, 히드록시, 니트로, 시아노, 아미노, C₁-C₈알킬, C₁-C₈알콕시, 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노, C₃-C₁₀시클로알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알콕시, C₂-C₉헤테로시클로알킬, C₁-C₈알케닐, C₁-C₈알키닐, 할로(C₁-C₈)알킬, 할로(C₁-C₈)알콕시, 옥소, 아미노(C₁-C₈)알킬, 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노(C₁-C₈)알킬, C₁-C₈아실, C₁-C₈아실옥시, C₁-C₈설폰닐, C₁-C₈티오, C₁-C₈설폰아미도, C₁-C₈아미노설폰닐에 추가로 결합될 수 있다.

[0529] 본원에 사용된 용어 "카르복시"는 -CO₂H 기를 의미한다.

[0530] 용어 "시클로알킬"은 C₃-C₈ 시클릭 탄화수소를 의미한다. 시클로알킬의 예에는 시클로프로필, 시클로부틸, 시클로펜틸, 시클로헥실, 시클로헵틸 및 시클로옥틸이 포함된다. 더욱 바람직한 것은 C₃-C₆ 시클로알킬 기이다. 본 발명의 시클로알킬 기는 본원에 제공된 다양한 기로 치환될 수 있다. 따라서, 시클로알킬 고리 시스템 내에 존재하며 치환에 이용될 수 있는 임의의 탄소 원자는 다양한 고리 치환기, 예를 들어 할로젠, 히드록시, 니트로, 시아노, 아미노, C₁-C₈알킬, C₁-C₈알콕시, 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노, C₃-C₁₀시클로알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알콕시, C₂-C₉헤테로시클로알킬, C₁-C₈알케닐, C₁-C₈알키닐, 할로(C₁-C₈)알킬, 할로(C₁-C₈)알콕시, 옥소, 아미노(C₁-C₈)알킬 및 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노(C₁-C₈)알킬에 추가로 결합될 수 있다.

[0531] 용어 "할로젠" 또는 "할로"는 불소, 염소, 브롬 또는 요오딘을 나타낸다.

[0532] 용어 "할로알콕시"는, 하나 이상의 할로젠 원자로 치환된 알콕시 기를 나타내며, 여기서 각각의 할로젠은 독립적으로 F, Cl, Br 또는 I이다. 바람직한 할로젠은 F 및 Cl이다. 바람직한 할로알콕시 기는 탄소수 1 내지 6개의 것, 더욱 바람직하게는 탄소수 1 내지 4개의 것, 및 더욱 더 바람직하게는 탄소수 1 내지 2개의 것이다. "할로알콕시"에는 퍼할로알콕시 기, 예컨대 OCF₃ 또는 OCF₂CF₃가 포함된다. 바람직한 할로알콕시 기는 트리플루오로메톡시이다.

[0533] 용어 "할로알킬"은, 하나 이상의 할로젠 원자로 치환된 알킬 기를 의미하며, 여기서 각각의 할로젠은 독립적으로 F, Cl, Br 또는 I이다. 바람직한 할로젠은 F 및 Cl이다. 바람직한 할로알킬 기는 탄소수 1 내지 6개, 더욱 바람직하게는 탄소수 1 내지 4개, 및 더욱 더 바람직하게는 탄소수 1 내지 2개의 것이다. "할로알킬"에는 퍼할로알킬 기, 예컨대 CF₃ 또는 CF₂CF₃가 포함된다. 바람직한 할로알킬 기는 트리플루오로메틸이다.

[0534] 용어 "헤테로시클로알킬"은, 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 함유하는 고리 또는 고리 시스템을 의미하는 데, 여기서 상기 헤테로원자는 비-방향족 고리 내에 있다. 이 헤테로시클로알킬 고리는 임의로 융합되거나, 그렇지 않으면 다른 헤테로시클로알킬 고리 및/또는 비-방향족 탄화수소 고리 및/또는 페닐 고리에 결합된다. 바람직한 헤테로시클로알킬 기는 3 내지 7원의 것이다. 더욱 바람직한 헤테로시클로알킬 기는 5 또는 6원의 것이다. 헤테로시클로알킬 기의 예에는 예를 들어, 1,2,3,4-테트라히드로이소퀴놀리닐, 피페라지닐, 모르폴리닐, 피페리디닐, 테트라히드로푸라닐, 피롤리디닐, 피리디노닐 및 피라졸리디닐이 포함된다. 바람직한 헤테로시클로알킬 기에는 피페리디닐, 피페라지닐, 모르폴리닐, 피롤리디닐, 피리디노닐, 디히드로피롤리디닐, 및 피롤리디노닐이 포함된다. 본 발명의 헤테로시클로알킬 기는 본원에 제공된 다양한 기로 치환될 수 있다. 따라서, 헤테로시클로알킬 고리 내에 존재하며 치환에 이용가능한 임의의 원자는 다양한 고리 치환기, 예컨대 할로젠, 히드록시, 니트로, 시아노, 아미노, C₁-C₈알킬, C₁-C₈알콕시, 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노, C₃-C₁₀시클로알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알콕시, C₂-C₉헤테로시클로알킬, C₁-C₈알케닐, C₁-C₈알키닐, 할로(C₁-C₈)알킬, 할로(C₁-C₈)알콕시, 옥소, 아미노(C₁-C₈)알킬 및 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노(C₁-C₈)알킬에 추가로 결합될 수 있다.

[0535] 용어 "헤테로아릴"은 질소, 산소 및 황으로부터 선택된 하나 이상의 헤테로원자를 함유하는 방향족 고리 시스템을 의미한다. 헤테로아릴 고리는 융합되거나 그렇지 않으면 하나 이상의 헤테로아릴 고리, 방향족 또는 비-방향족 탄화수소 고리 또는 헤테로시클로알킬 고리에 결합될 수 있다. 헤테로아릴 기의 예에는, 예를 들어 피리딘, 푸란, 티에닐, 5,6,7,8-테트라히드로이소퀴놀린 및 피리미딘이 있다. 본 발명의 헤테로아릴 기는 본원에 제공된 다양한 기로 치환될 수 있다. 따라서, 헤테로아릴 고리 시스템 내에 존재하며 치환에 이용가능한 임의의 탄소 원자는 다양한 고리 치환기, 예컨대 할로젠, 히드록시, 니트로, 시아노, 아미노, C₁-C₈알킬, C₁-C₈알콕시, 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노, C₃-C₁₀시클로알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알킬, (C₃-C₁₀시클로알킬)알콕시, C₂-

C₉헥테로시클로알킬, C₁-C₈알케닐, C₁-C₈알키닐, 할로(C₁-C₈)알킬, 할로(C₁-C₈)알콕시, 옥소, 아미노(C₁-C₈)알킬 및 모노- 및 디(C₁-C₈알킬)아미노(C₁-C₈)알킬에 추가로 결합될 수 있다.

[0536] 헥테로아릴 거의 바람직한 예에는, 티에닐, 벤조티에닐, 피리딜, 퀴놀릴, 피라졸릴, 피리미딜, 이미다졸릴, 벤즈이미다졸릴, 푸라닐, 벤조푸라닐, 디벤조푸라닐, 티아졸릴, 벤조티아졸릴, 이속사졸릴, 옥사디아졸릴, 이소티아졸릴, 벤즈이소티아졸릴, 트리아졸릴, 피롤릴, 인돌릴, 피라졸릴 및 벤조피라졸릴이 포함된다.

[0537] 본 발명의 화합물은 하나 이상의 비대칭 탄소 원자를 함유할 수 있어서, 이 화합물은 다양한 입체이성질체 형태로 존재할 수 있다. 이들 화합물은, 예를 들어 라세미체, 키랄 비-라세미 또는 부분입체 이성질체일 수 있다. 이 경우에, 단일 거울상 이성질체, 즉 광학적으로 활성 형태가 비대칭 합성에 의해 또는 라세미체의 분할에 의해 수득될 수 있다. 라세미체의 분할은, 예를 들어 통상적인 방법, 예컨대 분할제의 존재하에서 결정화; 예를 들어 키랄 HPLC 컬럼을 이용한 크로마토그래피; 또는 분할제를 사용하여 라세미 혼합물을 유도체화하여 부분입체 이성질체를 생성시키고, 이 부분입체 이성질체를 크로마토그래피를 통해 분리시키고, 분할제를 제거하여 거울상 이성질체가 풍부한 고유 화합물을 생성시킴으로써 수행될 수 있다. 상기 과정 중 임의의 것은, 화합물의 거울상 이성질체 순도를 증가시키도록 반복될 수 있다.

[0538] 본원에 기술된 화합물이 올레핀계 이중 결합 또는 기타 비대칭의 다른 중심을 함유하고 다르게 명시되지 않는 한, 상기 화합물은 시스, 트랜스, Z- 및 E-배열을 포함한다. 마찬가지로, 모든 호변이성질체 형태가 또한 포함되도록 의도된다.

[0539] 약제 조성물

[0540] 화학식 (I)의 화합물은 경구적으로, 국소적으로, 비경구적으로, 흡입 또는 분무에 의해, 또는 직장에 의해, 통상적인 비독성의 약제학적으로 허용되는 담체, 보조제 및 비히클을 함유하는 투여 단위 제형으로 투여될 수 있다. 본원에 사용된 상기 용어 "비경구"에는 경피, 피하, 정맥 내 (예를 들어, 정맥 내), 근육 내 또는 경막 내 주사 또는 주입 기술 등이 포함된다. 또한, 화학식 (I)의 화합물 및 약제학적으로 허용되는 담체를 포함하는 약제 제형이 제공된다. 화학식 (I)의 하나 이상의 화합물은, 하나 이상의 비독성의 약제학적으로 허용되는 담체 및/또는 희석제 및/또는 보조제, 및 필요한 경우 기타 활성 성분과 함께 존재할 수 있다. 화학식 (I)의 화합물을 함유하는 약제 조성물은 경구 사용을 위해 적합한 형태, 예를 들어, 정제, 트로키, 로젠지, 수성 또는 유성 현탁액, 분산가능한 분말 또는 과립, 에멀전, 경질 또는 연질 캡슐, 또는 시럽 또는 엘릭서일 수 있다.

[0541] 경구 사용을 위한 조성물은 약제 조성물의 제조를 위해 당업계에 공지된 임의의 방법에 따라 제조될 수 있으며, 상기 조성물은 약제학적으로 허용되고 맛있는 제제를 제공하기 위해, 감미제, 향미제, 착색제 및 보존제로 구성되는 군으로부터 선택된 하나 이상의 제제를 함유할 수 있다. 정제는, 정제의 제조에 적합한 비독성의 약제학적으로 허용되는 부형제와 함께 활성 성분을 함유한다. 이들 부형제는 예를 들어, 불활성 희석제, 예컨대 탄산칼슘, 탄산나트륨, 락토오스, 인산칼슘 또는 인산나트륨; 과립화 및 봉해제, 예컨대 옥수수 전분 또는 알긴산; 결합제, 예컨대 전분, 젤라틴 또는 아카시아, 및 윤활제, 예컨대 마그네슘 스테아레이트, 스테아르산 또는 탈크일 수 있다. 정제는 코팅되지 않거나, 공지된 기술로 코팅될 수 있다. 일부 경우에, 그러한 코팅은 위장관에서의 봉해 및 흡수를 지연시켜서 더욱 긴 기간 동안에 지속적인 작용을 제공하도록 공지된 기술로 제조될 수 있다. 예를 들어, 글리세릴 모노스테아레이트 또는 글리세릴 디스테아레이트와 같은 시간 지연 물질이 사용될 수 있다.

[0542] 경구 사용을 위한 제형은 또한, 활성 성분이 불활성 고체 희석제, 예를 들어 탄산칼슘, 인산칼슘 또는 카올린과 혼합되는 경질 젤라틴 캡슐; 또는 활성 성분이 물 또는 오일 매질, 예를 들어 땅콩유, 액체 파라핀 또는 올리브유와 혼합되는 연질 젤라틴 캡슐로 제공될 수 있다.

[0543] 경구 사용을 위한 제형은 또한 로젠지로 제공될 수 있다.

[0544] 수성 현탁액은, 수성 현탁액을 제조하는 데 적합한 부형제와 함께 활성 물질을 함유한다. 그러한 부형제는 현탁화제, 예를 들어 나트륨 카르복시메틸셀룰로오스, 메틸셀룰로오스, 히드록시프로필-메틸셀룰로오스, 나트륨 알기네이트, 폴리비닐피롤리돈, 트라가칸트 겔 및 아카시아 겔이며; 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 부분적인 에스테르와의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비톨 모노올레이트, 또는 에틸렌 옥사이드와 지방산 및 헥시톨 무수물로부터 유래한 부분적인 에스테르와의 축합

생성물, 예를 들어 폴리에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 수성 현탁액은 또한 하나 이상의 보존제, 예를 들어 에틸, 또는 n-프로필 p-히드록시벤조에이트, 하나 이상의 착색제, 하나 이상의 향미제, 및 하나 이상의 감미제, 예컨대 수크로오스 또는 사카린을 함유할 수 있다.

[0545] 유성 현탁액은, 활성 성분을 식물성 유, 예를 들어 아라키스유, 올리브유, 참깨유 또는 코코넛유, 또는 광유, 예컨대 액체 파라핀 중에 현탁시킴으로써 제형화될 수 있다. 상기 유성 현탁액은 증점제, 예를 들어 밀랍, 경질 파라핀 또는 세틸 알코올을 함유할 수 있다. 감미제 및 향미제가 첨가되어 맛좋은 경구 제제를 제공할 수 있다. 이들 조성물은 향산화제, 예를 들어 아스코르빈산을 첨가함으로써 보존될 수 있다.

[0546] 물의 첨가에 의해 수성 현탁액을 제조하는 데 적합한 분산가능한 분말 및 과립은, 분산제 또는 습윤화제, 현탁화제 및 하나 이상의 보존제와의 혼합물로 활성 성분을 제공한다. 적합한 분산제 또는 습윤화제, 또는 현탁화제로는 이미 상기 언급된 것들이 있다. 부가적인 부형제, 예를 들어 감미제, 향미제 및 착색제가 또한 존재할 수 있다.

[0547] 본 발명의 약제 조성물은 또한 수중유형 에멀전 형태일 수 있다. 유성 상은 식물성 유 또는 광유 또는 이들의 혼합물일 수 있다. 적합한 에멀전화제는 천연 검, 예를 들어 아카시아 검 또는 트라가칸트 검, 천연 포스포티딜, 예를 들어 대두, 레시틴, 및 지방산 및 헥시톨로부터 유래한 부분 에스테르 또는 에스테르, 무수물, 예를 들어 소르비탄 모노올레이트, 및 상기 부분 에스테르와 에틸렌 옥사이드의 축합 생성물, 예를 들어 폴리옥시에틸렌 소르비탄 모노올레이트일 수 있다. 이 에멀전은 또한 감미제 및 향미제를 함유할 수 있다.

[0548] 시럽 및 엘릭서는 감미제, 예를 들어 글리세롤, 프로필렌 글리콜, 소르비톨, 글루코오스 또는 수크로오스와 함께 제형화될 수 있다. 상기 제형은 또한 진통제, 보존제, 및 향미제 및 착색제를 함유할 수 있다. 약제 조성물은 멸균성의 주사가능한 수성 또는 유성 현탁액의 형태일 수 있다. 이 현탁액은, 상기에서 이미 언급된 그러한 적합한 분산제 또는 습윤화제 및 현탁화제를 사용하여 공지된 기술에 따라 제형화될 수 있다. 멸균성의 주사가능한 제제는 또한 비독성의 비경구적으로 허용되는 희석제 또는 용매 중의 멸균성의 주사가능한 용액 또는 현탁액, 예를 들어 1,3-부탄디올 중의 용액일 수 있다. 사용될 수 있는 허용가능한 비히클 및 용매 중에서는 물, 링거 용액 및 등장성 염화나트륨 용액이 있다. 또한, 멸균성의 고체 오일이 용매 또는 현탁화 매질로서 통상적으로 사용된다. 이를 위해, 합성의 모노- 또는 디글리세리드를 포함하는 임의의 온후한 고체 오일이 사용될 수 있다. 또한, 올레산과 같은 지방산이 주사가능한 제제에 사용될 수 있다.

[0549] 화학식 (I)의 화합물은 또한 예를 들어, 약물의 직장 투여를 위해 좌약의 형태로 투여될 수 있다. 이들 조성물은, 약물을, 실온에서는 고체이나 직장 내 온도에서는 액체이어서 직장 내에서 용융되어 약물을 방출시키는, 적합한 비자극성 부형제와 함께 혼합시켜 제조될 수 있다. 그러한 물질에는 코코아 버터 및 폴리에틸렌 글리콜이 포함된다.

[0550] 화학식 (I)의 화합물은 멸균성 매질 중에서 비경구적으로 투여될 수 있다. 사용된 비히클 및 농도에 따라 다르나 약물은 비히클 중에 현탁되거나 용해될 수 있다. 유리하게는, 국소 마취제, 보존제 및 완충제와 같은 보조제가 비히클 중에 용해될 수 있다.

[0551] 눈 또는 기타 외부 조직, 예를 들어 입 및 피부의 질환에 있어서, 제형은 예를 들어 0.075 내지 30% w/w, 바람직하게는 0.2 내지 20% w/w, 및 가장 바람직하게는 0.4 내지 15% w/w의 총량으로 활성 성분을 함유하는, 바람직하게는 국소 젤, 스프레이, 연고 또는 크림으로서, 또는 좌약으로서 적용된다. 연고로 제형되는 경우에, 활성 성분은 파라핀 또는 수-혼화성 연고 베이스와 함께 사용될 수 있다.

[0552] 다르게는, 활성 성분은 수중유형 크림 베이스를 사용하여 크림으로 제형화될 수 있다. 필요한 경우, 크림 베이스의 수성 상은, 예를 들어 적어도 30% w/w의 다가 알코올, 예컨대 프로필렌 글리콜, 부탄-1,3-디올, 만니톨, 소르비톨, 글리세롤, 폴리에틸렌 글리콜 및 이들의 혼합물을 포함할 수 있다. 국소 제형은 바람직하게는 피부 또는 기타 감염된 영역을 통해 활성 성분의 흡수 또는 침투를 증강시키는 화합물을 포함할 수 있다. 그러한 경피 침투 증강제의 예에는, 디메틸실록사이드 및 관련된 유사체가 포함된다. 본 발명의 화합물은 또한 경피 장치에 의해 투여될 수 있다. 바람직하게는 국소 투여는 저장소 및 다공성 막 유형, 또는 다양한 고체 매트릭스의 패치를 사용하여 수행될 것이다. 어느 하나의 경우에, 활성 성분은, 수용자의 피부 또는 점막과 접촉하는, 활성 성분이 투과가능한 접착제 내로 막을 통해 저장소 또는 마이크로캡슐로부터 연속적으로 전달된다. 활성 성분이 피부를 통해 흡수되는 경우에, 활성 성분의 소정의 제어된 흐름이 수용자에게 투여된다. 마이크로캡슐의 경우에, 캡슐화제는 또한 막으로서 기능할 수 있다. 경피 패치는 접착제 시스템, 예컨대 아크릴 에멀전, 및 폴리에스테르 패치와 함께 적합한 용매 시스템 중에 화합물을 포함할 수 있다. 본 발명의 에멀전의 유성 상은

공지된 방식으로 공지된 성분으로부터 구성될 수 있다. 상기 상은 에멀전화제만을 포함할 수 있으나, 이는 하나 이상의 에멀전화제와 지방 또는 오일, 또는 지방 및 오일 모두와의 혼합물을 포함할 수도 있다. 바람직하게는, 친수성 에멀전화제가, 안정화제로 작용하는 친지질 에멀전화제와 함께 포함된다. 오일 및 지질 모두를 포함하는 것이 바람직하다. 또한, 안정화제를 사용하거나 사용하지 않은 에멀전화제(들)가 소위 에멀전화 왁스를 구성하고, 상기 왁스는 오일 및 지질과 함께 소위 에멀전화 연고 베이스를 구성하는 데, 이 베이스는 크림 제형의 유성 분산 상을 형성한다. 본 발명의 제형에 사용하기에 적합한 에멀전화제 및 에멀전 안정화제에는 특히 트윈 60, 스팬 80, 세토스테아릴 알코올, 미리스틸 알코올, 글리세릴 모노스테아레이트, 및 나트륨 라우릴 설페이트가 있다. 제형에 사용하기 위한 적합한 오일 또는 지질의 선택은 목적하는 미용학적 특성의 달성에 기초하고 있는 데, 그 이유는 약제학적 에멀전 제형에 사용하기에 용이한 대부분의 오일 중에 활성 화합물의 용해도가 매우 낮기 때문이다. 따라서, 크림은 바람직하게는 비-유지성이어야 하고, 비-염색성이어야 하며, 세척가능한 생성물이어야 할 뿐 아니라, 튜브 또는 기타 용기로부터 누출이 방지되도록 균일한 점도를 지니고 있어야 한다. 직쇄 또는 분지쇄의 일- 또는 이염기성 알킬 에스테르, 예컨대 디-이소아디페이트, 이소세틸 스테아레이트, 코코넛 지방산의 프로필렌 글리콜 디에스테르, 이소프로필 미리스테이트, 데실 올레이트, 이소프로필 팔미테이트, 부틸 스테아레이트, 2-에틸헥실 팔미테이트, 또는 분지쇄 에스테르의 혼합물이 사용될 수 있다. 이들은, 요구되는 특성에 따라 달라지나, 단독으로 또는 조합되어 사용될 수 있다. 대안적으로, 백색 연질 파라핀 및/또는 액체 파라핀 또는 다른 광유와 같은 고융점 지질이 사용될 수 있다.

