

【명세서】**【발명의 명칭】**

신규 레바미피드 전구체 및 그 제조방법과 용도

【기술분야】

<1> 본 발명은 신규 레바미피드 전구체(prodrug) 및 그 제조방법과 용도에 관한 것으로서, 보다 상세하게는 전체적인 반응공정이 단순하면서도 기존의 레바미피드 물질이 가지는 효과와 더불어 개선된 효능을 보이는 신규 물질인 레바미피드 전구체 및 이의 제조방법에 관한 것이다.

<2>

【배경기술】

<3> 레바미피드(Rebamipide)는 소화성 궤양 치료제로 사용되고 있고, 화학명은 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-[2(1H)-퀴놀론-4-일]프로피온산이다. 레바미피드는 위 궤양, 급성위염, 또는 만성 위염의 급성 악화로 인한 위 점막 손상의 치료에 탁월한 효과를 가지는 의약이다. 이 약제는 PGE2 생합성을 촉진시켜 점액을 증가시킴으로써 위점막을 보호하고, 세포증식을 촉진시키며, 특히 헬리코박터 필로균에 감염된 환자에 있어서 위점막세포에 대한 균의 점착 및 침윤을 억제시킴으로써 위염증을 억제하는 특징을 갖는다.

<4> 레바미피드의 작용기전은 프로스타글라딘의 생합성을 촉진하여 방어인자를 증강시킴은 물론 방어인자증강제 중에서는 유일하게 항산화 작용이 있어서 헬리코박터에 의한 염증을 제거하는 작용을 동시에 나타냄으로써 방어인자증강과 염증억제의 두 가지 작용을 동시에 갖고 있다. 그러므로 궤양이나 위염환자에서 재발률을 현저히 낮추고 치료기간을 단축할 수 있는 매우 효과적인 약물이다. 아세트산을 투여하여 위궤양을 발생시킨 쥐를 이용한 실험에서도 치료율은 개선되면서 궤양의 크기, 재발율이 모두 레바미피드에 의해 감소되는 것을 확인할 수 있었다.

<5>

<6> 종래에는 통상적으로 레바미피드의 제조 방법이나 고순도의 레바미피드를 얻는 방법들이 채택되었다. 그 예로서, 한국등록특허 제10-0669823호에는 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-[2(1H)-퀴놀론-4-일]프로피온산의 제조방법 및 그 중간체가 개시되어 있고, 한국등록특허 제10-1032600호에는 수득률이 높고 저렴한 제조원가로 반응 및 정제를 동시에 수행하여 순도 99.95%수준의 고품질의 레바미피드를 제조할 수 있는 고순도 레바미피드의 제조방법이 개시되어 있다.

<7>

<8> 한편, 레바미피드는 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 등을 예방 또는 치료하는데 유용한 효과를 보여주고 있으며, 최근의 연구결과에 의하면 레바미피드가 비만을 억제하는 효과를 보여 비만 치료제로서도 관심을 불러 일으키고 있어, 레바미피드를 유효성분으로 포함하는 치료용 조성물이 다양하게 개발되고 있다.

<9>

<10> 레바미피드는 디메틸포름아미드에 용해되며, 메탄올, 에탄올에 약간 용해되며, 에테르와 물에는 거의 용해되지 않는다. 레바미피드의 수용성 용해도(aqueous solubility)는 대략적으로 pH 3에서 0.0001%(w/v)을, pH 7에서 0.013%(w/v)라고 보고되어 있다. 레바미피드는 낮은 용해도와 낮은 멤브레인 투과성으로 인하여 생물 약제학 분류시스템(biopharmaceutiocs classification system : BCS)에서 Class로 등급이 매겨져 있으며, 체순환계에 거의 흡수 되지 않아 생체이용율(bioavailability)이 5% 내외로 알려져 있다. 이처럼 낮은 흡수율과 생체이용율로 인하여 상술한 것과 같은 다양한 효능을 가지는 레바미피드를 포함하는 약학 조성물을 개발하는데 있어 상대적으로 많은 양의 레바미피드를 복용하여야 하고, 때문에 투약시 환자들이 불편할 뿐만 아니라 약효도 투약량에 비해 현저하게 떨어지는 문제점이 남아 있었다. 이와 같이 낮은 수용성 용해도를 가지는 레바미피드의 경구 흡수율을 높이기 위해 다양한 노력들이 시도되고 있었으며, 특히 흡수촉진제(absorption enhancers)와 보조제의 도움을 받거나, 용해도를 증진시킨 다양한 형태의 염을 제조하는 기술들이 연구되어 왔으며, 대한민국공개특허 제10-2004-0104020호에서는 레바미피드 리지네이트와 레바미피드 아르기니네이트 및 이들을 유효성분으로 함유하는 약학적 제재에 대해 제안을 하였지만, 이의 인체에 대한 흡수율을 높이는 효과부분에 대해서는 의문이며, 이 이외에 유효하게 레바미피드의 체내 흡수율을 높일 수 있는 기술에 대해서는 제시되지 않고 있다.

<11>

<12> 본 발명은 상술한 것과 같은 다양한 증상에 대해 유용한 효과를 보여주고 있으나 체내 흡수율이 현저히 떨어지는 레바미피드를 전구체(prodrug)로 하여 체내에 대한 흡수율이 레바미피드에 비해 약 25배에 증가된 레바미피드 전구체 및 그 제조 방법 및 용도를 개시한다.

<13>

【발명의 상세한 설명】

【기술적 과제】

<14> 본 발명의 목적은 인체에 대한 흡수율을 증대시킨 신규 레바미피드 전구체를 제공하는 데 그 목적이 있다.

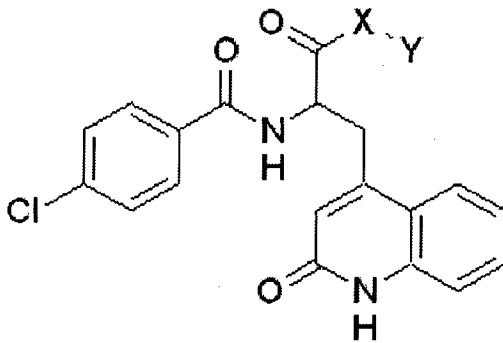
<15> 본 발명의 다른 목적은 인체에 대한 흡수율을 높인 상기 레바미피드 전구체를 제조하는 방법 및 용도를 제공함에 있다.

<16>

【기술적 해결방법】

<17> 상기 목적에 따라, 본 발명은 하기 화학식 I의 화합물, 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 이성질체, 수화물 및 용매화물로부터 선택된 화합물이 제공된다:

<18> [화학식 I]

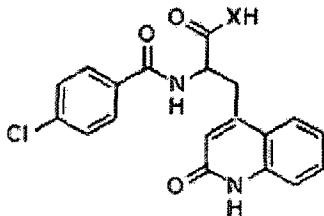


<19>

<20> 상기 식에서, X 및 Y는 본원에서 정의한 바와 같다.

<21> 상기 다른 목적에 따라 본 발명은 하기 화학식 II의 화합물을 하기 화학식 III의 화합물과 반응시키는 단계를 포함하는, 화학식 I의 화합물을 제조하는 방법을 제공한다:

<22> [화학식 II]



<23>

<24> [화학식 III]

<25> Y-Z

<26> 상기 식에서,

<27> X 및 Y는 전술한 바와 같으며, Z는 하이드록시, 아미노, 아민, 할로젠 또는 이탈기(Leaving group)이다.

<28> 상기 또 다른 목적에 따라 본 발명은 상기 레바미피드 전구체를 유효성분으로 포함하는 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염, 고지혈증, 고중성지방증, 당뇨, 과민성대장증후군의 예방 또는 치료 및 비만 치료 및 억제효과를 가지는 약제학적 조성물을 제공한다.

<29>

【유리한 효과】

<30> 본 발명은 인체에 대한 흡수율을 증대시킨 신규 물질인 레바미피드 전구체를 제공한다는 장점이 있다.

<31> 또한, 본 발명은 흡수율을 증대시킨 상기 레바미피드 전구체의 제조방법 및 용도를 제공한다는 다른 장점이 있다.

<32> 아울러, 본 발명에 의한 신규 레바미피드 전구체는 염을 형성시킴으로써 유리산으로 존재하는 레바미피드에 비해 체내 흡수율을 현저하게 증대시킴으로써 적은 양을 복용하더라도 효과적으로 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염, 비만, 고지혈증, 고중성지방증, 당뇨, 과민성대장증후군 등의 각종 질환을 예방 또는 치료하는데 유용하게 사용될 수 있다는 장점이 있다.