[0553] 눈으로 국소 투여하는 데 적합한 제형은, 활성 성분이 적합한 담체, 특히 활성 성분을 위한 수성 용매 중에 용해되거나 현탁되는 점안액을 포함한다. 항염증성 활성 성분은 바람직하게는, 그러한 제형 중에, 0.5 내지 20%, 유리하게는 0.5 내지 10%, 및 특히 약 1.5% w/w의 농도로 존재한다. 치료 목적을 위해, 본 발명의 이러한 조합의 활성 화합물은, 지시된 투여 경로에 적합한 하나 이상의 보조제와 통상적으로 조합된다. 경구 투여되는 경우에, 상기 화합물은 락토오스, 수크로오스, 전분 분말, 알칸산의 셀룰로오스 에스테르, 셀룰로오스 알킬 에스테르, 텔크, 스테아르산, 마그네슘 스테아레이트, 마그네슘 옥사이드, 인산 및 황산의 나트륨 및 칼슘 염, 젤라틴, 아카시아 검, 나트륨 알기네이트, 폴리비닐피롤리돈, 및/또는 폴리비닐 알코올과 혼합된 다음, 편리한 투여를 위해 정제화되거나 캡슐화될 수 있다. 그러한 캡슐 또는 정제는 조절 방출형 제형을 함유할 수 있는 데, 이는 히드록시프로필메틸 셀룰로오스 중의 활성 화합물의 분산액으로 제공될 수 있다. 비경구 투여를 위한 제형은 수성 또는 비-수성의 등장성 멸균 주사 용액 또는 현탁액의 형태일 수 있다. 이들 용액 및 현탁액은, 경구 투여를 위한 제형으로 사용하도록 언급된 담체 또는 희석제 중의 하나 이상을 갖는 멸균성 분말 또는 과립으로부터 제조될 수 있다. 상기 화합물은 물, 폴리에틸렌 글리콜, 폴리프로필렌 글리콜, 에탄올, 옥수수유, 면실유, 땅콩유, 참깨유, 벤질 알코올, 염화나트륨, 및/또는 다양한 완충제 중에 용해될 수 있다. 기타 보조제 및 투여 형태는 약제 분야에 널리 그리고 잘 공지되어 있다.

[0554] 일당 체중 킬로그램 당 약 0.1 mg 내지 약 140 mg 정도의 용량 수준이 상기 언급된 상태의 치료에 유용하다 (일당 그리고 환자 당 약 0.5 mg 내지 약 7 g). 단일 투여형을 생성시키도록 담체 물질과 배합될 수 있는 활성 성분의 양은 치료할 숙주 및 특정 투여 형태에 따라 달라질 것이다. 투여 단위형은 일반적으로 약 1 mg 내지 약 500 mg의 활성 성분을 함유할 것이다. 상기한 일일 용량은 일당 1 내지 4회 용량으로 투여될 수 있다. 피부 질환의 경우에, 본 발명의 화합물의 국소 제제를 감염된 영역에 일일 2 내지 4회의 횟수로 적용하는 것이 바람직할 수 있다.

[0555] 그러나, 임의의 구체적인 환자에 대한 특정 용량 수준은, 사용된 특정 화합물의 활성, 연령, 체중, 일반적인 건강 상태, 성별, 식단, 투여 시간, 투여 경로, 배설 속도, 약물 조합 및 특정 질환에 대해 수행중인 치료의 중증도를 포함하는 다양한 인자에 따라 달라질 것이다.

[0556] 비-사람 동물에 투여하기 위해, 상기 조성물은 또한 동물 사료 또는 음용수에 첨가될 수 있다. 동물이 이의 먹이와 함께 치료학적으로 적절한 양의 조성물을 섭취하도록 동물 사료 및 음용수 조성물을 제형화하는 것이 편리할 수 있다. 또한 사료 또는 음용수에 첨가하기 위한 사전혼합물(premix)로서 조성물을 제공하는 것이 편리할 수 있다. 바람직한 비-사람 동물에는 사육된 동물이 포함된다.

[0557] 본 발명의 화합물은, 하나 이상의 부가적인 치료제 또는 치료법, 예를 들어 방사선 요법과 함께 또는 단독으로, 그러한 치료가 필요한 환자에게 투여될 수 있다. 부가적인 치료제 또는 치료법은 본 발명의 화합물의 투여와 동시에, 이와는 개별적으로, 또는 이와 연속하여 투여될 수 있다. 그러한 부가적인 치료제에는 항암제, 항염증제 등이 포함되나 이에 제한되는 것은 아니다.

[0558] 본 발명의 화합물은 공지된 화학 반응 및 과정을 사용하여 제조될 수 있다. 본 발명의 화합물을 합성하기 위한

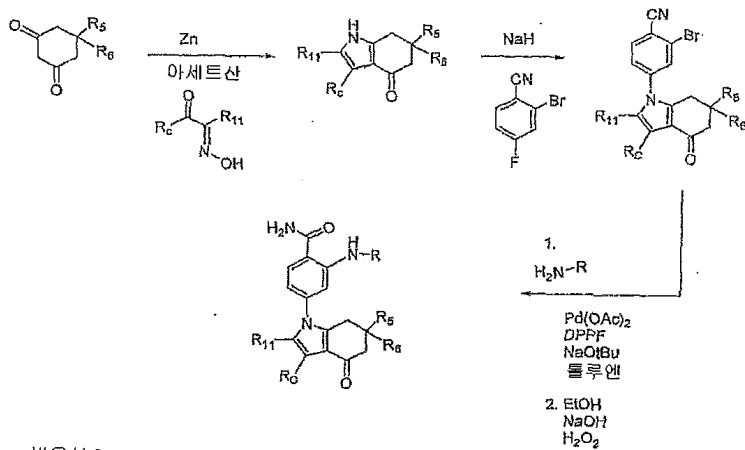
대표적인 방법이 하기되어 있다. 목적하는 표적 화합물에 요구되는 치환기의 성질은 종종 바람직한 합성 방법을 결정한다. 이들 방법의 모든 가변 그룹은, 이들이 이하에서 구체적으로 정의되지 않는 한 일반적인 설명으로 기술된다.

[0559] 제조 방법

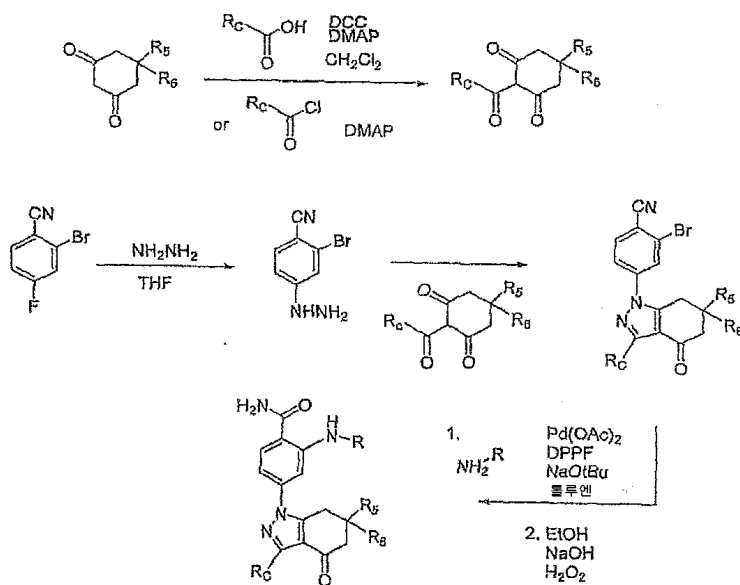
[0560] 일반적인 과정

[0561] 본 발명의 화합물을 제조하기 위한 대표적인 합성 과정은 하기 반응식에 요약되어 있다. 달리 언급되지 않는 한, X_1 , X_2 , X_3 , n , R_5 , R_6 , R_7 , R_c , R_{11} 및 Y 는 화학식 (I)에서 주어진 정의를 포함한다. R 의 정의는 화학식 (XVII)와 관련하여 상기 기술된 바와 같다.

반응식 1

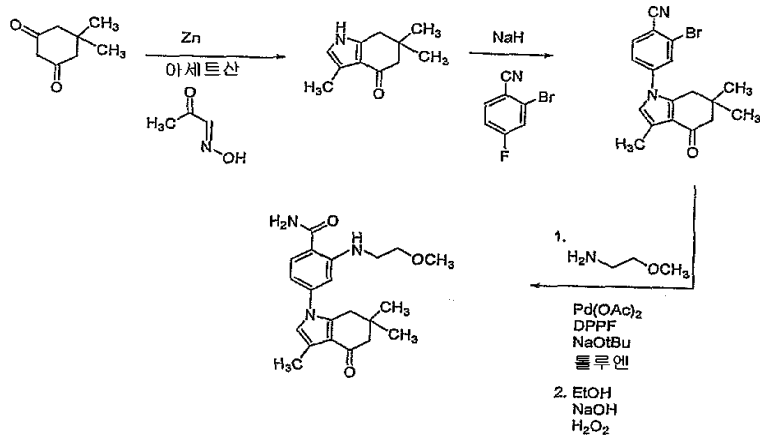


반응식 2

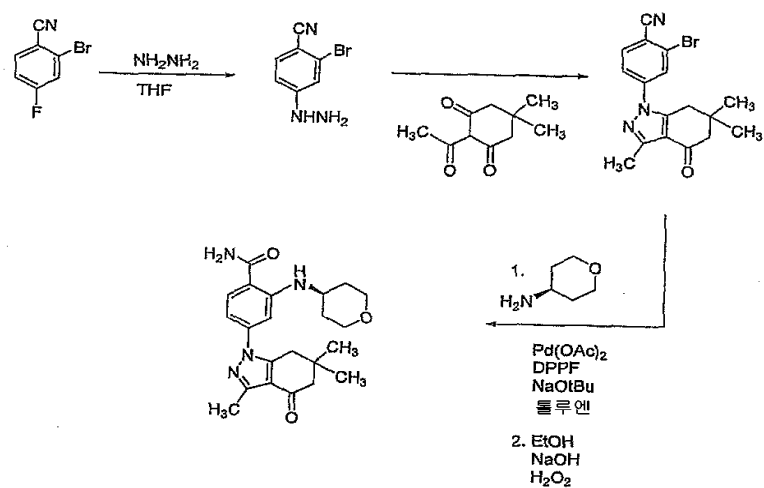


[0562]

반응식 3

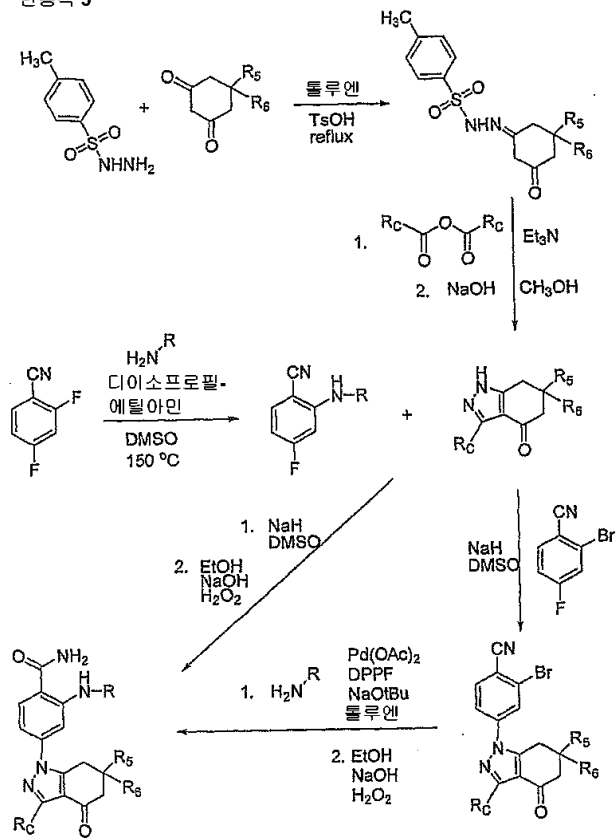


반응식 4

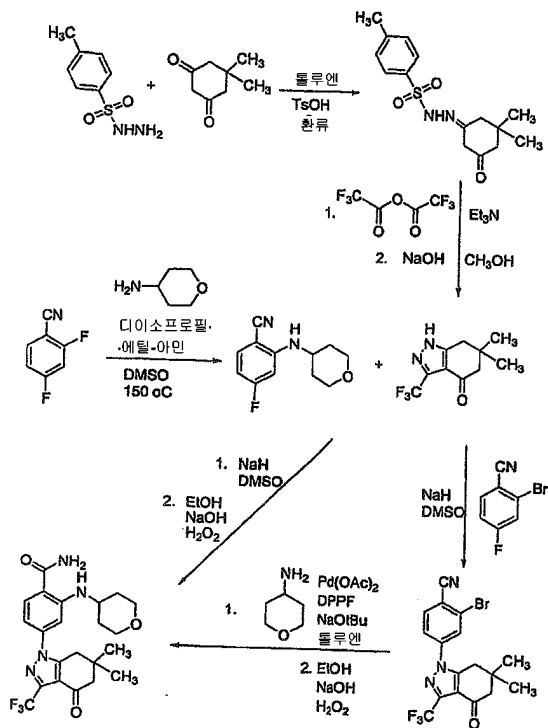


[0563]

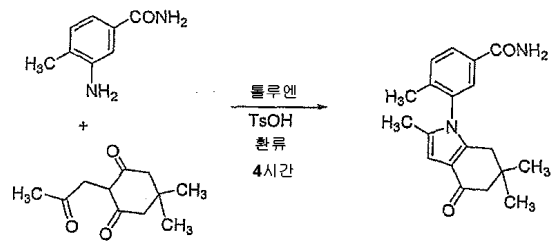
반응식 5



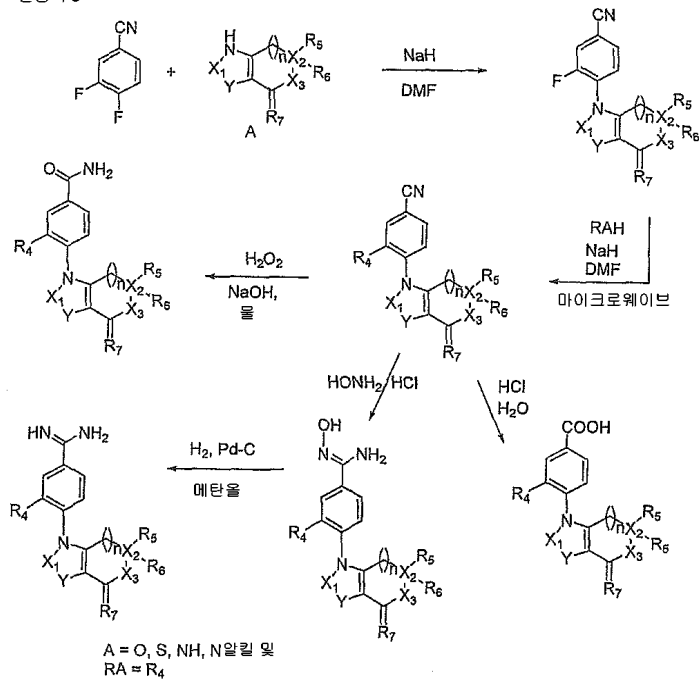
반응식 6



반응식 7

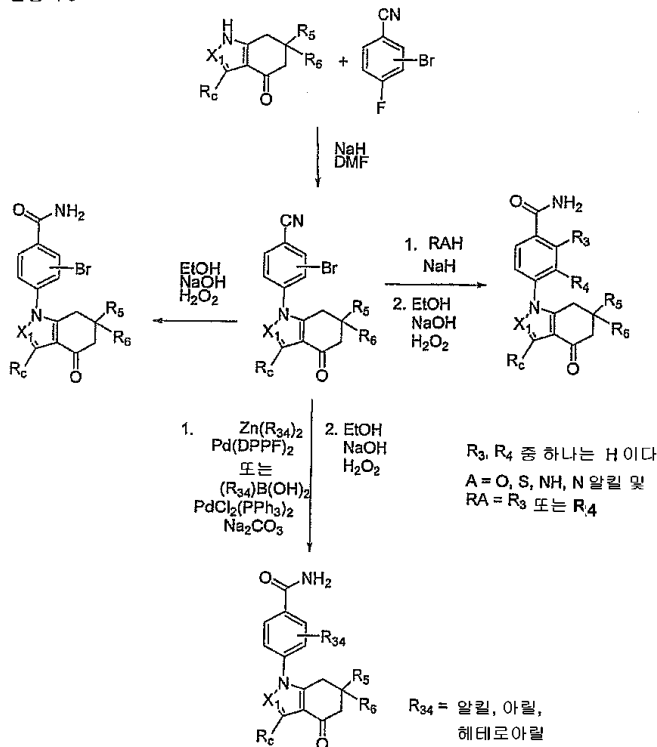


반응식 8



[0566]

반응식 9



[0567]

[0568]

당업자는, 하기 실시예에 의해 입증된 바와 같이, 본 발명에 의해 포함된 화합물을 생성시키기 위해, 출발 물질 및 반응 조건이 달라질 수 있으며, 사용된 반응 순서가 변화되고, 부가적인 단계가 사용될 수 있음을 인지할 것이다. 일부 경우에, 특정 반응성 작용기의 보호가 상기 변형 중 일부를 수행하는 데 필수적일 수 있다. 일반적으로, 그러한 보호기 및 그러한 기를 부착시키고 제거하는 데 필요한 조건들에 대한 필요는 유기 합성 분야의 당업자에게 자명할 것이다.

[0569]

특허를 포함하는 본원에서 언급된 모든 문헌 및 참고자료의 개시 내용은 참조로 본원에 포함된다.

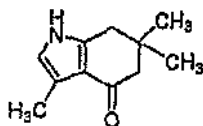
발명을 실시하기 위한 구체적인 내용

[0570]

본 발명의 화합물의 제조는 하기 실시예에 의해 추가로 설명되나, 이들은 실시예에 기술된 특정 과정 및 화합물로 본원의 사상 및 범주를 한정하려는 것으로 해석되지 않는다. 모든 경우에, 달리 언급되지 않는 한, 컬럼 크로마토그래피는 실리카 겔 고체 상을 사용하여 수행된다.

[0571]

실시예 1



[0572]

[0573]

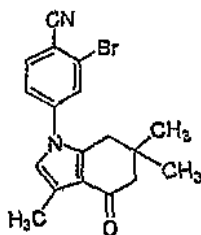
3,6,6-트리메틸-1,5,6,7-테트라하드로-인돌-4-온 (화합물 1)

[0574]

HOAc-H₂O (7:3, 200 mL) 중의 항-피루브산 무수물-1-옥심 (10 g, 1 eq) 및 5,5-디메틸-1,3-시클로헥산디온 (16.1 g, 1 eq) 용액에 실온에서 물로 냉각시키면서 서서히 아연 분말 (14.95 g, 2 eq)을 첨가하였다. 그런 다음, 이 혼합물을 밤새 환류시키고, 농축 건조시키고, 염수 (300 mL)와 디클로로메탄 (300 mL) 사이에 분배시켰다. 포화 NaHCO₃ 수용액으로 pH를 약 6으로 조정된 후에, 혼합물을 디클로로메탄 (3 x 200 mL)으로 추출하였다. 유기 층을 합하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 미정제 생성물을 용리제로 디클로로메탄 중의 5% 에틸 아세테이트를 사용하여 플래쉬 크로마토그래피시켰다. 합한 유기 분획을 농축시키고, 에테르-헥산 (2:1)으로 1시간 동안 분쇄하고, 여과한 다음, 헥산으로 세척하여, 순수 표제 화합물 (9 g,

45% 수율)을 고형물로 수득하였다. LCMS m/z : (M+H) = 178.1.

[0575] 실시예 2

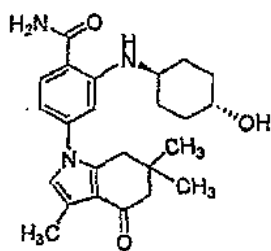


[0576]

[0577] 2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴 (화합물 2)

[0578] 실시예 1의 표제 화합물 (9.8 g, 55.3 mmol) 및 2-브로모-4-플루오로벤조니트릴 (13.27 g, 66.4 mmol)을 무수 디메틸포름아미드 (DMF, 300 mL) 중에 용해하였다. 여기에 수소화나트륨 (95%, 2.79 g, 111 mmol)을 첨가하고 반응을 55°C에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고 물을 첨가하였다. 황갈색 고형물이 침전되었고, 이것을 여과하고, 물 및 에테르로 세척한 다음, 진공에서 건조시켰다 (16.5 g, 84%). LCMS m/z : (M+H) = 358.1.