<33>

【도면의 간단한 설명】

<34> 도 1은 랫트의 전혈에서 실시예 47의 레바미피드 전구체의 레바미피드(모 약물)로의 변화를 분석한 결과를 도시한 것이다.

<35>

【발명의 실시를 위한 최선의 형태】

<36> 이하 본 발명을 상세히 설명한다.

<37>

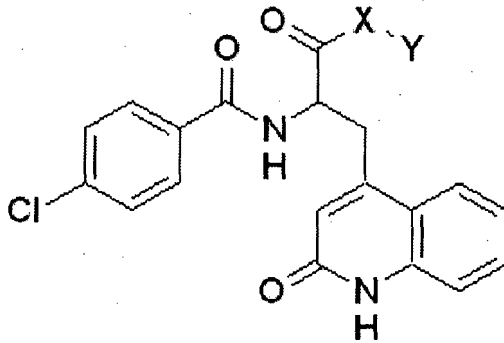
<38> 본 발명은 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 등의 예방 또는 치료 용도가 공지되어 있는 레바미피드의 전구체를 제공한다.

<39>

<40> 하나의 양태에 있어서, 하기 화학식 I의 화합물, 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 이성질체, 수화물 및 용매화물로부터 선택된 화합물이 제공된다:

<41>

[화학식 I]



<42>

<43>

상기 식에서,

<44>

X는 산소, 질소 또는 황 중 어느 하나이고;

<45>

Y는 C₁-C₆알킬, C₁-C₆할로알킬, (C₁-C₃알킬옥시)C₁-C₆알킬, (C₂-C₆알켄일옥시)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬카르보닐옥시)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬아미노)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₆알킬)(C₁-C₆알킬)아미노]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(아릴)아미노]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(아릴)C₁-C₃알킬]아미노C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(헤테로아릴)아미노]C₁-C₆알킬, (아릴카르보닐아미노)C₁-C₆알킬, C₂-C₆알켄일, C₂-C₆알카인일, C₂-C₆옥소알킬, C₃-C₈사이클로알킬, (C₃-C₈사이클로알킬)C₁-C₆알킬, (C₃-C₈사이클로알켄일)C₁-C₆알킬, (C₃-C₈헤테로사이클로알킬)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(아릴)C₁-C₃알킬]C₃-C₈헤테로사이클로알킬C₁-C₆알킬, [(C₁-C₆알킬옥시카르보닐)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시카르보닐)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, (C₃-C₈헤테로사이클로알킬)C₁-C₆알켄일, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로사이클로알켄일]C₁-C₆알킬, (아릴)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시)아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴옥시)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬설펜일)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시카르보닐)아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴옥시카르보닐)아릴]C₁-C₆알킬, (아릴)C₃-C₆알켄일, (헤테로아릴)C₁-C₆알킬, [(알킬옥시카르보닐)헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(C₃-C₈사이클로알킬)헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴)헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴)C₁-C₃알킬]헤테로아릴C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬옥시카르보닐)C₁-C₆알킬, [(C₃-C₈헤테로사이클로알킬)C₁-C₆알킬옥시카

르보닐] C_1-C_6 알킬, (C_3-C_8 헤테로사이클로알킬카르보닐) C_1-C_6 알킬, [$(C_1-C_3$ 알킬) C_3-C_8 헤테로사이클로알킬카르보닐] C_1-C_6 알킬, [$(C_3-C_8$ 사이클로알킬)옥시카르보닐옥시] C_1-C_6 알킬, [$(C_3-C_8$ 헤테로사이클로알킬)옥시카르보닐옥시] C_1-C_6 알킬, (유레이도) C_1-C_6 알킬, (아릴유레이도) C_1-C_6 알킬, [(아릴)(C_1-C_3 알킬유레이도) C_1-C_6 알킬, (C_1-C_6 알킬아미노카르보닐) C_1-C_6 알킬, [$(C_3-C_8$ 헤테로사이클로알킬)아미노카르보닐] C_1-C_6 알킬, [$(C_1-C_3$ 알킬) C_3-C_8 헤테로사이클로알킬]아미노카르보닐 C_1-C_6 알킬, [$(C_1-C_3$ 알킬)(C_1-C_3 알킬옥시)아미노카르보닐] C_1-C_6 알킬 또는 (C_3-C_8 헤테로사이클로알킬) C_1-C_6 알킬일 수 있다.

<46>

상기 C_1-C_6 알킬, C_2-C_6 알켄일, C_2-C_6 알카인일, C_2-C_6 옥소알킬, C_3-C_8 사이클로알킬, C_3-C_8 사이클로알켄일, C_3-C_8 헤테로사이클로알켄일, 아릴 또는 헤테로아릴은 C_1-C_3 알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 하이드록시기, 옥소, 니트로기 및 시아노기로 이루어진 군으로서 선택된 하나 이상의 치환기로 치환될 수 있다.

<48>

<49>

본원에 사용된 용어 "헤테로사이클로알킬" 또는 "헤테로사이클로알켄일"은 포화탄소 대신에 질소, 산소, 또는 황 중 어느 하나가 치환되거나, 같은 원자 또는 서로 다른 원자가 단일, 둘 또는 셋이 이웃하거나 또는 건너뛰어 치환됨을 의미한다. 상기 헤테로사이클로알킬 또는 헤테로사이클로알켄일의 예로는 아지리딘, 옥시란, 아제티딘, 옥세탄, 피롤리딘, 피롤린, 피라졸리딘, 피라졸린, 이미다졸리딘, 이미다졸린, 트리아졸리딘, 옥사졸리딘, 테트라하이드로퓨란, 테트라하이드로티오펜, 티아졸리딘, 다이옥솔린, 다이옥솔, 옥사티올란, 모폴린, 티오모폴린, 다이티안, 피페리딘, 피페라진, 피란, 다이옥산 또는 아제판을 들 수 있으나, 이에 제한되지는 않는다.

<50>

또한, 본원에 사용된 용어 "아릴"의 구체적인 예로는 벤젠, 나프탈렌, 안트라센, 또는 페난트렌을 들 수 있으나, 이에 제한되지는 않는다.

<51>

나아가, 본원에 사용된 용어 "헤테로아릴"은 질소, 산소, 또는 황 중 어느 하나가 치환되거나, 같은 원자 또는 서로 다른 원자가 단일, 둘 또는 셋이 이웃하거나 또는 건너뛰어 치환된 아릴을 의미한다. 상기 헤테로아릴의 구체적인 예로는 피롤, 이미다졸, 피라졸, 트리아졸, 퓨란, 티오펜, 옥사졸, 아이소옥사졸, 티아졸, 아이소티아졸, 옥사다이아졸, 티아다이아졸, 피리딘, 피리미딘, 피라진, 피리다진,

트리아진, 아제핀, 인돌, 벤즈이미다졸, 인다졸, 벤조옥사졸, 벤조아이소옥사졸, 벤조티아졸, 벤조트리아졸, 벤조퓨란, 벤조티오펜, 퀴놀린, 아이소퀴놀린, 퀴놀살린, 퀴나졸린, 시놀린, 나프티리딘, 포털라진, 벤조피란, 벤조옥사진, 벤조트리아진, 크로만, 크로멘, 벤조다이옥산 아트리딘, 페노티아진, 페노옥사진 또는 카바졸을 들 수 있으나, 이에 제한되지 않는다.

<52>

본원에서, X-Y는 아미노산 또는 아미노산 (C_1-C_3 알킬)에스테르를 나타낸다. 아미노산은 이에 제한되는 것은 아니나, 글라이신, 류신, 메티오닌, 발린, 알라닌, 아이소류신, 포롤린, 트립토판, 페닐알라닌, 세린, 트레오닌, 아스파라긴, 글루탐산, 라이신, 히스티딘, 또는 타이로신을 말한다.