[0579] 실시예 3

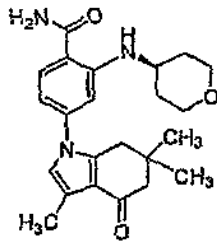


[0580]

[0581] 2-(트랜스-4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 3)

[0582] 개인 화학 마이크로웨이브 바이얼에 실시예 2의 표제 화합물, [2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴 (1.072 g, 3.0 mmol)], 트랜스-4-아미노시클로헥산올 (1.382 g, 12.0 mmol), 팔라듐 (II) 아세테이트 (33.7 mg, 5 mol %), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (DPPF) (166.3 mg, 10 mol %), 및 나트륨 3차-부톡시드 (576.7 mg, 6.0 mmol)를 충전하였다. 여기에 톨루엔 (20 mL)을 첨가하고, 반응을 15분 동안 115°C로 마이크로웨이브를 조사시키면서 가열하였다. 반응 용기를 냉각시킨 후에, 현탁액을 형성시키고 이를 여과하고, 여액을 증발시켰다. 잔류물을 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 중간체 생성물은 25% 디메틸설폭사이드/에탄올 중에 용해시킴으로써 가수분해하였고, 0.5 mL의 1N 수산화나트륨 및 0.5 mL의 30% 과산화수소 수용액 중에서 가수분해시킨 후에, 실온에서 4시간 동안 가열하였다. 반응을 TLC로부터 완료된 것으로 판단한 후에, DMSO/에탄올 혼합물을 물로 희석시키고, 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하였다. 합쳐진 유기물을 염수 (2x)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고 증발하였다. 이 화합물을 용리제로 EtOAc-MeOH를 사용하는 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 575 mg (47% 수율)의 표제 화합물을 백색 분말로서 수득하였다. LCMS m/z : (M+H) = 410.3

[0583] 실시예 4

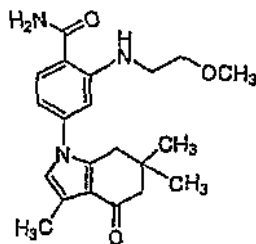


[0584]

[0585] 2-(테트라히드로-피란-4-아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 4)

[0586] "개인 화학" 마이크로웨이브 바이얼에 실시예 2의 표제 화합물 (2.858 g, 8.0 mmol), 4-아미노테트라히드로피란 (3.236 g, 32.0 mmol), 팔라듐 (II) 아세테이트 (89.8 mg, 5 mol %), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (443.6 mg, 10 mol %), 및 나트륨 3차-부톡사이드 (1.538 g, 16.0 mmol)를 충전하였다. 시약을 톨루엔 (40 mL)에 현탁시키고, 이것을 15분 동안 115℃로 마이크로웨이브 조사로 가열하였다. 반응 용기를 냉각시킨 후에, 현탁액을 여과하고 여액을 농축시켰다. 미정제 중간체 니트릴을 플래쉬 크로마토그래피로 정제하고, 니트릴을 25% 디메틸설폭사이드/에탄올에 용해하고, 1N 나트륨 히드록사이드 2 mL, 및 30% 과산화수소 수용액 2 mL를 첨가한 다음, 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 그런 다음, DMSO/에탄올 혼합물을 물로 분쇄하고 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하였다. 합한 유기물을 염수 (2x)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고 증발하였다. 잔류물을 컬럼 크로마토그래피 (EtOAc/MeOH)로 정제하여 1.132 g (36%)의 표제 화합물을 회백색 분말로 수득하였다. LCMS m/z: (M+H) = 396.7.

[0587] 실시예 5

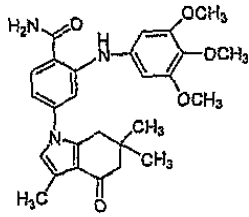


[0588]

[0589] 2-(2-메톡시-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 5)

[0590] "개인 화학" 마이크로웨이브 바이얼에 실시예 2 (107.1 mg, 0.3 mmol)의 표제 화합물, 2-메톡시에틸아민 (91.3 mg, 1.2 mmol), 팔라듐 (II) 아세테이트 (3.4 mg, 5 mol %), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (16.6 mg, 10 mol %), 및 나트륨 3차-부톡사이드 (57.7 mg, 0.6 mmol)를 넣었다. 시약들을 톨루엔 (2 mL) 중에 현탁시키고, 이것을 15분 동안 115℃의 온도로 마이크로웨이브 복사선을 사용하여 가열하였다. 반응 용기를 냉각시킨 후에, 현탁액을 여과하고 여액을 증발하였다. 미정제 중간체 니트릴을 플래쉬 크로마토그래피로 정제시킨 다음, 잔류물을 25% 디메틸설폭사이드/에탄올에 용해시켜 가수분해를 수행하고, 5 점적의 1N 나트륨 히드록사이드 및 5 점적의 30% 과산화수소 수용액을 첨가한 후에, 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 그런 다음, 이 DMSO/에탄올 혼합물을 물로 희석시키고, CH₂Cl₂로 추출하였다 (3x). 합한 유기물을 염수 (2x)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 농축하였다. 이 화합물을 컬럼 크로마토그래피 (헥산/EtOAc)로 정제하여 표제 화합물 (94.4 mg, 85% 수율)을 회백색 분말로 수득하였다. LCMS m/z: (M + H) 370.2.

[0591] 실시예 6



[0592]

[0593] 2-(3,4,5-트리메톡시-페닐아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 6)

[0594] "개인 화학" 마이크로웨이브 바이얼에 실시예 2의 표제 화합물 (107.1 mg, 0.3 mmol), 3,4,5-트리메톡시아닐린 (219.9 mg, 1.2 mmol), 팔라듐 (II) 아세테이트 (3.4 mg, 5 mol %), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (16.6 mg, 10 mol %), 및 나트륨 3차-부톡사이드 (57.7 mg, 0.6 mmol)를 넣었다. 시약들을 톨루엔 (2 mL)에 현탁시키고, 마이크로웨이브 복사선을 사용하여 15분 동안 115℃로 가열하였다. 반응 용기를 냉각시킨 후에, 현탁액을 여과하고, 여액을 증발시켰다. 잔류물을 플래쉬 크로마토그래피로 정제하고, 생성물을 25% 디메틸설폭사이드/에탄올에 용해시켜 가수분해를 수행하고, 5 점적의 1 N 나트륨 히드록사이드 및 5 점적의 30% 과산화수소 수용액을 첨가한 다음, 실온에서 3시간 동안 교반시켰다. 그런 다음, 이 DMSO/에탄올 혼합물을 물로 희석하고, EtOAc (3x)로 추출하였다. 합한 유기물을 염수 (2x)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시킨 다음 농축하였다. 화합물을 컬럼 크로마토그래피 (헥산/EtOAc)로 정제하여 28.4 mg (20%)의 표제 화합물을 황색 분말로서 수득하였다. LCMS m/z: (M+H) 478.3

[0595] 실시예 7

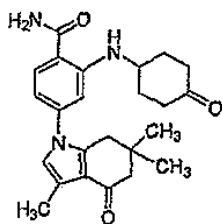


[0596]

[0597] 2-[(피리딘-3-일메틸)-아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 7)

[0598] "개인 화학" 마이크로웨이브 바이얼에 실시예 2의 표제 화합물 (107.1 mg, 0.3 mmol), 3-(아미노메틸)피리딘 (129.8 mg, 1.2 mmol), 팔라듐 (II) 아세테이트 (3.4 mg, 5 mol %), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (16.6 mg, 10 mol %), 및 나트륨 3차-부톡사이드 (57.7 mg, 0.6 mmol)를 넣었다. 시약들을 톨루엔 (2 mL)에 현탁시키고, 마이크로웨이브 복사선을 사용하여 15분 동안 125℃로 가열하였다. 미정제 중간체 니트릴을 플래쉬 크로마토그래피 (헥산/EtOAc)로 정제하였다. 잔류물을 25% 디메틸설폭사이드/에탄올에 용해시켜 가수분해를 수행하고, 4 점적의 1 N 나트륨 히드록사이드 및 4 점적의 30% 과산화수소 수용액을 첨가한 다음, 실온에서 15분 동안 교반시켰다. 그런 다음, 이 DMSO/에탄올 혼합물을 물로 희석하고, EtOAc (3x)로 추출하였다. 합한 유기물을 염수 (2x)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시킨 다음 농축하였다. 화합물을 컬럼 크로마토그래피 (헥산/EtOAc)로 정제하여 50 mg (41%)의 표제 화합물을 황색 분말로서 수득하였다. LCMS m/z: (M+H) 403.

[0599] 실시예 8

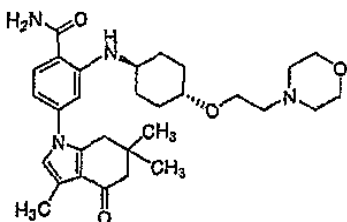


[0600]

[0601] 2-(4-옥소-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 8)

[0602] 실시예 3의 표제 화합물, [2-(4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드] (150 mg, 0.366 mmol) 및 데스-마틴 (Dess-Martin) 페리오디난 (0.366 mmol)을 무수 CH_2Cl_2 에 용해하고, 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 농축시키고, 용리제로 EtOAc-MeOH를 사용하는 컬럼 크로마토그래피로 정제하여, 표제 화합물을 백색 고형물 (36.2 mg, 24% 수율)로 분리하였다. LCMS m/z: (M+H) = 408.3.

[0603] 실시예 9

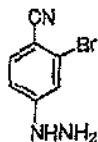


[0604]

[0605] 2-[트랜스-4-(2-모르폴린-4-일-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (화합물 9)

[0606] 마이크로웨이브용 반응 용기에 실시예 3의 표제 화합물, [2-(트랜스-4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드] (100 mg, 0.244 mmol), 4-(2-클로로에틸)모르폴린 히드로클로라이드 (45.4 mg, 0.244 mmol), 수소화나트륨 (17.3 mg, 0.732 mmol), 및 촉매량의 요오드화 칼륨을 넣었다. DMF에 현탁시키고 나서, 반응 혼합물을 8분 동안 "개인 화학" 마이크로웨이브에서 180℃로 가열하였다. 그런 다음, 상기 용액을 물로 희석하고, EtOAc (2x)로 추출하였다. 유기 층을 2N HCl (2x)로 추출하였다. 이 추출물을 염화나트륨 수용액을 사용하여 염기성화시키고, EtOAc (3x)로 추출하였다. 합한 유기물을 Na_2SO_4 상에서 건조시키고, 농축한 다음, 컬럼 크로마토그래피 (EtOAc/MeOH)로 정제하여, 표제 화합물을 백색 고형물로 수득하였다. LCMS m/z: (M+H) 523.9.

[0607] 실시예 10



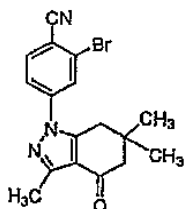
[0608]

[0609] 3-브로모-4-시아노페닐히드라진 (화합물 10)

[0610] 깨끗한 건조 상태의 250-mL의 둥근 바닥 플라스크 중에서, N_2 하에서 2-브로모-4-플루오로벤조니트릴 (25.34 g)을 테트라히드로푸란 (50 mL)에 용해하였다. 여기에 무수 히드라진 (50 mL)을 서서히 첨가하였다. 용액이 황색에서 적-오렌지색으로 변색되었다. 반응을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 황색-백색 결정질 고체가 용액으로부터 침전되었다. 그런 다음, 고형물이 용해되도록 혼합물을 THF (50 mL)로 희석시켰다. 이후, 유기 층을, 유기 층의 pH가 대략 8.5가 될 때까지 포화 중탄산나트륨 용액으로 세척하였다. 유기 층을 분리하고, 용

매를 감압 하에서 제거하여 백색 고형물을 수득하였다. 이것을 소결 유리 깔대기에 넣고, 1.5 L의 물에 이어 디에틸 에테르 (약 200 mL)로 세척하였다. 그런 다음, 에테르를 백색 고형물과 합치고, 감압 하에서 건조하였다. 표제 화합물을 보풀감있는 (fluffy) 백색 또는 회백색 고형물 (23.43 g, 87.2% 수율)로 수득하였다. LCMS m/z: 계산치 = 212.05; 실측치 = 252.98 (M+H⁺ 아세트니트릴).

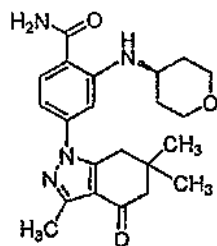
실시예 11



2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (화합물 11)

깨끗한 건조시킨 20 mL의 마이크로웨이브 반응 바이얼에서, 실시예 10 (2.49 g)의 표제 화합물을 2-아세틸-5,5-디메틸-1,3-시클로헥산디온 (2.14 g)과 합하였다. 이 바이얼의 내용물을 에탄올-아세트산 (12 mL, 3:1)에 용해하였다. 바이얼을 밀봉하고, 보텍스 (vortex) 상에서 교반하였다. 그런 다음, 상기 바이얼을 마이크로웨이브 반응기에 위치시키고, 15분 동안 150 °C로 가열하였다. 바이얼을 냉각시킨 후에 냉장고에 1시간 동안 넣어두었다. 그런 다음, 냉각된 용액을 물 (8 mL)로 희석하고, 소결 유리 깔대기에 부었다. 오렌지색 고형물을 H₂O (100 mL)에 이어 에탄올 (25 mL)로 세척하였다. 이후, 고형물을 감압 하에서 건조시켰다. 표제 화합물을 옅은 오렌지색 결정성 고체 (3.7463 g, 88.85% 수율)로 수득하였다. LCMS m/z M+H = 358.1.

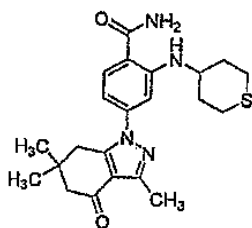
실시예 12



2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 12)

실시예 11의 표제 화합물 (100 mg, 0.28 mmol), Pd(OAc)₂ (3.2 mg, 5 mol%), DPPF (15.5 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (54 mg, 0.56 mmol)를 2 mL의 마이크로웨이브 바이얼에 첨가하였다. 톨루엔 (0.5 mL) 및 4-아미노테트라히드로피란 (56 µL, 0.56 mmol)을 첨가하고, 이 바이얼을 배기시키고 N₂로 다시 채웠다. 반응 혼합물을 15분 동안 120 °C에서 가열하였다 (마이크로웨이브). 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 메틸렌 클로라이드로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 에틸 아세테이트를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 생성물을 회백색 고형물 (88 mg, 83%)로 회수하였다: LCMS m/z: (M+H) = 379.3. 에탄올 (0.8 mL), DMSO (0.2 mL), NaOH (5 N, 93 µL, 2 mol eq) 및 H₂O₂ (0.1 mL, 30% 수용액)를 2 mL 마이크로웨이브 바이얼 중의 피라졸 (88 mg, 0.23 mmol)에 첨가하였다. 반응 혼합물을 100 °C에서 10분 동안 가열하였다. 생성물을 H₂O 및 에틸 아세테이트로 세척하여 수거하였다. 용매를 진공 하에서 제거하여, 표제 화합물을 황색 고형물 (88 mg, 100%)로 수득하였다: LCMS m/z: (M + H) = 397.3.

[0619] 실시예 13



[0620]

[0621] 2-(테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드 (화합물 13)

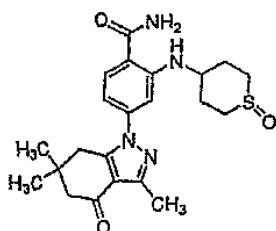
[0622]

테트라히드로-티오피란-4-온 (10.0 g, 86.0 mmol) 및 NH_4OAc (60 g, 10 mole eq)를 200 mL의 $\text{MeOH}/\text{H}_2\text{O}$ (1:1)에 용해하였다. 여기에 NaCNBH_3 (10.8 g, 172.0 mmol)를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 밤새 교반하였다. 메탄올을 진공하에서 제거하고, 생성물을 에틸 아세테이트 (3x100 mL)를 사용하여 수성 층으로부터 추출해내고, 염수로 세척하였다. 유기 층을 10% HCl 수용액 (150 mL)으로 세척한 다음, 이것을 10% NaOH 용액을 사용하여 염기성화하였다 (pH 11로). 그런 다음, 이 염기성 용액을 에틸 아세테이트로 세척하고, MgSO_4 상에서 건조시켜 4-아미노테트라히드로티오피란을 수득하였는데, 이것을 추가 정제 없이 사용하였다: LCMS m/z : $(\text{M}+\text{H})^+ = 118.2$. 화합물 11 (1.4 g, 3.9 mmol), $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (44.7 mg, 5 mol%), DPPF (229 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (790 mg, 7.8 mmol)를 20 mL 마이크로웨이브 바이얼에 첨가하였다. 톨루엔 (12 mL) 및 4-아미노테트라히드로티오피란 (550 mg, 1.2 mol eq)을 첨가하고, 바이얼을 배기시킨 다음, N_2 로 재충전하였다. 반응 혼합물을 130°C에서 20 분 동안 가열하였다 (마이크로웨이브). 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 CH_2Cl_2 로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 에틸 아세테이트를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 생성물, 2-(테트라히드로-티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴을 회백색 고형물 (350 mg)로 수거하였다: LCMS m/z $(\text{M}+\text{H})^+ = 395.3$.

[0623]

처리 중인 생성물 (830 mg, 2.1 mmol)을 에탄올 (12 mL) 및 DMSO (3 mL)에 용해하고, 여기에 NaOH (5 N, 841 μL , 2 mol eq)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 70°C에서 밤새 가열하였다. 반응 혼합물을 H_2O 및 EtOAc 로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 에틸 아세테이트를 사용하여 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물 (490 mg)로 수득하였다: LCMS m/z $(\text{M} + \text{H})^+ = 413.2$.

[0624] 실시예 14



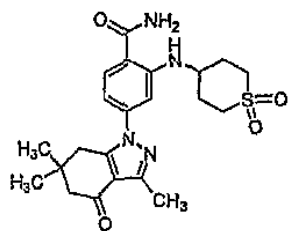
[0625]

[0626] 2-(1-옥소-헥사히드로-1-테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드 (화합물 14)

[0627]

2-(테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드를 에탄올에 용해하고, 여기에 H_2O_2 (30% 수용액 점적)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 30분 동안 교반시켰다. 생성물을 EtOAc 및 H_2O 로 추출하여 분리하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물 (20 mg)로 분리하였다: LCMS m/z $(\text{M}+\text{H})^+ = 429.2$.

[0628] 실시예 15

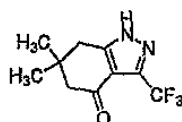


[0629]

[0630] 2-(1,1-디옥소-헥사히드로-1-테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드 (화합물 15)

[0631] 2-(테트라히드로티오피란-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)벤즈아미드 (25 mg, 0.063 mmol)를 에탄올 (1 mL)과 DMSO (0.25 mL)의 혼합물에 용해하고, 여기에 NaOH (5 N, 25 μ L, 2 mol eq) 및 H₂O₂ (과량, 30% 수용액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 70℃에서 밤새 가열하였다. 반응 혼합물을 물과 EtOAc로 세척하였다. 생성물을 용리제로 디클로로메탄과 메탄올을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물 (20 mg)로 수득하였다: LCMS m/z (M+H)⁺ = 445.2.

[0632] 실시예 16



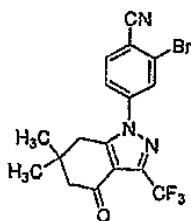
[0633]

[0634] 6,6-디메틸-3-트리플루오로메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (화합물 16)

[0635] 300 mL의 톨루엔 중의 5,5-디메틸-1,3-시클로헥산디온 (7.0 g, 49.9 mmol, 1.0 eq), p-톨루엔설폰일히드라지드 (9.3 g, 49.9 mmol, 1.0 eq.), 및 p-톨루엔설폰산의 혼합물을 환류에서 가열하였다. 30분 후에, 반응 혼합물을 냉각시키고, 50 mL의 톨루엔을 반응 혼합물에 첨가하였다. 반응을 다시 환류 가열시켰다. 1시간 후에, 반응 혼합물을 실온으로 냉각하였다. 고형물을 여과로 수거하고, 이것을 에테르로 3회 세척한 후에, 진공하에서 건조시켜, 3,3-디메틸-5-(p-톨릴설폰일히드라조노)-시클로헥사논 (14.26 g, 93%)을 옅은 황색 고형물로서 수득하였다: LC/MS (m/z) [M+H]⁺ = 309.1.

[0636] 72 mL의 테트라히드로푸란 및 24 mL의 트리에틸아민 중의 3,3-디메틸-5-(p-톨릴설폰일히드라조노)-시클로헥사논 (4.0g, 12.97 mmol, 1.0 eq.)의 용액/현탁액에 트리플루오로아세트산 무수물 (1.8 mL, 12.97 mmol, 1.0 eq.)을 첨가하였다. 진적색 반응 혼합물을 55℃에서 가열하였다. 15분 후에 반응 혼합물이 균일하게 되었다. 2시간 후, 반응 혼합물을 실온으로 냉각하였다. 메탄올 (16 mL) 및 물과 1M 염화나트륨 수용액 (16 mL)의 1:1 용액을 첨가하였다. 3시간 동안 교반시킨 후에, 반응 혼합물을 50 mL 염화암모늄 수용액으로 희석하고, 에틸 아세테이트 (3 x 50 mL)로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축하였다. 잔류물을 용리제로 에틸 아세테이트를 사용하는 실리카 겔 플러그를 통해 여과하였다. 여액을 진공에서 농축시키고, 잔류물을 에테르로 처리하였다. 고형물을 여과로 수거하고, 에테르로 세척하였다. 여액을 진공에서 농축하고, 생성되는 잔류물을 에테르로 처리하였다. 고형물을 여과로 수거하고, 에테르로 세척한 다음, 초기 고형물과 합하여, 6,6-디메틸-3-트리플루오로메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (1.24 g, 41%)을 적-오렌지색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 233.1.

[0637] 실시예 17

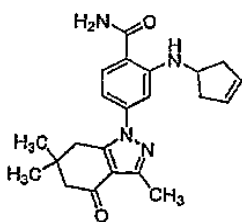


[0638]

[0639] 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (화합물 17)

[0640] 수소화나트륨 (168 mg, 7.02 mmol, 1.0 eq.) 을, 35 mL의 무수 디메틸 설펍사이드 중의 6,6-디메틸-3-트리플루오로메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (1.63 g, 7.02 mmol, 1.0 eq.)의 용액에 첨가하였다. 15분 후에, 2-브로모-4-플루오로벤조니트릴 (2.25 g, 11.23 mmol, 1.6 eq.)을 고형물로 첨가하였다. 반응 혼합물을 45℃에서 가열하였다. 23시간 후에, 반응 혼합물을 주위 온도로 냉각시키고, 10 mL의 포화 염화암모늄 수용액으로 킨칭하였다. 혼합물을 물로 희석하고, 에틸 아세테이트 (4x)로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 가열하고, 여과한 다음, 진공에서 농축하였다. 잔류물을 바이오테이지 (SiO₂, 헥산-에틸 아세테이트) 상에서 정제하여, 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (1.83 g, 63%)을 회백색 분말로서 수득하였다: LC/MS: (M+H)⁺ = 412.0.

[0641] 실시예 18



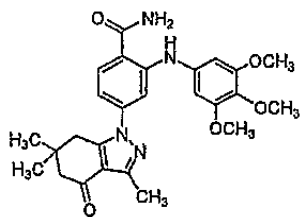
[0642]

[0643] 2-(시클로펜트-3-엔일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)벤즈아미드 (화합물 18)

[0644] 1-(2-브로모-4-시아노벤-4-일)-3,6,6-트리메틸테트라히드로인다졸-4-온 (2.0 g, 5.6 mmol), Pd(OAc)₂ (64 mg, 5 mol%), DPPF (328 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (1.13 mg, 11.2 mmol)를 20 mL 마이크로웨이브 바이얼에 첨가하였다. 톨루엔 (15 mL) 및 1-아미노-3-시클로펜텐 (11.2 mmol)을 첨가하고, 이 바이얼을 배기시킨 후 N₂로 다시 채웠다. 반응 혼합물을 120℃에서 15분 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 CH₂Cl₂로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 에틸 아세테이트를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 생성물을 회백색 고형물 (1.35 g)로 수득하였다: LCMS m/z (M+H)⁺ = 361.2.

[0645] 처리 중인 생성물 (2.71g, 7.5 mmol)을 에탄올 (20 mL) 및 DMSO (5 mL)에 용해하고, NaOH (5 N, 2.51 mL, 2 mol eq) 및 H₂O₂ (3.0 mL, 30% 수용액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 H₂O로 세척하고, EtOAc로 추출하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 에틸 아세테이트를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물 (490 mg)로 수득하였다: LCMS m/z: (M+H)⁺ = 379.2.

[0646] 실시예 19



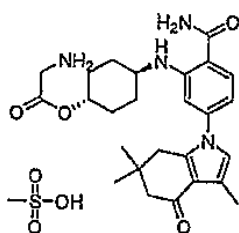
[0647]

[0648] 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시아닐리노)-벤즈아미드 (화합물 19)

[0649] 나트륨 3차-부톡사이드 (269 mg, 2.80 mmol, 2.0 eq.)를, 3.75 mL의 톨루엔 중의 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (500 mg, 1.40 mmol, 1.0 eq.), 3,4,5-트리메톡시아닐린 (513 mg, 2.80 mmol, 2.0 eq.), 팔라듐 (II) 아세테이트 (16 mg, 0.07 mmol, 0.05 eq.), 및 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (78 mg, 0.14 mmol, 0.10 eq.)의 교반시킨 용액/현탁액에 첨가하였다. 상기 반응 바이얼을 밀봉시키고, 반응 혼합물을 마이크로웨이브 조사 하의 120℃에서 20분간 가열하였다. 개별 반응 혼합물을 에틸 아세테이트로 희석하고, 합하고, 물을 사용하여 분배하였다. 층이 분리되었고, 수성 층을 에틸 아세테이트로 추출하였다. 유기 층을 합하고, 이것을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조하고, 여과하고, 진공하에서 농축시켰다. 잔류물을 바이오테이지 시스템 (SiO₂, 헥산-에틸 아세테이트) 상에서 정제하여 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시아닐리노)-벤조니트릴 (1.59 g, 82%)을 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 461.9.

[0650] 4:1 에탄올-디메틸 설펡사이드 혼합물 17 mL 중의, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시아닐리노)-벤조니트릴 (1.56 g, 3.39 mmol, 1.0 eq.)의 혼합물에 2 mL의 1 M 염화나트륨 수용액 및 2 mL의 30% 과산화수소를 첨가하였다. 3시간 후에, 반응 혼합물을 물로 희석시키고, 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하였다. 유기 층을 합하고 이것을 염수로 세척한 다음, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 진공하에서 농축시켜 표제 화합물, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시아닐리노)-벤즈아미드 (1.61 g, 99%)를 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 479.3.

[0651] 실시예 20



[0652]

[0653] 아미노-아세트산 트랜스-4-[2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6, 7-테트라히드로-인돌-1-일)-페닐아미노]-시클로헥실 에스테르; 메탄설폰산 염 (화합물 20)

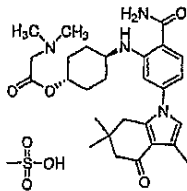
[0654] 2-(트랜스-4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드 (750.0 mg, 1.832 mmol), N-(3차-부톡시카르보) 글리신 (641.8 mg, 3.664 mmol, 2.0 eq.), 1-(3-디메틸아미노프로필)-3-에틸카르보디이미드 히드록로라이드 (702.4 mg, 3.664 mmol, 2.0 eq.) 및 촉매량의 4-디메틸아미노피리딘을 20 mL의 CH₂Cl₂에 용해하고, 이것을 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 용매를 진공 하에서 제거하고, 잔류물을 (용리제로 EtOAc로 사용하는) 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 780.5 mg (75.2% 수율)의 Boc 보호된 옅은 황색 포말 형태의 생성물을 수득하였다.

[0655] 처리 중인 생성물을 15 mL의 CH₂Cl₂에 용해하고, 이것을 얼음조에서 0℃로 냉각하였다. 그런 다음, 15 mL의 트리플루오로아세트산을 첨가하고, 반응 혼합물을 0℃에서 5분 동안 그리고 실온에서 30분 동안 교반하였다. 트

리플루오로아세트산 및 CH_2Cl_2 를 진공에서 제거하고, 잔류물을 물에 용해하였다. 수용액을 포화 탄산나트륨 수용액을 첨가하여 염기성화하였다. 수용액을 EtOAc (3x)로 추출하고, 유기물을 합한 다음, 이것을 물로 세척하고 Na_2SO_4 상에서 건조시켰다. 진공하에서 용매를 제거하여 569.7 mg (커플링 및 탈보호를 통해 66.6% 수율)의 회백색 포말을 수득하고, 이것을 LC/MS로 분석하여 순수 생성물을 확인하였다 (m/z : (M+H)= 467.3). 이후, 이 유리 염기를 CH_2Cl_2 에 용해하여 메실레이트 염으로 전환시키고, 메탄설폰산 1 당량을 적가한 후에 실온에서 1시간 동안 교반하였다. 진공 하에서 용매를 제거하여, 680.7 mg의 표제 화합물을 회백색 분말로 수득하였다.

[0656]

실시예 21



[0657]

[0658]

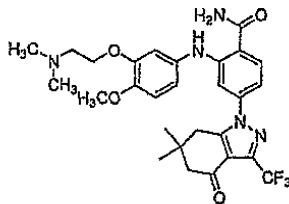
디메틸아미노-아세트산 트랜스-4-[2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-페닐아미노]-시클로헥실 에스테르; 메탄설폰산 염 (화합물 21)

[0659]

N-(3차-부톡시카르보닐) 글리신을 디메틸아미노-아세트산으로 대체하고 실시예 20의 과정을 이용하여 표제 화합물을 수득하였다: LCMS m/z : (M+H) = 495.2.

[0660]

실시예 22



[0661]

[0662]

2-[3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아미노]-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 22)

[0663]

디메틸포름아미드 (150mL) 중의 2-메톡시-5-니트로-페놀 (10 g), (2-클로로-에틸)-디메틸-아민 히드로클로라이드 (9.37 g)의 용액에 질소 하 실온에서 서서히 NaH (2.98 g)를 첨가하였다. 그런 다음, 이 혼합물을 5시간 동안 오일조에서 가열하면서 140℃에서 교반하였다. 반응을 농축 건조시키고, 2M HCl (200 mL)에 용해시키고, 에틸 아세테이트 (2 x 100 mL)로 세척하였다. 수성 층을 K_2CO_3 로 염기성화하고, 디클로로메탄 (3 x 200 mL) 및 에틸 아세테이트 (2 x 100 mL)로 추출하고, Na_2SO_4 상에서 건조시키고, 여과한 후에, 농축시켜, [2-(2-메톡시-5-니트로-페녹시)-에틸]-디메틸아민 (9.17 g, 65% 수율)을 수득하였다: LCMS (m/z) M+H: 241.1.

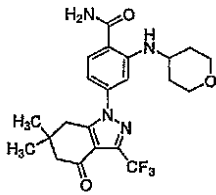
[0664]

처리 중인 생성물 (10.53 g) 및 10% Pd/C (1 g)를 EtOH (200 mL)와 혼합하고, 50 psi에서 밤새 수소첨가하였다. 반응 혼합물을 셀라이트 플러그를 통해 여과하고, 필터 케이크를 MeOH로 세척하였다. 여액을 농축 건조시켜, 3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아민 (9.05 g, 98% 수율)을 수득하였다. LCMS (m/z) M+H: 211.2.

[0665]

2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (500 mg, 1 eq), 3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아민 (306 mg, 1.2 eq), $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ (14 mg), DPPF (66 mg), 및 NaOtBu (214 mg, 2 eq)를 톨루엔 (5 mL) 중에서 혼합하고, 이것을 25분 동안 140℃에서 마이크로웨이브 조사로 가열하였다. 그런 다음, 10 mL의 EtOH(4)/ H_2O (1)를 첨가하고 나서, NaOH (700 mg, 2 eq) 및 H_2O_2 (1 mL)를 첨가하였다. 혼합물을 15분 동안 100℃에서 마이크로웨이브 조사로 가열한 다음 농축 건조시키고, 용리제로 디클로로메탄 중의 20% EtOH를 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하여, 표제 화합물 (480 mg, 71% 2 단계 수율)을 수득하였다. LCMS (m/z): M+H = 560.3.

[0666] 실시예 23



[0667]

[0668] 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (화합물 23)

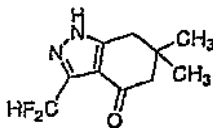
[0669]

4-아미노테트라히드로피란 (245 mg, 2.42 mmol, 2.0 eq) 및 나트륨 3차-부톡사이드 (233 mg, 2.42 mmol, 2.0 eq)를, 3.75 mL의 톨루엔 중의 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (500 mg, 1.21 mmol, 1.0 eq), 팔라듐 (II) 아세테이트 (14 mg, 0.06 mmol, 0.05 eq) 및 DPPF (67 mg, 0.12 mmol, 0.10 eq)의 교반시킨 용액/현탁액에 첨가하였다. 반응 바이얼을 밀봉시키고, 반응 혼합물을 마이크로웨이브 조사 하 120℃에서 20분 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 물 및 에틸 아세테이트로 희석시키고 합하였다. 층이 분리되었고, 수성 층을 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하였다. 유기 층을 합하고, 이것을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과한 후에, 진공하에서 농축시켰다. 잔류물을 바이오 테이지 시스템 (SiO₂, 헥산-에틸 아세테이트) 상에서 정제하여, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤조니트릴 (772 mg, 49 %)을 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 433.7. 에틸 아세테이트로 추가로 용리시켜, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (713 mg, 44%)를 황색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 451.2.

[0670]

10 mL의 4:1 에탄올-디메틸 설폭사이드 중의 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤조니트릴 (772 mg, 1.79 mmol, 1.0 eq)의 용액/현탁액에 1 mL의 1M 염화나트륨 수용액 및 1 mL의 30% 과산화수소를 첨가하였다. 30분 후에, 반응 혼합물을 물로 희석하고, 에틸 아세테이트 (4x)로 추출하였다. 유기 층을 합하고, 이것을 염수로 세척한 다음, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 진공하에서 농축시켜, 표제 화합물, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (788 mg, 98%)를 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 451.2.

[0671] 실시예 24



[0672]

[0673] 3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (화합물 24)

[0674]

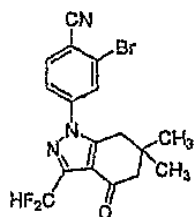
톨루엔 (450 mL) 중의 5,5-디메틸-시클로헥산-1,3-디온 (10 g), p-톨루엔설포닐히드라지드 (13.3 g) 및 p-톨루엔설포산 (140 mg)의 혼합물을 0.5시간 동안 환류하였다. 그런 다음, 100 mL의 톨루엔을 첨가하고, 혼합물을 다른 1시간 동안 환류하였다. 혼합물을 실온으로 냉각시키고, 여과하고, 고형물을 에테르 (3 x 200 mL)로 세척하고, 완전히 건조시켜, 히드라존을 고형물 (20.4 g, 92.7%)로 수득하였다. LCMS M+H: 309.1 (MW: 308). 이것을 추가 정제 없이 후속 단계에 사용한다.

[0675]

처리 중인 생성물 (8.86 g)을 테트라히드로푸란 (100 mL)과 트리에틸아민 (30 mL)의 혼합물 중에 용해하고 질소 하에 위치시킨 다음, 교반하면서 디플루오로아세트산 무수물 (5 g)을 서서히 첨가한 후에, 이 혼합물을 밤새 55℃로 가열하였다. 혼합물을 실온으로 냉각시키고, MeOH (35.5 mL)를 첨가하고, 35.5 mL의 H₂O와 1N NaOH의 1:1 혼합물을 첨가하였다. 혼합물을 실온에서 3시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 포화 NH₄Cl 수용액 (120 mL)으로 희석시키고, 에틸 아세테이트 (4 x 150 mL)로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 여과한 후에, 농축시

키고, 용리제로 에틸 아세테이트와 헥산을 사용하는 컬럼 크로마토그래피로 정제하여 3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (3.12 g, 50.6%)을 수득하였다: LCMS (M+H): 215.1 (MW: 214).

[0676] 실시예 25

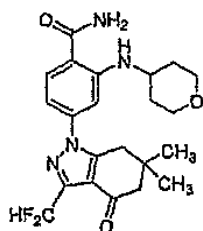


[0677]

[0678] 2-브로모-4-(3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (화합물 25)

[0679] NaH (350 mg)를 실온에서 DMSO (75 mL) 중의 3-디플루오로메틸-6,6-디메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (3.12 g)의 용액에 첨가하였다. 20분 동안 교반시킨 후에, 2-브로모-4-플루오로벤조니트릴 (4.67 g)을 첨가하고, 이를 45°C에서 밤새 교반하였다. 반응을 포화 NH₄Cl 수용액 (100 mL), H₂O (100 mL)로 희석하였다. 이 혼합물을 에틸 아세테이트 (4 x 150 mL)로 추출하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시킨 후에, 용리제로 에틸 아세테이트/헥산의 1:2의 혼합물을 사용하는 컬럼 크로마토그래피로 정제하였다. 목적하는 분획의 농축물을 에테르 중의 슬러리로 제조하고, 이것을 2시간 동안 교반하고, 여과하고, 헥산으로 세척하여, 순수 고형물 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (2.82 g, 49.2%)을 수득하였다. LCMS m/z: (M+H) = 395.65, (MW: 394).

[0680] 실시예 26



[0681]

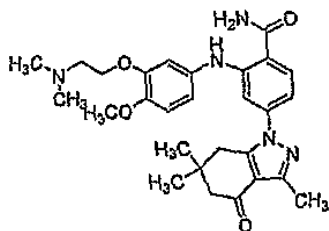
[0682] 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (화합물 26)

[0683] 하기 반응을 300 mg 규모에서 수행하고, 500 mg 규모에서는 2회 수행하였다: 4-아미노테트라히드로피란 (154 mg, 1.52 mmol, 2.0 eq.) 및 나트륨 3차-부톡사이드 (146 mg, 1.52 mmol, 2.0 eq.)을, 톨루엔 (2.25 mL) 중의 2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (300 mg, 0.76 mmol, 1.0 eq.), 팔라듐 (II) 아세테이트 (8.5 mg, 0.04 mmol, 0.05 eq.) 및 1,1'-비스(디페닐포스포노)페로센 (42 mg, 0.08 mmol, 0.1 eq.)의 교반시킨 용액/현탁액에 첨가하였다. 반응 바이얼을 밀봉시키고, 반응 혼합물을 마이크로웨이브 조사의 120°C에서 20분간 가열하였다. 이 반응 혼합물을 물 및 에틸 아세테이트로 희석시키고, 합하였다. 층이 분리되었고, 수성 층을 에틸 아세테이트 (3x)로 추출하였다. 합한 유기 층을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축시켰다. 잔류물을 바이오테이지 시스템 (SiO₂, 헥산-에틸 아세테이트) 상에서 정제하여, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤조니트릴 (897 mg, 65 % 수율)을 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 415.2. 에틸 아세테이트로 추가로 용리시켜 표제 화합물, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (131 mg, 9%)를 황색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z): [M+H]⁺ 433.3.

[0684] 10.8 mL의 에탄올-디메틸 설폭사이드의 4:1 혼합물 중의 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤조니트릴 (897 mg, 2.16 mmol, 1.0 eq)을 1 mL의 1M 염화나트륨 수용액 및 1 mL의 30% 과산화수소를 첨가하였다. 30분 후에, 반응 혼합물을 물로 희석시키고,

에틸 아세테이트로 세척하였다. 유기 층을 합하고, 이것을 염수로 세척하고, 황산나트륨 상에서 건조시키고, 여과하고, 진공에서 농축시켜, 표제 화합물, 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-디플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (869 mg, 93%)를 황갈색 고형물로 수득하였다: LC/MS (m/z) : $[M + H]^+$ 433.3.

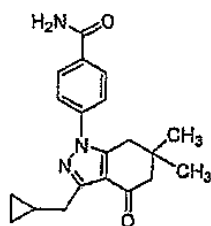
실시예 27



2-[3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 27)

2-브로모-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일) -벤조니트릴 (100 mg, 0.28 mmol), $Pd(OAc)_2$ (3.1 mg, 5 mol%), DPPF (15.5 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (52 mg, 0.56 mmol)를 마이크로웨이브 용기에 첨가하였다. 톨루엔 (0.5 mL) 및 3-(2-디메틸아미노-에톡시)-4-메톡시-페닐아민 (118 mg, 2 mol eq)을 첨가하고, 상기 바이얼을 배기시키고 질소로 재충전하였다. 반응 혼합물을 130℃에서 30분간 (마이크로웨이브) 가열하였다. 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 CH_2Cl_2 로 세척하였다. 생성물 니트릴을 용리제로 CH_2Cl_2 및 메탄올을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 이 니트릴 (32 mg, 0.66 mmol)을 에탄올 (0.8 mL) 및 DMSO (0.2 mL)에 용해시키고, 여기에 NaOH (5 N, 26 μ L, 2 eq) 및 H_2O_2 (과량, 30% 수용액)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 실온에서 1시간 동안 교반시켰다. 반응 혼합물을 H_2O 로 세척하고 EtOAc로 추출하였다. 생성물을 용리제로 CH_2Cl_2 및 메탄올을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 황색 고형물로 수득하였다 (10 mg, 30%); LC/MS (m/z): $M+H = 506.5$.

실시예 28



4-(3-시클로프로필메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 28)

5,5-디메틸-1,3-시클로헥산디온 (1.051 g, 7.5 mmol, 1.5 eq), 시클로프로필아세트산 (500.6 mg, 5.0 mmol), 및 4-디메틸아미노피리딘 (916.3 mg, 7.5 mmol, 1.5 eq)을 10 mL의 CH_2Cl_2 에 용해하고, 이것을 얼음조에서 0℃로 냉각시켰다. 5 mL의 CH_2Cl_2 중의 N,N'-디시클로헥실카르보디이미드 (1.238 g, 16.0 mmol, 1.2 eq)의 용액을 2분에 걸쳐 상기 시클로헥산디온 용액에 적가하였다. 이후, 반응 혼합물을 0℃에서 10분 동안 그리고 실온에서 16시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 여과하고, 여액을 컬럼 크로마토그래피 (헥산 내지 30% EtOAc/헥산)로 정제하여, 1.022 g (92% 수율)의 2-(2-시클로프로필-아세틸)-5,5-디메틸-시클로헥산-1,3-디온을 옅은 황색 오일로서 수득하였다.

2-(2-시클로프로필-아세틸)-5,5-디메틸-시클로헥산-1,3-디온 (111.1 mg, 0.5 mmol) 및 4-시아노페닐히드라진 히드로클로라이드 (84.8 mg, 0.5 mmol, 1.0 eq)를 4 mL의 3:1 EtOH:AcOH에 현탁시키고, 이것을 100℃에서 10분 동안 마이크로웨이브 조사 처리하였다. 용매를 진공에서 제거하고, 생성되는 잔류물을 컬럼 크로마토그래피로

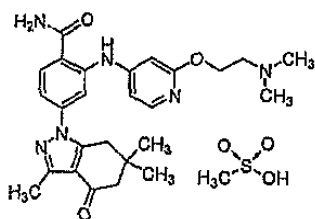
정제하여 81.8 mg (51% 수율)의 4-(3-시클로프로필메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴을 회백색 분말로 수득하였다.

[0694]

니트릴을 10 mL의 4:1 EtOH-DMSO에 용해한 후에, 대략 0.1 mL의 1N NaOH (aq.) 및 0.1 mL의 30% H₂O₂ (aq.)를 첨가하고, 이 용액을 1.5시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 염수에 붓고, EtOAc (x3)로 추출하고, 유기물을 합한 후에, 이것을 염수 (x2)로 세척하였다. 유기 추출물을 Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 진공에서 농축시켜, 73.2 mg (43% 수율)의 4-(3-시클로프로필메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드를 회백색 고형물로 수득하였다. LCMS (m/z) : M+H = 339.4.

[0695]

실시예 29



[0696]

[0697]

2-[2-(2-디메틸아미노-에톡시)-피리딘-4-일아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드, 메탄설폰산 염 (화합물 29)

[0698]

2-클로로-4-니트로피리딘 (5.3 g, 33.43 mmol) 및 N,N-디메틸에탄올아민 (8 mL)을 압력관 내에서 밀봉시키고, 이것을 110°C에서 24시간 동안 교반시켰다. 이후, 반응 혼합물을 농축시키고, 감압 하에서 건조시켜 과량의 N,N-디메틸에탄올아민을 제거하였다. 생성되는 황색 잔류물을 1N HCl로 희석시키고, 2-클로로-4-니트로피리딘으로 확인된 황색 고형물을 여과로 수거하였다. 이 산성의 수용액을 EtOAc (x2)로 세척하고, 3N NaOH를 첨가하여 염기성으로 만든 후에, EtOAc (x4)로 추출하였다. 유기물을 합하고, 이것을 Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 용매를 진공에서 제거하여, 3.55 g (50.3% 수율)의 N,N-디메틸-N'-(4-니트로-피리딘-2-일)-에탄-1,2-디아민을 오렌지색 고형물로 수득하였다.