<54>

<55> 바람직한 화학식 I의 화합물로는 하기를 들 수 있으나, 이에 제한되는 것은 아니다:

<56> 1) 메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-

일)프로피오네이트;

<57> 2) 에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-

일)프로피오네이트;

<58> 3) 3-메틸부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀-

린-4-일)프로피오네이트;

<59> 4) 헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<60> 5) 2-브로모에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<61> 6) 2-하이드록시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<62> 7) 메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<63> 8) 2-메톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<64> 9) 2-비닐옥시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<65> 10) 2-아세톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로

퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<66> 11) 2-메틸설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<67> 12) 2-페닐설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<68> 13) 2-메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<69> 14) 2-다이메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<70> 15) 2-다이메틸아미노-1-메틸-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<71> 16) 2-다이에틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<72> 17) 2-다이아이소프로필아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<73> 18) 3-다이메틸아미노프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<74> 19) 2-(메틸 페닐 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<75> 20) 2-(벤질 에틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<76> 21) 2-(벤조옥사졸-2-일 메틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<77> 22) 2-벤조일아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<78> 23) 알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<79> 24) 부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<80> 25) 3-메틸부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<81> 26) 프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로

퀴놀린-4-일)프로피오네이트

- <82> 27) 2-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <83> 28) 2-옥소부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <84> 29) 사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <85> 30) 사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <86> 31) 사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <87> 32) 사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <88> 33) 사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <89> 34) 사이클로펜트-3-엔일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <90> 35) 옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <91> 36) 3-메틸옥세탄-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <92> 37) 2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <93> 38) 2-피롤리딘-1-일-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <94> 39) 테트라하이드로퓨란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <95> 40) [1,3]다이옥솔란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <96> 41) 2-[1,3]-다이옥소란-2-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <97> 42) 1-메틸피페리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다

이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- <98> 43) 1-메틸피페리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <99> 44) 2-피페리딘-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <100> 45) 테트라하이드로피란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <101> 46) 2-[1,3]다이옥산-2-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <102> 47) 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <103> 48) 3-모폴린-4-일프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <104> 49) 4-모폴린-4-일부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <105> 50) 6-모폴린-4-일헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <106> 51) (4-메틸피페라진-1-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <107> 52) 2-(4-벤질피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <108> 53) 4-[4-(3-클로로페닐)피페라진-1-일]부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <109> 54) (4-*tert*-부틸옥시카르보닐피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <110> 55) 2-아제판-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <111> 56) 2-(2-옥소피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <112> 57) (2-옥소옥사졸리딘-5-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <113> 58) 4-모폴린-4-일-시스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-

1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- <114> 59) 4-모폴린-4-일-트랜스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <115> 60) 5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <116> 61) 벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <117> 62) 펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <118> 63) 2-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <119> 64) 3-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <120> 65) 3,4-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <121> 66) 3,5-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <122> 67) 3-플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <123> 68) 2,5-다이플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <124> 69) 3-시아노벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <125> 70) 3-니트로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <126> 71) 4-메톡시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <127> 72) 3-페녹시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <128> 73) 4-메틸설파닐벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <129> 74) (4-메틸옥시카르보닐)벤질 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-

다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- <130> 75) (3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <131> 76) 나프탈렌-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <132> 77) 안트라센-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <133> 78) 2-피롤-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <134> 79) (2-에톡시카르보닐)퓨란-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <135> 80) 2-티오펜-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <136> 81) 2-티오펜-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <137> 82) 2-이미다졸-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <138> 83) 5-사이클로프로필-2-메틸-2H-피라졸-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <139> 84) 3,5-다이메틸아이속사졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <140> 85) 2-(5-메틸-4-페닐옥사졸-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <141> 86) 2-메틸티아졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <142> 87) 2-(4-메틸티아졸-5-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <143> 88) 피리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <144> 89) 피리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <145> 90) 피리딘-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드

로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<146> 91) 2-(피리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<147> 92) 퀴놀린-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<148> 93) 퀴놀린-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<149> 94) 2-(1-메틸-1H-인돌-3-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<150> 95) 벤조티아졸-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<151> 96) 2,3-다이하이드로벤조[1,4]다이옥신-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<152> 97) 카바졸-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<153> 98) 메틸카바모일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<154> 99) 2-(4-메틸피페라진-1-일)-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<155> 100) 1-(4-메틸피페라진-1-카르보닐)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<156> 101) 2-모폴린-4-일-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<157> 102) (메톡시메틸카바모일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<158> 103) 2-에톡시카르보닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<159> 104) 2-에톡시카르보닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<160> 105) 2-모폴린-4-일-에톡시카르보닐메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