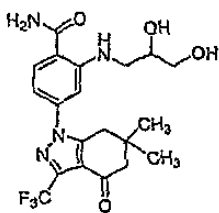
[0699]

이 생성물 (3.55 g, 16.807 mmol)을 60 mL의 에탄올에 용해하였다. 약 5점적의 진한 HCl을 첨가하고, Pd/C (10% wt)의 스패툴라 팁 (spatula tip)을 첨가하였다. 반응 용기를 수소가 충전된 질소로 퍼징시키고 3회 배기시킨 후에, 수소로 60 psi의 압력으로 채웠다. 3시간 동안 실온에서 진탕시킨 후에, 니트로 기의 완전한 환원을 LC/MS로 확인하였다. 반응 혼합물을 셀라이트를 통해 여과하고, 진공 하에서 용매를 제거하였다. 이후, 잔류물을 EtOAc에 용해하고, 포화 NaHCO₃ 수용액, 물 및 염수로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시켰다. 진공에서 용매를 제거한 후에, 왁스 상태의 적색 고형물인 2.95 g (2단계에 걸쳐 48.7% 수율)의 2-(2-디메틸아미노-에톡시)-피리딘-4-일아민을 수득하였다.

[0700]

2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (358.2 mg, 1.0 mmol), 2-(2-디메틸아미노-에톡시)-피리딘-4-일아민 (362.5 mg, 2.0mmol, 2.0 eq.), 팔라듐 (II) 아세테이트 (11.2 mg, 5 mol%), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (55.4 mg, 10 mol%), 및 나트륨 3차-부톡사이드 (192.2 mg, 2.0 mmol, 2.0 eq.)를 4 mL의 톨루엔에 현탁시켰다. 반응 혼합물을 120°C에서 20분간 마이크로웨이브 조사 처리하였다. 반응 혼합물을 냉각시킨 후에, 용매를 감압하에서 제거하고, 잔류물을 물로 희석시켰다. 수성 현탁액을 EtOAc로 3회 추출하고, 유기물을 합하고, 이것을 염수로 세척하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 감압하에서 농축시켰다. 중간체 니트릴 및 목적하는 아미드를 수거하고, 컬럼 크로마토그래피 (EtOAc/MeOH)한 후에 합하고, 20 mL의 4:1 EtOH/DMSO에 용해시켰다. 5점적의 1N NaOH 및 5점적의 30% H₂O₂를 첨가하고, 반응 혼합물을 실온에서 2시간 동안 교반하였다. 이 용액을 물로 희석시키고, EtOAc (x3)로 추출한 다음, 유기물을 합하고, 이것을 염수로 세척하고 (x2), Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 감압 하에서 농축시켰다. 생성된 잔류물을 컬럼 크로마토그래피 (EtOAc/MeOH)로 정제하여, 347.3 mg (72.9% 수율)의 핑크색 거품을 수득하였다. 이것을 CH₂Cl₂에 용해시키고, 실온에서 1시간 동안 교반시키면서 1 당량의 메탄설폰산으로 처리하였다. 혼합물을 감압 하에서 증발시켜 표제 화합물을 수득하였다. LCMS m/z (M+H) = 477.3.

[0701] 실시예 30



[0702]

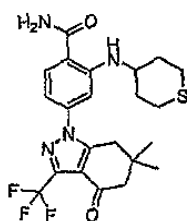
[0703] 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 30)

[0704] DMSO (10 mL) 중의 2,4-디플루오로-벤조니트릴 (1.39 g, 10 mmol), 3-아미노-프로판-1,2-디올 (0.911 g, 10 mmol) 및 에틸-디이소프로필-아민 (1.74 mL)의 혼합물을 200℃에서 7분 동안 마이크로웨이브 조사 처리하였다. 그런 다음, 반응 혼합물을 포화 NH₄Cl 수용액 (100 mL)에 붓고, EtOAc (3 x 100 mL)로 추출한 다음, Na₂SO₄로 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 미정제 혼합물을 플래쉬 실리카 겔 크로마토그래피 (EtOAc-헥산 1:1)로 정제하여, 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-플루오로-벤조니트릴 (0.87 g, 41.4% 수율)을 수득하였다. LCMS (m/z): M+H = 211.

[0705] 디메틸 아세트아미드 (20 mL) 중의 6,6-디메틸-3-트리플루오로메틸-1,5,6,7-테트라히드로-인다졸-4-온 (0.961 g, 4.14 mmol, 1 eq) 및 NaH (99 mg, 4.14 mmol, 1 eq)의 혼합물에 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-플루오로-벤조니트릴 (0.87 g, 4.14 mmol, 1 eq)을 서서히 첨가하였다. 이후, 이 반응 혼합물을 150℃에서 밤새 교반시키고, 냉각하고, 포화 NH₄Cl 수용액 (100 mL)에 붓고, EtOAc (3 x 150 mL)로 추출하고, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 여과하고 농축시켰다. 미정제 생성물을 용리제로 EtOAc를 사용하는 플래쉬 실리카 겔 크로마토그래피로 정제하여 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (1.7g, 97% 수율)을 수득하였다. LCMS (m/z): M+H = 423.

[0706] 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (1.7 g, 4 mmol, 1 eq), NaOH (806 mg, 20 mmol, 5 eq), 및 H₂O₂ (3 mL)를 EtOH-물 (4:1) (40 mL)에 용해하였다. 이 혼합물을 120℃에서 15분간 마이크로웨이브 조사 처리하고 나서, 농축 건조시키고, 용리제로 EtOAc 중의 10% MeOH를 사용하는 플래쉬 실리카 겔 크로마토그래피로 정제하여, 순수한 2-(2,3-디히드록시-프로필아미노)-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (0.52 g, 29% 수율)를 수득하였다. LCMS (m/z): M+H = 441.

[0707] 실시예 31



[0708]

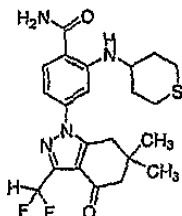
[0709] 4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-티오피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (화합물 31)

[0710] 1-(2-브로모-4-시아노펜-4-일)-3-트리플루오로메틸-6,6-디메틸테트라히드로인다잘-4-온 (313 mg, 0.76 mmol), Pd(OAc)₂ (8.7 mg, 5 mol%), DPPF (44.5 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (153 mg, 1.52 mmol)를 마이크로웨이브 바이얼에 첨가하였다. 톨루엔 (1 mL) 및 4-아미노테트라히드로티오피란 (116 mg, 1.3 mol eq)을 첨가하고, 이 바이얼을 배기시키고, N₂로 다시 채웠다. 반응 혼합물을 130℃에서 20분간 가열하였다 (마이크로웨이브). 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 CH₂Cl₂로 세척하였다. 생성물을 헥산 및 EtOAc을 용리제로 사용하는 플래쉬 크로마

토그래피로 정제하였다. 생성물이 회백색 고형물 (23 mg, 7%)로 회수되었다: LCMS (M+H)⁺ = 449.4

[0711] 이 피라졸 (23 mg, 0.05 mmol)을 에탄올 (0.8 mL) 및 DMSO (0.2 mL)에 용해하고, 여기에 NaOH (5 N, 21 μ L, 2 mol eq)를 첨가하고, 반응 혼합물을 70℃에서 12시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 물 및 EtOAc로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 EtOAc을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물 (16 mg, 67%)로 수득하였다; LC/MS (m/z) : M+H = 467.2.

[0712] 실시예 32

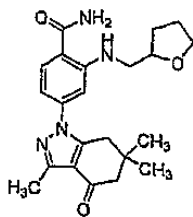


[0713]

[0714] 4-(3-(디플루오로메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-티오피란-4-일아미노)-벤즈아미드 (화합물 32)

[0715] 2-브로모-4-(3-(디플루오로메틸-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (300 mg, 0.76 mmol), Pd(OAc)₂ (8.7 mg, 5 mol%), DPPF (44.5 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (153 mg, 1.52 mmol)를 마이크로웨이브 바이얼에 첨가하였다. 톨루엔 (1 mL) 및 4-아미노테트라히드로티오피란 (116 mg, 1.3 mol eq)을 첨가하고, 바이얼을 배기시키고 질소로 다시 채웠다. 반응 혼합물을 120℃에서 15분간 가열하였다 (마이크로웨이브). 반응 혼합물을 여과하고, 고형물을 CH₂Cl₂로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 EtOAc을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 생성물을 회백색 고형물 (70 mg, 21%)로 수거하였다. 처리 중인 생성물 피라졸 (70 mg, 0.16 mmol)을 에탄올 (0.8 mL) 및 DMSO (0.2 mL)에 용해하고, 여기에 NaOH (5 N, 65 mL, 2 eq)를 첨가하고, 반응 혼합물을 70℃에서 12시간 동안 가열하였다. 반응 혼합물을 H₂O 및 EtOAc로 세척하였다. 생성물을 용리제로 헥산 및 EtOAc을 사용하는 플래쉬 크로마토그래피로 정제하였다. 표제 화합물을 회백색 고형물로 수득하였다 (40 mg, 56% 수율), LC/MS (m/z): M+H = 449.2.

[0716] 실시예 33



[0717]

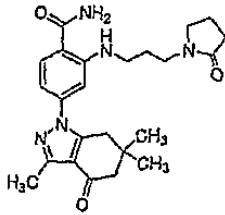
[0718] 2-[(테트라히드로-푸란-2-일메틸)-아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 33)

[0719] 2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (1.0 mmol, 358 mg), 팔라듐 아세테이트 (0.13 mmol, 30 mg), 1,1'-비스 (디페닐포스피노)페로센 (0.1 mmol, 56 mg), 나트륨 t-부톡사이드 (2 mmol, 192 mg), 톨루엔 (2 mL), 및 2-(아미노메틸)테트라히드로푸란 (3 mmol, 0.31 mL)을 마이크로웨이브 관에서 합하고, 간단히 교반시키고 나서, 고흡수로 설정된 개인 화학 마이크로웨이브에서 110℃로 900초 동안 가열하였다. 냉각 후에, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트 (200 mL)에 용해하고, 물 (50 mL)로 세척하였다. 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피시켜, 목적하는 니트릴 중간체를 황갈색 고형물 (305 mg, 81% 수율)로 수득하였다.

[0720] DMSO (6 점적) 및 에탄올 (4 mL)을 상기 니트릴 (0.79 mmol, 300 mg)에 첨가하였다. 플라스크를 50℃ 오일조에서 냉각시키고, KOH (5.8 mmol, 325 mg)를 첨가한 후에, 30% 과산화수소 (약 10 mmol, 1 mL)를 첨가하였다. 45분 후에, 반응물을 에틸 아세테이트 (100 mL)에 용해하고 물 (50 mL)로 세척하였다. 유기 층을 황산마그네슘

상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피하여 표제 화합물을 백색 고형물 (313 mg, 100% 수율)로 수득하였다. LCMS (m/z) : M+H = 397.3.

[0721] 실시예 34

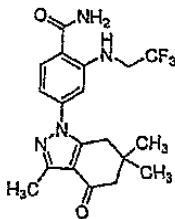


[0722] 2-[3-(2-옥소-피롤리딘-1-일)-프로필아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 34)

[0724] 2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (1.0 mmol, 358 mg), 팔라듐 아세테이트 (0.13 mmol, 30 mg), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (0.1 mmol, 56 mg), 나트륨 t-부톡사이드 (2 mmol, 192 mg), 톨루엔 (2 mL), 및 N-(3-아미노프로필)-2-피롤리딘 (2 mmol, 0.28 mL)을 2-5 mL 마이크로웨이브 관에서 합하고, 이것을 간단히 교반시키고, 고흡수로 설정된 개인 화학 마이크로웨이브에서 110℃로 900초 동안 가열하였다. 냉각 후에, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트 (200 mL)에 용해하고, 물 (25 mL)로 세척하였다. 수성 층을 추가의 에틸 아세테이트 (200 mL)로 추출하고, 유기 상을 합한 다음, 이것을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피시켜, 목적하는 니트릴 중간체를 황갈색 고형물 (258 mg, 61% 수율)로 수득하였다.

[0725] DMSO (0.1 mL) 및 에탄올 (4 mL)을 상기 니트릴 (0.60 mmol, 250 mg)에 첨가하였다. 플라스크를 50℃ 오일조에서 냉각시키고, KOH (4.5 mmol, 255 mg)를 첨가한 후에, 30% 과산화수소 (약 10 mmol, 1 mL)를 첨가하였다. 30분 후에, 반응물을 에틸 아세테이트 (100 mL)에 용해하고 물 (50 mL)로 세척하였다. 수성 층을 추가의 에틸 아세테이트 (100 mL)로 추출하였다. 유기 층을 합하고 이것을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피하여 표제 벤즈아미드를 백색 고형물 (187 mg, 71% 수율)로 수득하였다: LCMS (m/z): M+H = 438.2.

[0726] 실시예 35



[0727] 2-(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드 (화합물 35)

[0729] 2-브로모-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤조니트릴 (2.0 mmol, 714 mg), 팔라듐 아세테이트 (0.13 mmol, 60 mg), 1,1'-비스(디페닐포스피노)페로센 (0.2 mmol, 112 mg), 나트륨 t-부톡사이드 (4 mmol, 384 mg), 톨루엔 (4 mL), 및 2,2,2-트리플루오로에틸아민 (8 mmol, 0.63 mL)을 2-5 mL 마이크로웨이브 관에서 합하고, 이것을 간단히 교반시키고, 고흡수로 설정된 개인 화학 마이크로웨이브에서 110℃로 900초 동안 가열하였다. 냉각 후에, 반응 혼합물을 에틸 아세테이트 (200 mL)에 용해하고, 물 (25 mL)로 세척하였다. 유기 상을 황산마그네슘 상에서 건조시키고, 여과하고, 농축시켰다. 잔류물을 크로마토그래피시켜, 예상되는 2-(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인다졸-1-일)-벤조니트릴 (346 mg, 50%)을 황갈색 고형물로서, 그리고 목적하는 궁극적인 생성물인 2-(2,2,2-트리플루오로-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드를 황갈색 고형물 (77 mg, 10%)로 수득하였다: LCMS (m/z): M+H = 395.1.

[0730]

실시예 36

[0731]

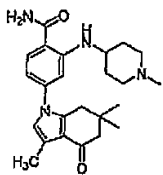
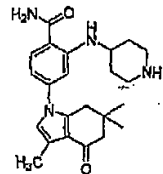
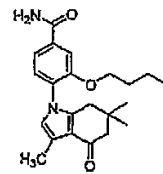
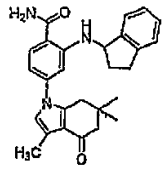
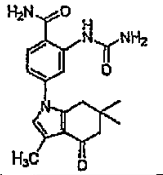
하기 화합물을 본질적으로 상기 반응식 1 내지 4 및 상기 실시예에 기재된 과정에 따라 제조하였다:

화합물 번호	구조	화합물명
36		2-(알릴아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 324.1
37		2-(시클로프로필아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 324.1
38		2-(2-메톡시에틸아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 342.1
39		4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 269.1
40		4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 297.1
41		4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 360.1
42		2-(트랜스-4-히드록시시클로헥실아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 382.2

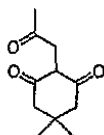
[0732]

43		4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-2-(3,4,5-트리메톡시페닐아미노)벤즈아미드; M+H = 450.2
44		2-(2-(디메틸아미노)에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 383.2
45		2-(2-(디메틸아미노)에틸아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 355.2
46		2-(피리딘-4-일메틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 403.2
47		4-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-2-(피리딘-3-일메틸아미노)벤즈아미드; M+H = 375.1
48		3차-부틸 4-(2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)페닐아미노)피페리딘-1-카르복실레이트; M+H = 495.2
49		2-아미노-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 312.1
50		2-(알릴아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 352.2

[0733]

51		2-(1-메틸피페리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 409.2
52		2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 395.2
53		3-부톡시-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 369.2
54		2-(2,3-디히드로-1H-인덴-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드; M+H = 428.2
55		1-(2-카르바모일-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)페닐)우레아 M+H = 355.1

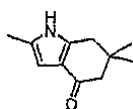
실시예 37



5,5-디메틸-2-(2-옥소프로필)시클로헥산-1,3-디온 (화합물 56)

개방형의 건조된 플라스크에 수소화나트륨 (3.61 g, 142.7 mmol)을 넣고, 여기에 200 mL의 무수 DMF를 첨가하였다. 이 플라스크를 얼음조에서 냉각시킨 후에, 100 mL DMF 중의 5,5-디메틸-1,3-시클로헥산디온 (20.0 g, 142.7 mmol) 및 클로로아세톤 (11.36 mL, 142.7 mmol)을 조절된 방식으로 첨가하였다. 반응물을 실온으로 냉각시키고 3시간 동안 교반하였다. 포화 NH₄Cl을 첨가하고, 혼합물을 EtOAc로 수회 세척하였다. 유기 층을 합하고, 이것을 MgSO₄ 상에서 건조시키고 여과한 다음, 용매를 진공에서 제거하였다 (40℃ 미만). LCMS m/z M+H = 197.1.

실시예 38



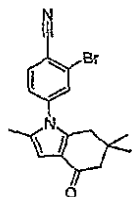
2,6,6-트리메틸-6,7-디히드로-1H-인돌-4(5H)-온 (화합물 57)

실시예 37로부터의 미정제 트리-케톤을 300 mL의 아세트산에 용해하고, 여기에 암모늄 아세테이트 (55 g, 0.714

mmol)를 첨가하였다. 반응 혼합물을 모든 출발 물질이 사라질 때까지 (2 내지 3시간) 65℃에서 가열하고, 실온으로 냉각하고, H₂O를 첨가하고 EtOAc로 세척하였다. 유기 층을 포화 NaHCO₃ (x 3), 염수 (x 1)로 세척하고, MgSO₄ 상에서 건조시켰다. 용매를 진공에서 제거하고, 오일 잔류물을 실리카 플러그를 통과시켰다. 적당한 분획을 수거하고 용매를 제거하였다. 생성되는 고형물을 EtOAc 및 헥산으로 세척하였다 (헥산이 너무 많이 첨가되면, EtOAc가 첨가된 후에 용액으로부터 침전되는 물질은 점착성이 될 것이다. 이 점을 개선시키기 위해 간단히 적은 양의 EtOAc를 첨가한다). 고형물을 여과하고, 헥산으로 세척하였다. 용매를 제거하여 더욱 많은 양의 고형물을 수거하고, 이 과정을 반복하였다: LCMS m/z M+H = 178.1. 대략 5 g의 황갈색 고형물이 수거되었는데, 이것은 2,6,6-트리메틸테트라히드로인돌-4-온으로 확인되었다.

[0743]

실시예 39



[0744]

[0745]

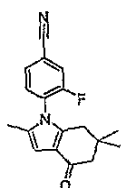
2-브로모-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조니트릴 (화합물 58)

[0746]

피롤(2,6,6-트리메틸테트라히드로인돌-4-온) (1.5 g, 8.5 mmol) 및 2-브로모-4-플루오로벤조니트릴 (1.69 g, 8.5 mmol)을 무수 DMF (50 mL)에 용해하였다. 여기에, NaH (95%, 408 mg, 17.0 mmol)를 첨가하고, 50℃에서 1 시간 동안 교반하였다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고 H₂O를 첨가하였다. 용액으로부터 생성물이 침전되고, 이를 여과한 다음 진공에서 건조시켰다 (2.4 g, 79%). (LCMS에 의해 100% 정제, 생성물 M+H = 357).

[0747]

실시예 40



[0748]

[0749]

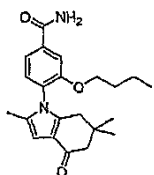
3-플루오로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조니트릴 (화합물 59)

[0750]

피롤(2,6,6-트리메틸테트라히드로인돌-4-온)(1.0 g, 5.6 mmol) 및 3,4-디플루오로벤조니트릴 (785 mg, 5.6 mmol)을 무수 DMF (20 mL)에 용해하였다. 여기에 NaH (95%, 270 mg, 11.2 mmol)를 첨가하고, 이를 50℃에서 30분 동안 교반시켰다. 반응 혼합물을 실온으로 냉각하고, 이것을 H₂O 및 EtOAc로 세척하였다. 유기 층을 MgSO₄ 상에서 건조시켰다. 용리제로 EtOAc-헥산 (1:1)을 사용하는 실리카 상에서의 컬럼 크로마토그래피로 생성물을 황색 고형물 (LCMS에 의해 100% 정제, 생성물 M+H = 397.1)로 수득하였다.

[0751]

실시예 41



[0752]

[0753]

3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드 (화합물 60)

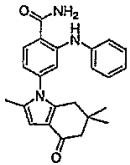
[0754]

3-플루오로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴 (148 mg, 0.5 mmol) 및 1-부탄올 (185.3 mg, 2.5 mmol)을 무수 DMF (1.5 mL)에 용해하였다. 이 용액에 NaH (24.0 mg, 1 mmol)를 첨가하였다. 반응 용기 (개인 화학 마이크로웨이브 바이얼)에 질소를 퍼징시키고, 반응 용기를 밀봉시킨 후에 에미르스 옵티마이저 마이크로웨이브 (Emrys Optimizer Microwave) 중에서 300초 동안 100℃로 가열하였다. 냉각 후

에, 반응 혼합물을 H₂O로 희석하고, EtOAc (x2)로 추출하였다. 유기물을 합하고, 이것을 염수 (x2)로 세척한 후에, Na₂SO₄ 상에서 건조시키고, 농축 건조시켰다. 그런 다음, 황색 잔류물 (3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴)을 EtOH (3 mL)에 용해하고, 이것을 1 mL의 1N NaOH (aq) 및 촉매량의 H₂O₂로 처리하였다. 니트릴의 아미드로의 정량적인 전환은 상기 용액을 65℃에서 3시간 동안 가열 시킨 후에 일어났다. 용리제로 EtOAc를 사용하는 실리카 상에서의 컬럼 크로마토그래피에 의해 생성물이 백색 고형물 (119.9 mg, 65%)을 수득하였다. (LC/MS에 의해 100% 정제 LC/MS, product M+H = 369.2).

[0755]

실시예 42



[0756]

2-(페닐아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드 (화합물 61)

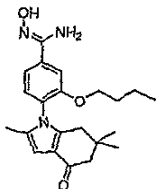
[0757]

[0758]

2-브로모-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴 (107.2 mg, 0.3 mmol), 아닐린 (111.8 mg, 1.2 [pi]unol) Pd(OAc)₂ (10.1 mmol, 5 mol%), DPPF (16.6 mg, 10 mol%) 및 NaOtBu (57.7 mg, 0.6 mmol)를 개인 화학 마이크로웨이브 바이얼에 넣었다. 시약들을 2.5 mL의 무수 톨루엔 중에 현탁시키고, 및 상기 용기를 질소로 퍼징시켰다. 반응 용기를 밀봉시키고, 110 °C로 480초 동안 가열하였다. 냉각시키자마자, 반응 혼합물을 SiO₂ (2:1 EtOAc/헥산으로 용리된)를 통해 여과하고, 용리제는 진공에서 농축시켰다. 잔류물을 2 mL의 EtOH에 용해시키고 0.6 mL의 1N NaOH 및 촉매량의 H₂O₂로 처리하였다. 50℃에서 이 용액을 2시간 동안 교반시키고 나서, 니트릴과 아미드의 혼합물을 컬럼 크로마토그래피 (실리카, EtOAc/헥산)로 정제하였다. 생성물 2-(페닐아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)벤즈아미드를 황색 분말 (55.6 mg, 47%)로 수득하였다. (LC/MS에 의해 100% 정제, M+H = 388.1). 상응하는 니트릴을 또한 분리하였다 (46.9 mg, 42%). (LC/MS에 의해 100% 정제).

[0759]

실시예 43



[0760]

[0761]

(Z)-3-부톡시-N'-히드록시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈이미다미드 (화합물 62)

[0762]

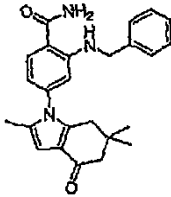
히드록실아민 히드로클로라이드로 3-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤조니트릴을 처리하여, 표제 화합물을 수득하였다: LCMS m/z M+H = 384.2.

[0763]

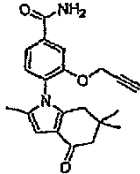
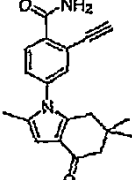
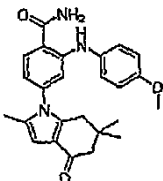
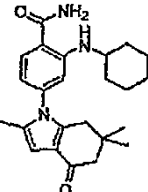
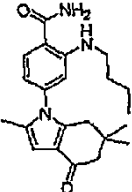
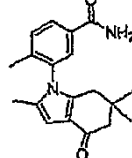
실시예 44

[0764]

하기 실시예는 본질적으로 반응식 7 내지 9에 기술된 절차, 및 선행하는 실시예에 기술된 실시예에 기술된 바에 따라 제조된다.

화합물 번호	구조	화합물명
63		2-벤질아미노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 402.2

[0765]

64		3-프로프-2-이닐옥시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 351.1
65		2-에티닐-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 321.1
66		2-(4-메톡시-페닐아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 418.2
67		2-시클로헥실아미노-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 394.1
68		2-(부틸아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 368.2
69		4-메틸-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인돌-1-일)-벤즈아미드; M+H = 311.1

[0766]

[0767]

실시예 45

[0768]

하기 화합물들은 본질적으로 반응식 1 내지 9에 기재되고 선행하는 실시예에서 기술된 과정에 따라 제조된다:

화합물 번호	M + H	화합물명
70	379.1	3-(3-티에닐)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
71	311.1	2-메틸-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
72	412.1	2-[(3-에티닐페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
73	422.1	2-[(4-클로로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
74	360.1	2-아닐리노-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
75	389.1	3-아닐리노-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)피리딘-2-카르복사아미드
76	478.2	2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
77	374.1	2-피리딘-4-일-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
78	412.2	N-[2-(아미노카르보닐)-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐]-L-발린
79	382.2	2-모르폴린-4-일-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
80	363.1	2-(1H-이미다졸-1-일)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
81	513.2	4-(3-클로로-2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드
82	404.1	2-[(4-히드록시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
83	406.2	2-[(1-에틸-1H-피라졸-5-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
84	393.1	2-[(5-메틸이속사졸-3-일)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
85	403.1	2-[(4-(아미노카르보닐)페닐)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드
86	436.1	4-(4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]벤즈아미드

[0769]

87	419.2	2-[(6-메톡시피리딘-3-일)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
88	310.1	2-(알릴아미노)-4-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
89	283.1	4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
90	361	3-브로모-4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
91	338.1	2-(알릴아미노)-4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
92	356.1	4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(2-메톡시에틸)아미노] 벤즈아미드
93	519.2	2-[(3-[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
94	397.2	2-(모르폴린-4-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
95	371.2	2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
96	425.2	2-[(2-모르폴린-4-일)에틸]아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
97	389.1	2-(피리딘-4-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
98	354.1	2-(아세틸아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
99	395.2	2-(4-메틸피페라진-1-일)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
100	367.2	2-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드

[0770]

101	384.1	2-[(메톡시아세틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
102	326.1	2-에틸-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드
103	386.1	2-(부틸티오)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드
104	505.2	2-({3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-메톡시페닐}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
105	406.1	2-(피리딘-4-일티오)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
106	417.2	2-({(1R)-1-페닐에틸}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드
107	533.1	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(3, 4, 5-트리메톡시페닐)아미노] 벤즈아미드
108	476.2	2-({2-[2-(디메틸아미노)에톡시]피리딘-4-일}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
109	480.2	2-({1-(N,N-디메틸글리실)피페리딘-4-일}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
110	359.1	4-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-페닐-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
111	455.2	2-({2-({2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)페닐}아미노)에틸}아미노)-2-옥소에틸 아세테이트
112	413.2	2-({2-(글라콜로일아미노)에틸}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드
113	419.1	2-({2-(메틸설포닐)에틸}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드

[0771]

114	419.2	2-((4-메톡시페닐)아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
115	406.1	2-[(6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
116	415.2	2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드
117	367.2	2-(시클로부틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
118	455.2	2-[트랜스-4-(2-히드록시-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드
119	411.2	2-(트랜스-4-히드록시-시클로헥실아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드
120	415.2	2-(2-메톡시-1-메톡시메틸-에틸아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드;
121	415.2	2-([3-히드록시-1-(2-히드록시에틸)프로필]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
122	469.2	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([2-메톡시-1-(메톡시메틸)에틸]아미노)벤즈아미드
123	451.1	2-([3-(메틸설폰닐)페닐]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
124	528.1	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([1-(메틸설폰닐)피페리딘-4-일]아미노)벤즈아미드
125	465.2	4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-(트랜스-4-

[0772]

		히드록시-시클로헥실아미노)-벤즈아미드
126	509.2	4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-2-[트랜스-4-(2-히드록시-에톡시)-시클로헥실아미노]-벤즈아미드
127	537.3	2-([1-(3-모르폴린-4-일프로파노일)피페리딘-4-일]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
128	508.2	2-[트랜스-4-(2-아미노-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(6,6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드
129	453.2	2-[(1-글리실피페리딘-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
130	454.2	2-[트랜스-4-(2-아미노-에톡시)-시클로헥실아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일)-벤즈아미드
131	446.1	2-([1-(메틸설포닐)아세트아미드-3-일]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
132	433.1	2-([3-(메틸설포닐)프로필]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
133	488.1	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([2-[(메틸설포닐)아미노]에틸]아미노)벤즈아미드
134	338.1	4-(3-부트-3-엔-1-일-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
135	460.1	2-([1-(3S)-1-(메틸설포닐)피롤리딘-3-일]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드
136	502.1	2-([2-([4-메틸아미노]설포닐)에틸]아미노)-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드
137	327.1	4-[3-(2-아미노-에틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-인다졸-1-일]-벤즈아미드

[0773]

[0774]

실시예 46

[0775]

하기 화합물들을 본질적으로 상기 반응식 1 내지 9에 기술되고 상기 실시예에 설명된 과정에 따라 제조하였다:

화합물 번호	M + H	화합물명
138	285.1	4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤조산;
139	284.1	4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
140	297.1	4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
141	313.1	4-[(4Z)-4-(메톡시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
142	299.1	4-[(4Z)-4-(히드록시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-2H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
143	311.1	4-메틸-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
144	297.1	3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
145	332.1	2-클로로-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤조산;
146	327.1	4-[(4Z)-4-(에톡시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
147	375.1	4-[(4Z)-6,6-디메틸-4-(페톡시이미노)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
148	355.2	4-[(4Z)-4-(이소부톡시이미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
149	339.1	4-[(4Z)-4-[(알릴옥시)이미노]-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
150	383.2	4-[(4Z)-6,6-디메틸-4-[(테트라히드로-2H-피란-2-일옥시)이미노]-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
151	389.1	4-[(4Z)-4-[(벤질옥시)이미노]-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
152	312.1	4-[(4E)-4-(히드록시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;
153	326.1	4-[(4E)-4-(메톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;

[0776]

154	352.1	4-[(4E)-4-[(알릴옥시)이미노]-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;
155	368.2	4-[(4E)-4-(이소부톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;
156	402.2	4-[(4E)-4-[(벤질옥시)이미노]-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]벤즈아미드;
157	340.1	3-[(4Z)-4-(메톡시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로벤조-1H-인돌-1-일]-4-메틸벤즈아미드;
158	326.1	3-[(4Z)-4-(히드록시이미노)-2,6,6-트리메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일]-4-메틸벤즈아미드;
159	377.1	4-[6-(1,3-벤조다옥솔-5-일)-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤조산;
160	376.1	4-[6-(1,3-벤조다옥솔-5-일)-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
161	391.1	4-[(4Z)-6-(1,3-벤조다옥솔-5-일)-4-(히드록시이미노)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
162	365.1	2-(트리플루오로메틸)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
163	327.1	2-메톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
164	369.2	2-부톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
165	368.2	2-(부틸이미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
166	385.2	3-(2-에톡시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
167	371.1	3-(2-메톡시에톡시)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
168	341.1	2-에톡시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;

[0777]

169	357.1.	2-(2-히드록시에톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
170	370.2	2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
171	385.2	2-(2-에톡시에톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
172	255.1	4-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
173	384.2	3-[2-(디메틸아미노) 에톡시]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
174	397.2	3-(테트라히드로푸란-3-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
175	407.1	3-(4-플루오로페녹시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
176	383.2	2-[(2-(디메틸아미노) 에틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
177	388.1	2-아닐리노-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
178	315.1	3-플루오로-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
179	359.1	4-(6, 6-디메틸-4-옥소-2-페닐-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
180	331.1	2-클로로-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
181	402.2	2-(벤질아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
182	375	2-브로모-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
183	357.1	3-(2-히드록시에톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0778]

184	312.1	2-아미노-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
185	385.1	3-(3차-부틸티오)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
186	405.1	3-(페닐티오)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
187	385.1	3-(부틸티오)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
188	340.1	2-(디메틸아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
189	327.1	3-메톡시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
190	341.1	3-에톡시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
191	355.1	3-프로폭시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
192	403.1	3-(벤질옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
193	426.2	3-(2-모르폴린-4-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
194	404.1	3-(피리딘-2-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
195	404.1	3-(피리딘-4-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
196	399.2	3-(2-이소프로폭시에톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
197	410.2	3-(2-피롤리딘-2-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
198	411.2	3-(테트라히드로-2H-피란-2-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0779]

199	397.2	3-(테트라히드로-2H-피란-4-일옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
200	368.2	3-(부틸아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
201	331.1	3-클로로-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
202	393.1	3-(1H-이미다졸-4-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
203	418.2	2-[(4-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
204	370.1	3-부톡시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤조산;
205	388.1	3-아닐리노-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
206	402.2	3-(벤질아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
207	371.1	3-(3-히드록시프로폭시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
208	385.2	3-(3-히드록시부톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
209	387.1	3-(2, 3-디히드록시프로폭시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
210	340.1	N-부틸-4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
211	383.2	3-(2-메틸부톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
212	383.2	3-(펜틸옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
213	383.2	3-(3-메틸부톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
214	313.1	3-히드록시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-

[0780]

		테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N-페닐벤즈아미드;
215	360.1	2-(시클로헥실아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
216	394.2	3-(시클로헥실옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
217	395.2	3-(펜트-4-엔-1-일옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
218	381.2	2-(1, 3-벤조디옥솔-5-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
219	432.1	2-(헥실아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
220	396.2	4-(5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
221	341.1	3-부톡시-4-(2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
222	385.2	3-(4-히드록시부톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
223	397.2	3-[(3-메틸옥세탄-3-일) 메톡시]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
224	384.2	3-(4-아미노부톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
225	383.1	3-(테트라히드로푸란-3-일옥시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
226	397.2	3-(테트라히드로푸란-2-일메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
227	381.2	3-[(1-에틸프로프-2-엔-1-일) 옥시]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
228	362	2-브로모-4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;

[0781]

229	409.1	3-(2-티에닐메톡시)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
230	283.1	4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
231	390.1	2-[(메틸설포닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
232	354.1	2-(아세틸아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
233	355.1	2-[(아미노카르보닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
234	416.1	2-(벤조일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
235	382.2	2-(부티릴아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
236	342.1	3-에톡시-5-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 피리딘-2-카르복사아미드;
237	389.1	2-(피리딘-3-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
238	390.1	2-(피리딘-2-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤조산;
239	432.2	2-[(3-에톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
240	418.2	2-[(3-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
241	356.1	3-부톡시-4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
242	371.2	3-부톡시-4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N'-히드록시벤젠카르복사이미다미드;
243	326.1	N'-히드록시-3-메틸-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-

[0782]

		일) 벤젠카르복스이미다미드; 3-메틸-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
244	311.1	2-클로로-N-히드록시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤젠카르복스이미다미드;
245	346.1	2, 3-디플루오로-N-히드록시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4- 옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤젠카르복스이미다미드;
246	348.1	8-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인돌-1-일)-2, 3-디히드로-1, 4-벤조디옥신-5- 카르복스아미드;
247	355.1	2-펜틸-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
248	367.2	3-펜틸-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
249	367.2	2-[(4-부톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4- 옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
250	460.2	2-아닐리노-N'-히드록시-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤젠카르복스이미다미드;
251	403.2	2-[(4-(트리플루오로메톡시)페닐)아미노]-4-(2, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;
252	472.1	2-[(2-클로로-4-플루오로페닐)아미노]-4-(2, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;
253	440.1	2-[(2-클로로-4-메틸페닐)아미노]-4-(2, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;
254	436.1	2-[(2-클로로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;
255	452.1	2-[(2-클로로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;

[0783]

		일) 벤즈아미드; 2-[(3,4-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(3-플루오로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(3,5-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(2,5-디메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(4-에톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4- 옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-[(4-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4- 옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-페녹시-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7- 테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-(페닐티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소- 4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-(시클로프로필아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소- 4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-(프로프-2-인-1-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4- 옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 3-(프로필티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소- 4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; N-히드록시-3-(프로필티오)-4-(2,6,6-트리메틸-4- 옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤젠카르복스이미다미드; N-[2-(아미노카르보닐)-5-(2,6,6-트리메틸-4-옥소- 4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]-1- 페닐알라닌; 페닐알라닌;
255	448.2	
257	436.2	
258	448.2	
259	448.2	
260	432.2	
261	406.1	
262	389.1	
263	405.1	
264	352.1	
265	350.1	
266	371.1	
267	386.1	
268	460.2	

[0784]

269	371.2	3-부톡시-4-[(4Z)-4-(히드록시아미노)-6,6-디메틸-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드; 2-(디아틸아미노)에틸 3-부톡시-4-(2,6,6-
270	469.3	트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤조에이트; 2-[(2-클로로-3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3-클로로-2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
271	546.1	4-(6,6-디메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노] 벤즈아미드;
272	464.2	4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3,4,5-트리메톡시페닐)아미노] 벤즈아미드;
273	450.2	2-[(3,4,5-트리플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
274	442.1	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
275	410.2	2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
276	408.2	2-[(4-메틸페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
277	402.2	2-(2,3-디히드로-1H-인덴-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
278	428.2	2-[(2-프로필페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
279	430.2	2-[(2-이소프로필페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
280	430.2	2-[(2-이소프로필페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-

[0785]

		일) 벤즈아미드; 2-(3-히드록시프로프-1-인-1-일)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
281	351.1	2-[(2-클로로-3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
282	512.1	2-[(2-클로로-3,4,5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
283	331.1	4-(4-옥소-2-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
284	442.1	2-[(2,4,5-트리플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
285	492.2	2-[(3,4,5-트리메톡시벤질)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
286	406.1	2-[(2-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
287	406.2	2-[(3-플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
288	420.2	2-[(4-플루오로-3-메틸페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
289	434.2	2-[(3-히드록시-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
290	436.2	2-[(2-플루오로-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
291	396.2	2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
292	424.1	2-[(2,4-디플루오로페닐)아미노]-4-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0786]

		트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
293	424.1	2-[(3, 4-디플루오로페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
294	445.2	2-아닐리노-4-{5-[(디메틸아미노) 메틸]-2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
295	346.1	4-[(4E)-4-(히드록시아미노)-2-페닐-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일] 벤즈아미드;
296	494.2	2-[(4-(벤질옥시) 페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
297	396.2	2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
298	398.2	2-[(1, 3-디옥솔란-2-일메틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
299	384.2	2-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
300	400.2	2-[(2-(2-히드록시에톡시) 에틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
301	356.1	2-[(4-히드록시부틸)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
302	411.2	4-(2-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3-모르폴린-4-일프로필)아미노] 벤즈아미;
303	403.2	2-[(피리딘-2-일메틸)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0787]

304	503.2	2-([2-(다이틸아미노)-4-에톡시페닐]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
305	454.1	2-([4-(디플루오로메톡시) 페닐]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
306	462.2	2-([3, 4-디메톡시벤질]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
307	370.2	2-([3-히드록시프로필]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
308	352.1	2-(알릴아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
309	493.2	4-((4E)-4-(히드록시아미노)-2, 6, 6-트리메틸-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-([3, 4, 5-트리메톡시페닐]아미노) 벤즈아미드;
310	384.2	2-([3-메톡시프로필]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
311	389.1	2-(피리딘-4-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
312	420.2	2-([3-(1H-이미다졸-1-일) 프로필]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
313	406.2	2-([2-(1H-이미다졸-1-일) 에틸]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
314	379.1	2-(이속사졸-3-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
315	403.2	2-([피리딘-3-일메틸]아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0788]

		일) 벤즈아미드;
316	340.1	4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 프탈아미드;
317	348	3-브로모-N'-히드록시-4-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤젠카르복사이미다미드;
318	342.1	4-2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 프탈산;
319	467.3	2-[(10-아미노데실)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
320	324.1	2-(알릴아미노)-4-(2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
321	386.1	2-(2, 3-디히드로-1H-인텐-1-일아미노)-4-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
322	338.1	2-(시클로프로필아미노)-4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
323	342.1	2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-2H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
324	324.1	3-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
325	492.2	2-[(3-(3-히드록시프로폭시)-4-메톡시페닐)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
326	324.1	2-(알릴아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
327	324.1	2-(시클로프로필아미노)-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
328	342.1	2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
329	269.1	4-(2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
330	297.1	4-(3-에틸-2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
331	269.1	4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0789]

332	487.2	2-[(2-{2-[2-(2-아미노에톡시)에톡시]에틸}아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
333	382.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(2-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
334	297.1	4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
335	360.1	2-아닐리노-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
336	382.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
337	396.2	4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
338	374.1	2-아닐리노-4-(2, 3-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
339	450.2	4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)-2-[(3, 4, 5-트리메톡시페닐)아미노] 벤즈아미드;
340	383.2	2-[(2-(디메틸아미노)에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
341	355.2	2-[(2-(디메틸아미노)에틸)아미노]-4-(3-메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
342	395.2	2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
343	298.1	4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0790]

344	333	2-브로모-5-(4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
345	410.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
346	409.2	2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
347	453.2	(4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(2, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐)아미노]피페리딘-1-일) 아세트산;
348	370.2	2-[(2-메톡시에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
349	403.2	2-[(피리딘-4-일메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
350	396.2	2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
351	478.2	2-[(3, 4, 5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
352	340.1	4-(3-이소부틸-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
353	312.1	2-아미노-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
354	352.1	2-(알릴아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
355	409.2	2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
356	395.2	2-(피페리딘-4-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0791]

357	369.2	3-부톡시-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
358	428.2	2-(2, 3-다히드로-1H-인텐-1-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
359	408.2	2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
360	355.1	2-[(아미노카르보닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
361	397.2	2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
362	376	2-브로모-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
363	440.2	2-[(3-모르폴린-4-일프로필)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
364	397.2	2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
365	523.3	2-[(트랜스-4-(2-모르폴린-4-일에톡시)시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
366	435.2	2-[(8-메틸-8-아자비시클로[3.2.1]옥트-3-일)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
367	312.1	4-(3-에틸-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
368	394.2	2-(시클로헥실아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0792]

369	410.2	2-[(1-메틸피페리딘-4-일)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
370	353.1	2-(시클로프로필아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
371	352.1	2-(시클로프로필아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
372	366.2	2-[(시클로프로필메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
373	448.2	2-[(3, 4-디메톡시페닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
374	449.2	2-[(3, 4-디메톡시페닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
375	479.2	2-[(3, 4, 5-트리메톡시페닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
376	519.2	2-({3-[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐}아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
377	411.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
378	409.2	2-[(4-옥소시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
379	412.1	2-([2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노) 2-옥소에틸 아세테이트;

[0793]

380	385.2	2-[(3-메톡시프로필)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
381	421.2	2-[(3-(1H-이미다졸-1-일)프로필)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
382	467.2	트랜스-4-[[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노]시클로헥실 글리시네이트;
383	355.2	2-[(2-아미노에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
384	452.2	트랜스-4-[[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노]시클로헥실 아세테이트;
385	383.2	4-(3-에틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노] 벤즈아미드;
386	413.2	2-[(1, 4-디옥산-2-일메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
387	393.1	2-[(2-푸릴메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
388	392.1	2-[(2-푸릴메틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
389	425.2	2-[(2-피페라진-1-일에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
390	424.2	2-[(2-피페라진-1-일에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;

[0794]

391	506.2	2-((3-[2-(디메틸아미노)에톡시]-4-메톡시페닐)아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
392	352.1	2-(알릴아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
393	353.1	트랜스-4-([2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 페닐]아미노) 시클로헥실 글리시네이트;
394	468.2	2-[(시스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
395	411.2	4-[4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
396	324	4-(3-에틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-N'-히드록시-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸)아미노] 벤젠카르복시이미다미드;
397	398.2	2-([2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
398	424.2	2-([2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
399	423.2	2-([2-(디메틸아미노)에틸]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
400	384.2	트랜스-4-([2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노) 시클로헥실 N,N-디메틸글리시네이트;
401	495.2	3-클로로-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-
402	332.1	

[0795]

		테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-
403	299.1	인다졸-1-일) 벤조산; 2-(피리딘-3-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-
404	390.1	4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-(피리딘-4-일티오)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-
405	407.1	4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-[(1-글리실피페리딘-4-일)아미노]-4-(3, 6, 6-
406	452.2	트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; N-히드록시-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-
407	314.1	테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; N-(2-메톡시에틸)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-
408	356.1	4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-[(1R)-1-페닐에틸]아미노)-4-(3, 6, 6-
409	416.2	트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(1-에틸피페리딘-3-일)아미노]-4-(3, 6, 6-
410	423.2	트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(1S)-1-페닐에틸]아미노)-4-(3, 6, 6-
411	416.2	트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(1S)-1-페닐에틸]아미노)-4-(3, 6, 6-
412	417.2	트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일) 벤즈아미드; 2-[(트랜스-4-메톡시시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-
413	424.2	트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드; 2-[(3-(2-옥소피롤리딘-1-일)프로필)아미노]-4-
414	438.2	(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일) 벤즈아미드;

[0796]

415	574.2	2-((3-[3-(디메틸아미노)프로폭시]-4-메톡시페닐)아미노)-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
416	447.1	2-(2,1,3-벤조티아디아졸-4-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
417	423.1	2-[(3-클로로페닐)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
418	419.2	2-[(3-메톡시페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
419	477.2	2-((2-[2-(디메틸아미노)에톡시]피리딘-4-일)아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
420	465.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
421	451.1	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노) 벤즈아미드;
422	445.2	2-[(1S, 2R)-2-히드록시-2,3-디히드로-1H-인덴-1-일]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
423	445.2	2-[(1R, 2S)-2-히드록시-2,3-디히드로-1H-인덴-1-일]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
424	433.1	3-([2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐]아미노) 벤조산;

[0797]

		인다졸-1-일) 벤즈아미드;
435	445.2	2-[(1,1-디옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
436	432.2	2-[(3-(아미노카르보닐)페닐)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
437	379.2	2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
438	395.1	2-[(2,2,2-트리플루오로에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
439	413.2	2-[(3R,4S)-3,4-디히드록시시클로펜틸]아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
440	420.2	2-[(6-메톡시피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
441	420.2	2-[(1-메틸-6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
442	483.2	트랜스-4-[(2-(아미노카르보닐)-5-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)페닐)아미노]시클로헥실 메톡시아세테이트;
443	491.2	2-[(1-[3-(디메틸아미노)프로필]-6-옥소-1,6-디히드로피리딘-3-일)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
444	424.2	2-[(2-(2-옥소피롤리딘-1-일)에틸)아미노]-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-

[0799]

		인다졸 -1-일) 벤즈아미드; 2-([3-(트리플루오로메톡시)페닐]아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일) 벤즈아미드;
445	473.1	4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-피란-4-일아미노) 벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스- 4-히드록시시클로헥실) 아미노] 벤즈아미드;
446	433.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드;
447	447.2	4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드;
448	467.1	4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드;
449	449.1	4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2- (테트라히드로-2H-티오피란-4-일아미노) 벤즈아미드;
450	385.2	2-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노]-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일) 벤즈아미드;
451	460.2	N-(2-아미노페닐)-3-부톡시-4-(2, 6, 6-트리메틸- 4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1- 일) 벤즈아미드;
452	410.2	2-([(3S)-6-옥소피페리딘-3-일]아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일) 벤즈아미드;
453	482.2	트랜스-4-([2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸- 4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1- 일) 페닐]아미노) 시클로헥실 1-알라니네이트; 트랜스-4-([2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸- 4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1- 일) 페닐]아미노) 시클로헥실 D-알라니네이트;
454	482.2	4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1- 일) 페닐]아미노) 시클로헥실 D-알라니네이트;

[0800]

455	481.2	트랜스-4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노}시클로헥실 1-알라니네이트; 트랜스-4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노}시클로헥실 D-알라니네이트;
456	481.2	트랜스-4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노}시클로헥실 D-알라니네이트; 1-[4-(아미노카르보닐)-3-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노) 페닐]-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-3-카복실산;
457	427.1	5-브로모-2-[(테트라히드로푸란-2-일메틸) 아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
458	475.1	2-[(3-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
459	411.2	4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 페닐]아미노}시클로헥산카복실산;
460	439.2	트랜스-4-{[2-(아미노카르보닐)-5-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 페닐]아미노}시클로헥실 글리시네이트;
461	522.2	트랜스-4-{[2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 페닐]아미노}시클로헥실 1-발리네이트;
462	509.3	2-[(2, 6-디히드록시테트라히드로-2H-피란-4-일)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
463	429.2	2-(시클로펜트-3-엔-1-일아미노)-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
464	433.1	4-[3-(디플루오로메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4-
465	445.2	

[0801]

		옥소시클로헥실)아미노]벤즈아미드; 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(4- 옥소시클로헥실)아미노]벤즈아미드; 4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1- 옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4- 일)아미노]벤즈아미드; 4-[3-(디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1- 옥시도테트라히드로-2H-티오피란-4- 일)아미노]벤즈아미드; 2-[(시클로헥스-3-엔-1-일아미노)-4-(3,6,6-트리메틸- 4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1- 일)벤즈아미드; 2-[(3S,4R)-3, 4-디히드록시시클로헥실]아미노)-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일)벤즈아미드; 2-[(4-(트리플루오로메톡시)페닐)아미노)-4-(3,6,6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일)벤즈아미드; 트랜스-4-[(2-(아미노카르보닐)-5-[3- (디플루오로메틸)-6,6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라히드로-1H-인다졸-1- 일]페닐)아미노]시클로헥실 글리시네이트; 4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(3- 에티닐페닐)아미노]벤즈아미드; 4-(6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일)-2-(테트라히드로-2H-피란-4- 일아미노)벤즈아미드;
466	463.1	
467	483.2	
468	465.1	
469	393.2	
470	427.2	
471	473.1	
472	504.2	
473	467.1	
474	383.2	

[0802]

475	492.2	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([3-(2-옥소피롤리딘-1-일)프로필]아미노)벤즈아미드; 4-(트리플루오로메틸)-3-(2,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인돌-1-일)벤즈아미드;
476	365.1	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([시스-4-히드록시시클로헥실]아미노)벤즈아미드;
477	465.2	2-([3-(메틸티오)페닐]아미노)-4-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
478	435.1	4-(트리플루오로메틸)-3-(3,6,6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
479	366.1	4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드; 3-(3-메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-4-(트리플루오로메틸)벤즈아미드;
480	338.1	2-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)미노]벤즈아미드;
481	465.2	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(피페리딘-4-일아미노)벤즈아미드;
482	450.2	2-[(1-아세틸피페리딘-4-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
483	492.2	2-[(1-벤질피페리딘-4-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
484	540.2	4-(2-{[아미노카르보닐]-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐]아미노}-N,N-디메틸피페리딘-1-카복사미드;
485	521.2	2-브로모-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-
486	445	

[0803]

		(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-N'-히드록시벤젠카르복시아미다미드;
487	526.2	2-[(1-벤질피롤리딘-3-일)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;
488	526.2	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(1-페닐피페리딘-4-일)아미노]벤즈아미드;
489	524.2	(([(4E)-1-[4-(아미노카르보닐)-3-(테트라히드로-2H-피란-4-일아미노)페닐]-6,6-디메틸-3-(트리플루오로메틸)-1,5,6,7-테트라히드로-4H-인다졸-4-일리덴]아미노)옥시)아세트산;
490	471.1	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(2-히드록시-1,1-비스(히드록시메틸)에틸)아미노]벤즈아미드;
491	437.1	4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(3R)-테트라히드로푸란-3-일아미노]벤즈아미드;
492	536.2	트랜스-4-[(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]시클로헥실 1-알라니네이트; 메탄설포네이트
493	564.2	트랜스-4-[(2-(아미노카르보닐)-5-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]페닐)아미노]시클로헥실 1-발리네이트
494	505.2	메탄설포네이트; 2-[알릴(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-[6,6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]벤즈아미드;

[0804]

495	536.2	2-아미노-프로피온산 트랜스-4-[2-카르바모일-5-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4, 5, 6, 7-테트라히드로-인다졸-1-일)-페닐아미노] 시클로헥실 에스테르;
496	513.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-(4-피리딘-2-일피페라진-1-일) 벤즈아미드;
497	539.2	2-[(2, 3-디히드록시프로필) (트랜스-4-히드록시시클로헥실) 아미노]-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
498	507.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실) (2-옥소에틸) 아미노] 벤즈아미드;
499	441.1	2-[(2, 3-디히드록시프로필) 아미노]-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
500	442.1	2-[(2, 3-디히드록시프로필) 아미노]-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤조산;
501	597.2	2-(아세톡시메틸)-2-(2-카르바모일-5-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 페닐아미노) 프로판 1, 3-디일 디아세테이트;
502	555.2	2-((2-(아미노카르보닐)-5-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 페닐) 아미노)-2-(히드록시메틸) 프로판-1, 3-디일 디아세테이트;
503	513.1	2-((2-(아미노카르보닐)-5-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-

[0805]

		인다졸-1-일] 페닐]아미노)-3-히드록시-2- (히드록시메틸)프로필 아세테이트;
504	509.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스- 4-히드록시시클로헥실)(2- 히드록시메틸)아미노]벤즈아미드;
505	555.1	2-({4-[2, 2, 2-트리플루오로-1-히드록시-1- (트리플루오로메틸)에틸]페닐]아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일)벤즈아미드;
506	550.3	2-({1-[3-(4-메틸피페라진-1- 일)프로파노일]피페리딘-4-일]아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일)벤즈아미드;
507	501.2	2-[(1-이소니코티노일피페리딘-4-일]아미노)-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일)벤즈아미드;
508	501.2	2-[(1-(피리딘-3-일카르보닐)피페리딘-4- 일]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
509	422.2	2-(1-아자비시클로[2.2.2]옥트-3-일아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4,5,6,7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일)벤즈아미드;
510	460.1	2-[(3R)-1-(메틸설포닐)피롤리딘-3- 일]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4,5,6,7- 테트라히드로-1H-인다졸-1-일)벤즈아미드;
511	467.2	2-[(1-베타-알라닐피페리딘-4-일]아미노)-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일)벤즈아미드;
512	493.2	2-[(1-프롤릴피페리딘-4-일]아미노)-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-

[0806]

		1-일) 벤즈아미드; 2-([(3R)-1-아세틸피롤리딘-3-일]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
513	424.2	(3R)-3-([2-(아미노카르보닐)-5-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 페닐]아미노)-N,N-디메틸피롤리딘-1-카르복사미드; [[2-카르바모일-5-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-트리플루오로메틸-4, 5, 6, 7-테트라히드로-인다졸-1-일)-페닐]-(트렌스-4-히드록시-시클로헥실)-아미노]-아세트산;
514	453.2	2-([4-(히드록시메틸) 페닐]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([(1R, 3S)-3-히드록시시클로펜틸]아미노) 벤즈아미드;
515	523.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-([(1R, 3R)-3-히드록시시클로펜틸]아미노) 벤즈아미드;
516	419.2	2-([(2R)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-([(2S)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
517	451.1	2-([(2S)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-([(1R, 3S)-3-히드록시시클로펜틸]아미노)-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
518	451.1	2-([(1R, 3R)-3-히드록시시클로펜틸]아미노) 벤즈아미드; 2-([(2R)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
519	397.2	2-([(2S)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-([(1R, 3S)-3-히드록시시클로펜틸]아미노)-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
520	505.2	2-([(1R, 3R)-3-히드록시시클로펜틸]아미노) 벤즈아미드; 2-([(2R)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
521	397.2	2-([(2S)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-([(1R, 3S)-3-히드록시시클로펜틸]아미노)-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
522	473.2	2-([(1R, 3R)-3-히드록시시클로펜틸]아미노) 벤즈아미드; 2-([(2R)-테트라히드로푸란-2-일메틸]아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;

[0807]

		인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-{[1-(피리딘-3-일카르보닐)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-{[1-(3-모르폴린-4-일프로파노일)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-{[1-(3-(4-메틸피페라진-1-일)프로파노일)아제티딘-3-일]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-{[3-(메틸티오)프로필]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-[(3R)-테트라히드로푸란-3-일아미노] 벤즈아미드; 2-{[(1S)-2-메톡시-1-메틸에틸]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 2-(테트라히드로-2H-피란-2-일아미노)-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인돌-1-일) 벤즈아미드; 2-{[트랜스-4-(알릴옥시)시클로헥실](3, 5-디메톡시벤질)아미노}-4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드; 2-{[트랜스-4-(2, 3-디히드록시프로폭시)시클로헥실](3, 5-디메톡시벤질)아미노}-4-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-
523	473.2	
524	509.2	
525	522.3	
526	401.1	
527	437.1	
528	385.2	
529	396.2	
530	655.3	
531	689.3	

[0808]

		인다졸-1-일} 벤즈아미드; 4-{3-[(벤질옥시)메틸]-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일} 벤즈아미드; 2-[(2-[(디메틸아미노)설폰]에틸)아미노]-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일} 벤즈아미드; 2-[(3S)-피롤리딘-3-일아미노]-4-(3, 6, 6- 트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸- 1-일) 벤즈아미드 히드로클로라이드; 2-[(3S)-1-아세틸피롤리딘-3-일]아미노]-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H- 인다졸-1-일) 벤즈아미드; 4-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(트랜스- 4-(2-옥소에톡시)시클로헥실)아미노] 벤즈아미드; 2-[(4-(2, 3-디히드록시프로폭시)시클로헥실)아미노] 4-(6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드; 4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(2- [(이소프로필설폰]아미노)에틸)아미노] 벤즈아미드 4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스- 4-(2-히드록시에톡시)시클로헥실)아미노] 벤즈아미드; {(트랜스-4-(2-(아미노카르보닐)-5-[6, 6-디메틸- 4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로- 1H-인다졸-1- 일]페닐)아미노)시클로헥실} 옥시; 아세트산; 4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(2- [(페닐설폰]아미노)에틸)아미노] 벤즈아미드;
532	404.1	
533	448.2	
534	382.2	
535	424.2	
536	507.2	
537	539.2	
538	516.1	
539	509.2	
540	523.2	
541	550.1	

[0809]

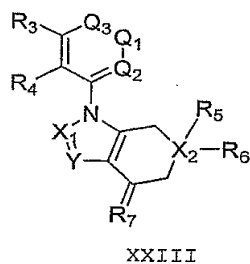
542	490.2	2-{[2-(모르폴린-4-일설폰닐)에틸]아미노}-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
543	327.1	4-[3-(2-아미노에틸)-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
544	451.1	2-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-(메틸[(3R)-테트라히드로푸란-3-일]아미노) 벤즈아미드;
545	439.1	2-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-4-[(2-메톡시-1-메틸에틸)아미노] 벤즈아미드;
546	430	4-브로모-2-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
547	425.2	4-(3-에틸-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
548	522.2	4-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스-4-{[(2E)-2-(히드록시이미노)에틸]옥시}시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
549	453.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3-이소부틸-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
550	437.2	4-(3-시클로프로필-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일)-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
551	426.2	4-[3-(아미노메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라히드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드

[0810]

		메탄설폰네이트 (염); 2-[(1-메틸-2-옥소-2-피페리딘-1-
552	452.2	일에틸)아미노]-4-(3, 6, 6-트리메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라하드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
553	440.2	4-[3-(2-아미노에틸)-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라하드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스-4- 히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
554	439.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4-(3- 이소프로필-6, 6-디메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7- 테트라하드로-1H-인다졸-1-일) 벤즈아미드;
555	437.1	2-[6, 6-디메틸-4-옥소-3-(트리플루오로메틸)- 4, 5, 6, 7-테트라하드로-1H-인다졸-1-일]-4- (테트라하드로푸란-3-일아미노) 벤즈아미드;
556	451.2	4-[3-(시클로프로필메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라하드로-1H-인다졸-1-일]-2-[(트랜스- 4-히드록시시클로헥실)아미노] 벤즈아미드;
557	424.2	2-[(트랜스-4-히드록시시클로헥실)아미노]-4- (2, 3, 6, 6-테트라메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라하드로- 1H-인돌-1-일) 벤즈아미드;
558	338.1	4-[3-(시클로프로필메틸)-6, 6-디메틸-4-옥소- 4, 5, 6, 7-테트라하드로-1H-인다졸-1-일] 벤즈아미드;
559	398.2	2-[(2-(디메틸아미노)-2-옥소에틸)아미노]-4- (3, 6, 6-트리메틸-4-옥소-4, 5, 6, 7-테트라하드로-1H- 인다졸-1-일) 벤즈아미드;

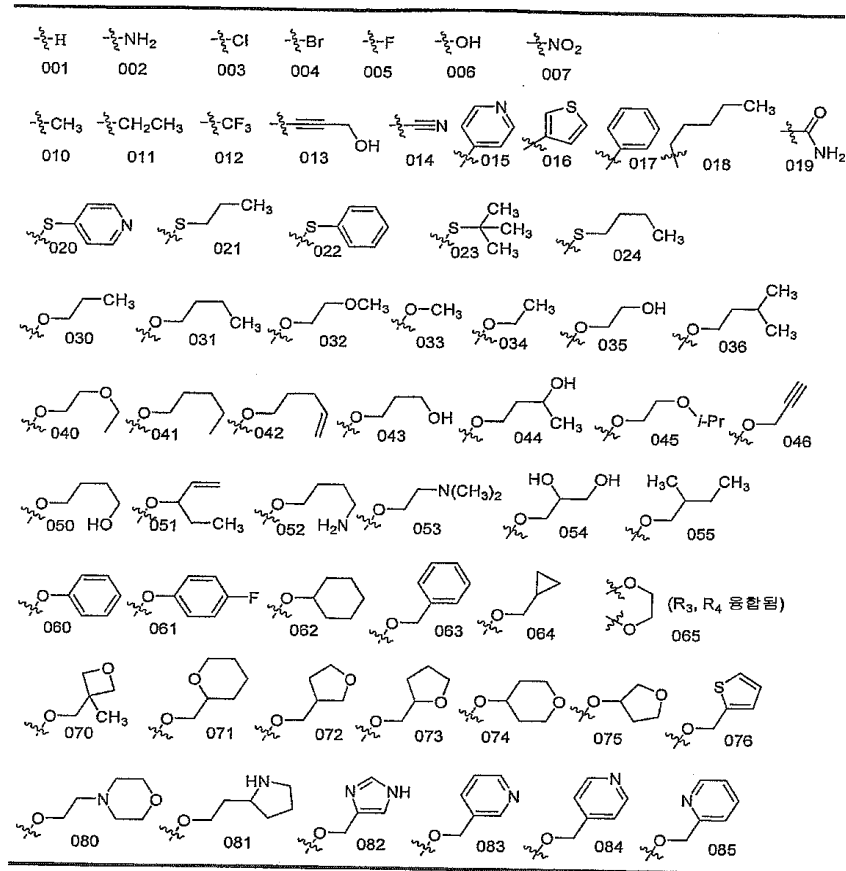
실시예 47:

본 발명의 부가 화합물은 하기 화학식 (XXIII)로 표시되며, 이들 화합물은 하기 표에 기재된 치환기 R₃, R₄, R₅, R₆, R₇, Q₁, Q₂, Q₃, Y, X₁ 및 X₂를 갖는다. 이들 화합물은 본질적으로 상기 반응식 1 내지 9에 기술되고 상기 실시예에 기재된 과정에 따라 제조된다:



[0815]

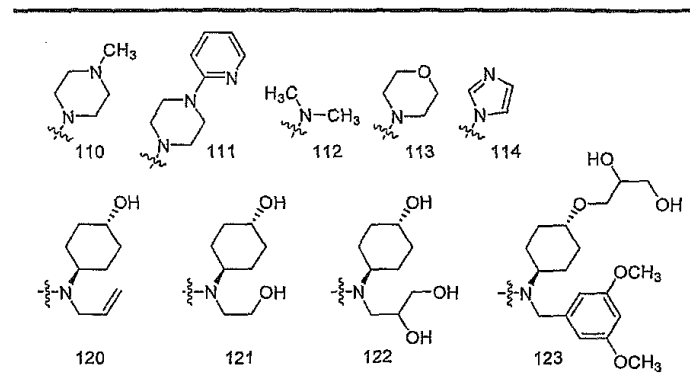
표 A1: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0816]

[0817]

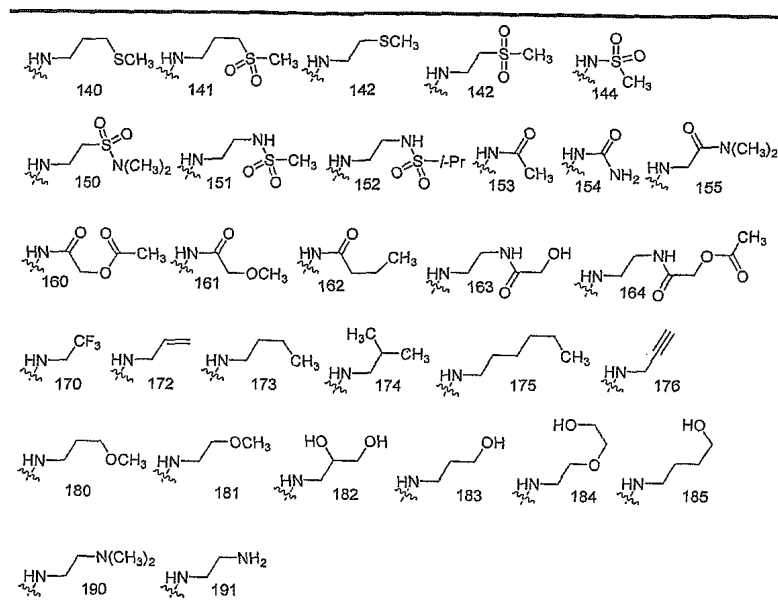
표 A2: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0818]

[0819]

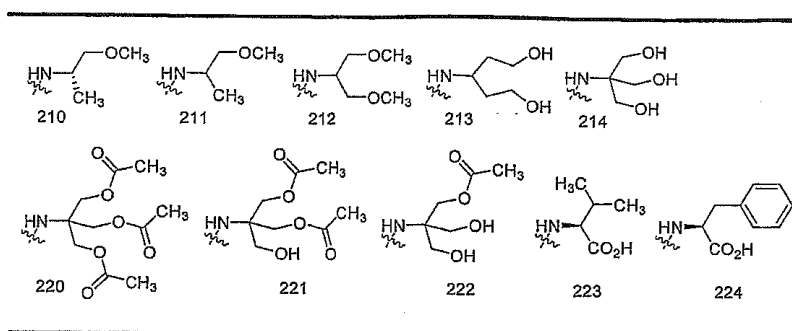
표 A3: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0820]

[0821]

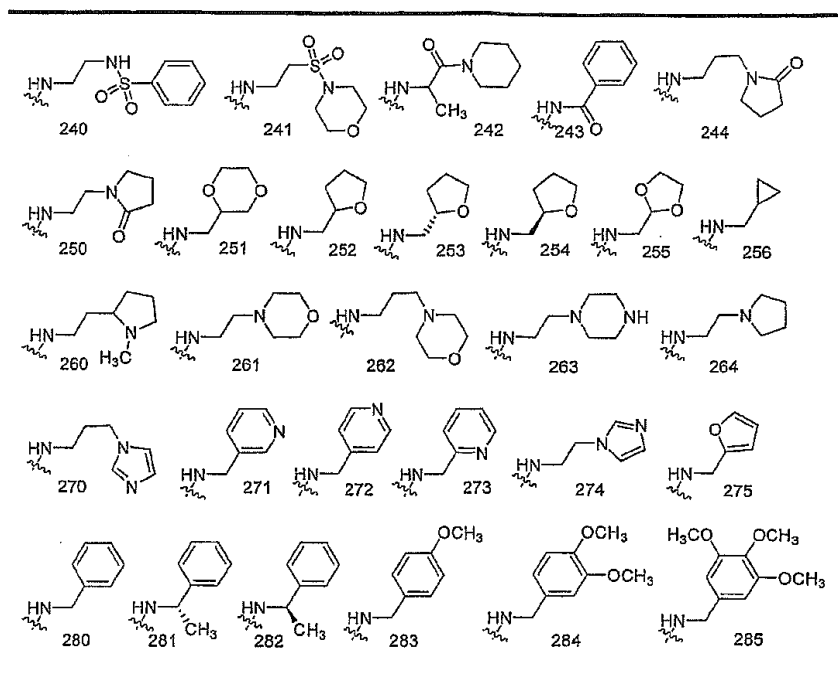
표 A4: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0822]

[0823]

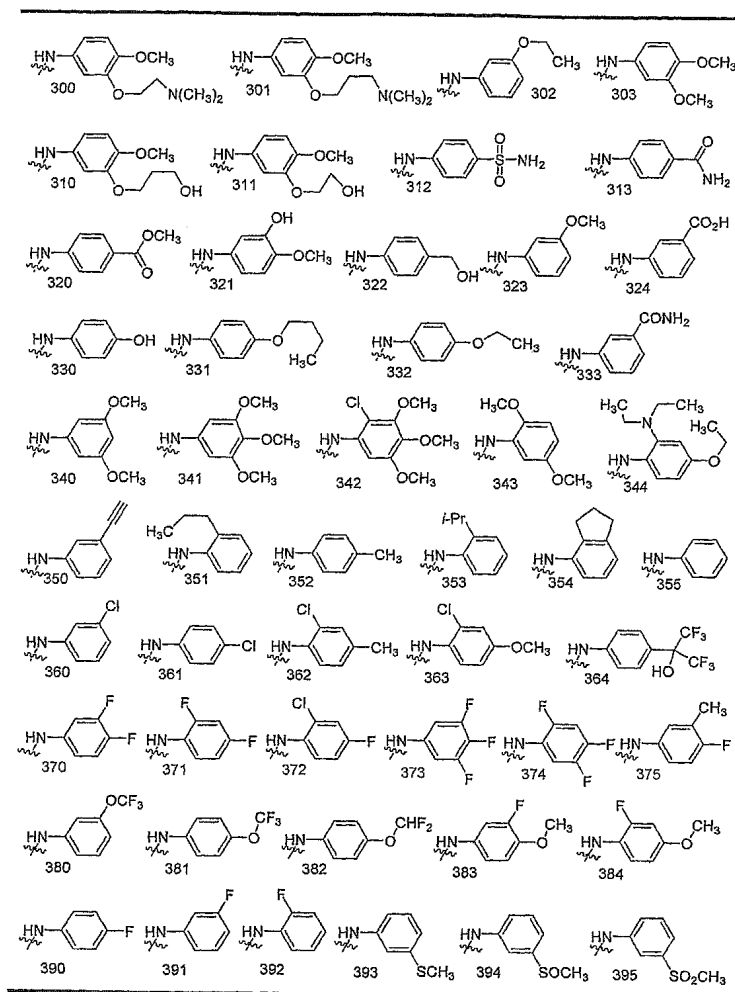
표 A5: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0824]

[0825]

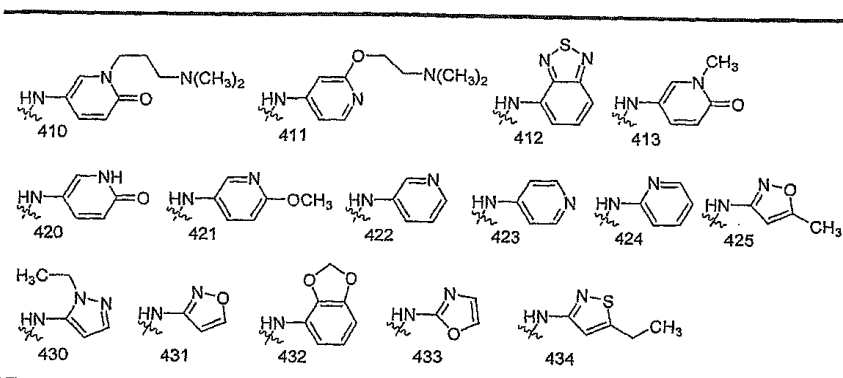
표 A6: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0826]

[0827]

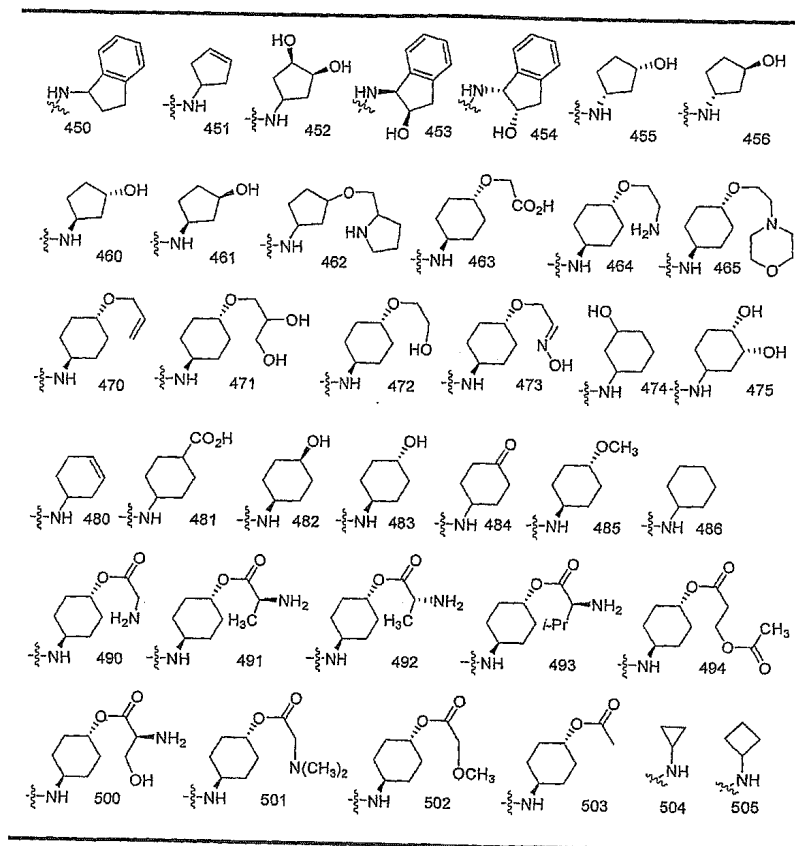
표 A7: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0828]

[0829]

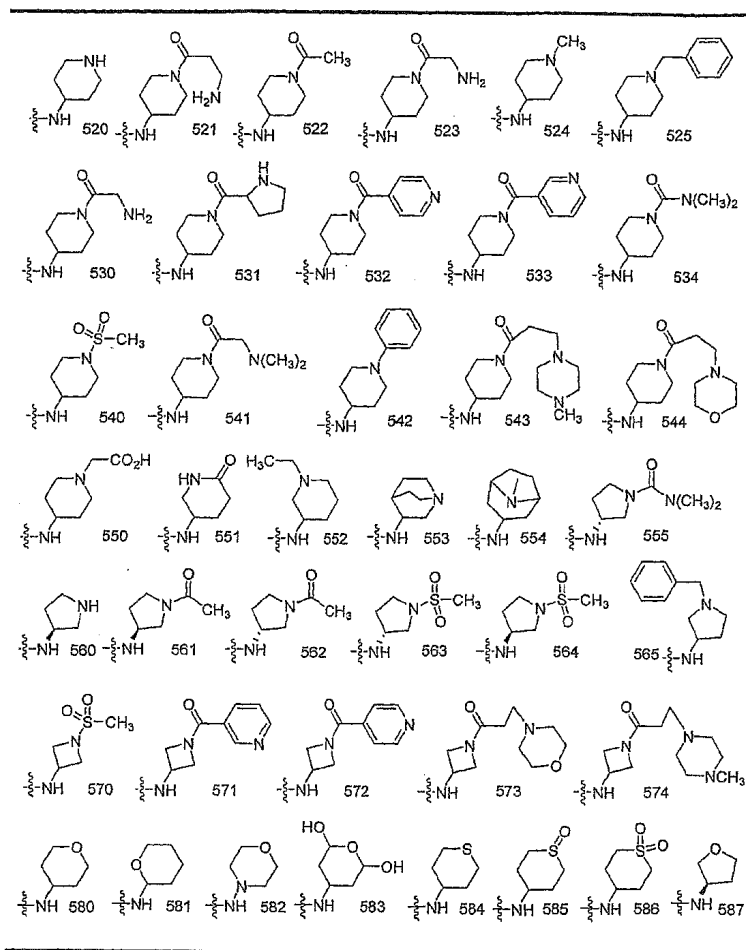
표 A8: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0830]

[0831]

표 A9: R₃, R₄의 구조 및 코드



[0832]

[0833]

표 B: Q₂, Q₁, Q₃의 구조 및 코드

N	C-H	C-C≡N	C-CH ₃	C-NH ₂	C-CH ₂ CH ₃	C-CF ₃	C-Br	C-Cl	C-F
B00	B01	B02	B03	B04	B05	B06	B07	B08	B09
B10	B11	B12	B13	B14	B15	B16	B17		
B20	B21	B22	B23	B24	B25				
B30	B31	B32	B33	B34	B35				
B40	B41	B42	B43	B44	B45				

[0834]

[0835]

표 C: X₁, Y의 구조 및 코드

N	C-H	C-CF ₃	C-CHF ₂	C-CH ₂ F	C-C≡N	C-NO ₂	C-Cl	C-Br	C-CF ₃	C-C≡CH
C00	C01	C02	C03	C04	C05	C06	C07	C08	C09	C10
C20	C21	C22	C23	C24	C25	C26	C27	C28	C29	
C30	C31	C32	C33	C34	C35	C36	C37			

[0836]

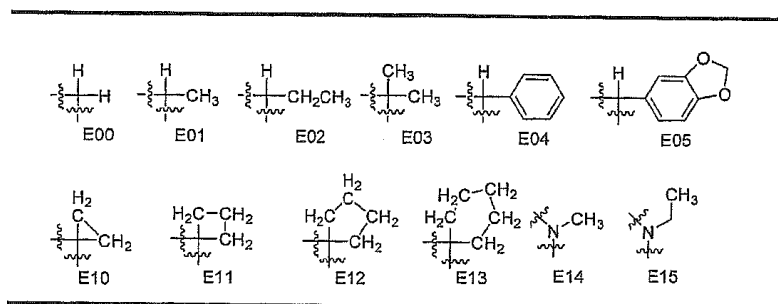
[0837]

표 D: R₁의 구조 및 코드

N	O	NH ₂	NH	NH	NH	NH	NH	O	S
D00	D01	D02	D03	D04	D05	D06	D07	D08	
D10	D11	D12							

[0838]

표 E: X_2 (R_5 , R_6)의 구조 및 코드



생물학적 평가

실시예 48

세포 증식 시험

암세포주 패널을 DCTP 튜머 리포지토리 (Tumor Repository), 미 국립 암 기구 (National Cancer Institute: Frederick, MD) 또는 ATCC (Rockville, MD)로부터 입수하였다. 세포 배양물을 10% 우태아 혈청 및 20 mM HEPES 완충액이 공급되고 최종 pH가 7.2이며 5% CO₂ 대기를 사용한 37°C에서 하이클론 RPMI 1640 배지 (Logan, UT)에서 유지하였다. 배양물을 서브-융합 밀도에서 유지하였다. 사람 배꼽 정맥 상피 세포 (HUVEC)를 캄브렉스 (Cambrex: Walkersville, MD)의 지사인 클로네틱스 (Clonetics)로부터 구입하였다. 배양물을 최종 pH가 7.2이며 5% CO₂ 대기를 사용한 37°C에서 20 mM HEPES가 공급된 클로네틱스 EGM-2 배지를 사용하여 저온보존된 원액으로부터 형성시켰다.

증식 검정을 위해, 세포를 세포주에 따라 다르지만 웰당 1,000 내지 2,500 세포로 96웰 플레이트 내의 적합한 배지에 씨딩하고, 이것을 밤새 인큐베이션하였다. 다음날, 시험 화합물, DMSO 용액 (음성 대조), 또는 액티노마이신 D (양성 대조)를 인산염 완충 식염수 중에서 준비된 10배 농도의 원액으로서 적당한 웰에 첨가하였다. 그런 다음, 세포주에 따라 다르긴 하나 증식이 일어나도록 세포 플레이트를 추가 2 내지 5일 동안 인큐베이션하였다. 세포 밀도를 측정하기 위해, 인산염 완충 식염수로 1:5로 희석시킨 50 μ l의 WST-1 용액 (Roche Applied Science, IN)을 각각의 웰에 첨가하고, 세포주에 따라 다르긴 하나 세포를 추가 1 내지 5시간 동안 인큐베이션하였다. 테칸 젠이오스프로 (Tecan GeniosPro) 플레이트 판독기 (RTP, NC)를 사용하여 450 nM에서 각각의 웰에 대한 광학 밀도를 측정하였다. 세포 성장율을, 시험 화합물의 존재하에서 세포 성장을 DMSO 비히클 (대조, 100% 성장)로 처리한 세포, 및 액티노마이신 D (10 μ M, 0% 성장)로 처리한 세포와 비교함으로써 측정하였다.

WST-1 측정한 직후에, 배지를 PC-3, NCI-H460 및 HUVEC 세포주로부터 제거하고, 플레이트를 -80°C에서 저장하였다. 이러한 검정 플레이트를 사용하여, 각 웰 내의 상대량의 DNA를 제조업자의 지시에 따라 R & D 시스템스 (Eugene, OR)로부터의 키쿠안트 (Cyquant) DNA 검정 키트를 사용하여 측정하였다. 각각의 화합물 처리에 대한 결과를 DMSO 비히클 대조 (100%) 및 10 μ M 액티노마이신 D 처리된 세포 (0%)와 비교하였다.

본 발명의 방법에 유용한 다수의 예시적인 화합물이 하기에 기술되어 있다. PC-3 세포 증식에 대한 이들의 억제 활성 범위가 입증되었는 데, 여기서 +++는 0.5 μ M 미만의 IC₅₀ 값을 나타내며, ++는 0.5 내지 5 μ M의 IC₅₀ 값, +는 5 내지 50 μ M의 IC₅₀ 값을 나타낸다.

화합물 70	+	화합물 103	++
화합물 72	++	화합물 27	+++
화합물 74	+	화합물 104	+++
화합물 76	++	화합물 105	+
화합물 77	+	화합물 106	++
화합물 81	+++	화합물 108	+++
화합물 82	++	화합물 110	+
화합물 84	++	화합물 112	+
화합물 93	++	화합물 113	+++
화합물 94	+	화합물 114	+++
화합물 5	++	화합물 31	+++
화합물 53	+	화합물 116	+++
화합물 55	++	화합물 117	+++
화합물 97	+++	화합물 121	++
화합물 98	+++	화합물 123	++
화합물 99	+	화합물 124	+++
화합물 100	+++	화합물 127	+++
화합물 19	+++	화합물 129	++
화합물 101	++	화합물 133	+
화합물 102	+	화합물 136	++

실시예 49

HSP-90에 대한 친화도 측정

(열 쇼크 단백질 90)

HSP-90에 대한 시험 화합물의 친화도를 다음과 같이 측정하였다: 다양한 기관 조직 (예를 들어, 비장, 간 및 폐)으로부터 취한 단백질 혼합물을 푸린 결합 단백질, 특히 HSP-90을 포획하기 위해 푸린 친화도 컬럼에 가역적으로 결합시켰다. 푸린 친화도 컬럼을 다수회 세척한 다음, 20 μ M, 100 μ M 및 500 μ M이 시험 화합물로 용리시켰다. 화학식 (I)의 화합물은 용량 의존적인 방식으로 HP-90을 용리시킨 데 반해, 대조 용리는 디메틸설폭사이드를 사용하였다. 화학식 (I)의 화합물의 용리 프로파일을 1차원 SDS 폴리아크릴아미드 겔 전기영동으로 측정하였다. 겔을 시프로 러비 (sipro ruby) (총 단백질의 1 fmol, 즉 40 kDa 단백질에 대해 0.04 ng 미만을 용이하하게 검출할 수 있는 고 민감성 형광 단백질 염색제) 또는 질산은과 같은 형광 염색제를 사용하여 염색시켰다. 겔을 표준 편평층 겔 영상화기를 사용하여 영상화시키고, 단백질량을 밀도계로 측정하였다. 각각의 농도에서 컬럼으로부터 용리된 HSP-90 단백질 퍼센트를 측정하고, IC₅₀ 값을 이들 측정치로부터 계산하였다. HSP-90을 함유하는 밴드를, 질량 분광계를 사용하는 단백질 서열화로 동정하였다.

본 발명의 화합물은 HSP-90 (열 쇼크 단백질 90)의 억제제이다. 본 발명의 방법에 유용한 다수의 예시적인 화합물이 하기되어 있다. HSP-90에 대한 이들의 상대적인 결합 친화도 범위가 입증되었는 데, 여기서 +++는 매우 높음, ++는 높음, 및 +는 중간 정도를 나타낸다:

화합물 30	++	화합물 55	++
화합물 70	+	화합물 96	+++
화합물 73	+	화합물 98	+++
화합물 75	+++	화합물 99	++
화합물 76	+++	화합물 102	++
화합물 77	++	화합물 103	++
화합물 78	+	화합물 105	++
화합물 79	+	화합물 34	++
화합물 80	+	화합물 107	++
화합물 83	+++	화합물 109	++
화합물 86	++	화합물 111	+++
화합물 87	++	화합물 115	+++
화합물 88	++	화합물 32	+++
화합물 91	++	화합물 117	+++
화합물 92	++	화합물 121	+++
화합물 94	++	화합물 131	++

화합물 50	+++	화합물 132	+++
화합물 53	++	화합물 133	++
화합물 95	+++	화합물 134	++
화합물 54	+	화합물 135	+++

본 발명, 및 이를 제조하고 이용하는 방식 및 방법을, 당업자가 이들을 제조하고 사용할 수 있도록 하기 위해 본원에서 충분하고 명료하고 명확하고 정확한 용어로 기술하였다. 상기한 설명들은 본 발명의 바람직한 구체예를 기술한 것이며 청구범위에 기재된 본원의 사상 또는 범주를 벗어나지 않고 본원에 변형이 이루어질 수 있음이 이해되어야 한다. 본 발명에 관한 내용을 구체적으로 나타내고 명확하게 청구하기 위해, 하기 청구범위가 본 명세서를 결론짓는다.