<161> 106) 2-모폴린-4-일에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하

이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐옥시]부티레이트;

- <162> 107) 2-(1,3-다이옥소-1,3-다이하이드로아이소인돌-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <163> 108) 사이클로헥실옥시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <164> 109) 2-모르폴린-4-일-에톡시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <165> 110) 2-유레이도에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <166> 111) 2-(3-페닐-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <167> 112) 2-(3-벤질-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <168> 113) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산;
- <169> 114) S-메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <170> 115) S-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <171> 116) S-프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <172> 117) S-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <173> 118) S-(3-메틸부틸)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <174> 119) S-헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <175> 120) S-(2-다이에틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <176> 121) S-(2-다이에틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <177> 122) S-(2-다이아이소프로필아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥

소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- <178> 123) S-(2-다이메틸아미노)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <179> 124) S-(2-벤조일아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트 옥살레이트;
- <180> 125) S-메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <181> 126) S-(2-벤조일옥시)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <182> 127) S-(2-메틸설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <183> 128) S-(2-페닐설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <184> 129) S-(2-벤젠설포닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <185> 130) S-(2-옥소부틸) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <186> 131) S-(2-우레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <187> 132) N,N-다이메틸 S-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)]티오키바메이트;
- <188> 133) S-알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <189> 134) S-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <190> 135) S-프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <191> 136) S-사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <192> 137) S-사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <193> 138) S-사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하

이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- <194> 139) S-사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <195> 140) S-사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <196> 141) S-(사이클로펜트-3-엔일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <197> 142) S-옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <198> 143) S-(테트라하이드로퓨란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <199> 144) S-(2-피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <200> 145) S-[2-(1-메틸피롤리딘-2-일)]에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <201> 146) S-([1,3]다이옥솔란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <202> 147) S-(2-[1,3]다이옥솔란-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <203> 148) S-(2-피페리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <204> 149) S-(1-메틸피페리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <205> 150) S-4-[4-(4-클로로페닐)피페라진-1-일]-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <206> 151) S-(2-모폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <207> 152) S-(테트라하이드로피란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <208> 153) S-(2-[1,3]-다이옥산-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <209> 154) S-(2-아제판-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이

하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- <210> 155) S-(5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <211> 156) S-벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <212> 157) S-펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <213> 158) S-(2-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <214> 159) S-(3-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <215> 160) S-(3,4-다이메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <216> 161) S-(4-플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <217> 162) S-(2,5-다이플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <218> 163) S-(3-클로로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <219> 164) S-(3,5-다이하로모벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <220> 165) S-(3-시아노벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <221> 166) S-(4-시아노벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <222> 167) S-(3-메톡시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <223> 168) S-(4-메톡시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <224> 169) S-(3-페녹시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <225> 170) S-(3-메톡시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- <226> 171) S-(3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- <227> 172) S-[2-(4-메틸티아졸-5-일)에틸] 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <228> 173) S-(피리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <229> 174) S-(피리딘-3-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <230> 175) S-(3-페닐알릴)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <231> 176) S-에톡시-3-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- <232> 177) 에틸 [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세테이트;
- <233> 178) [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세트산;
- <234> 179) 에틸 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]부티레이트;
- <235> 180) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-4-메틸 펜타노에이트;
- <236> 181) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-3-페닐 프로피오네이트;
- <237> 182) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-3-(1H-인돌-3-일)프로피오네이트;
- <238> 183) 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]펜탄-1,5-다이오에이트;
- <239> 184) 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]펜탄-1,5-다이오산;
- <240> 185) 4-클로로-N-[1-[2-(3H-이미다졸-4-일)에틸카바모일]-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드;
- <241> 186) 4-클로로-N-[2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)-1-(2-피롤리딘-

1-일-에틸카바모일)에틸]벤즈아마이드; 및

<242> 187) 4-클로로-N-[1-(2-모폴린-4-일-에틸카바모일)-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드.

<243>

<244> 또한, 본 발명에 따른 레바미피드 전구체는 염, 바람직하게는 약제학적으로 허용 가능한 염의 형태로 사용될 수 있다. 상기 염으로는 약학적으로 허용 가능한 유리산(free acid)에 의하여 형성된 산 부가염이 바람직하며, 상기 유리산으로는 유기산과 무기산을 사용할 수 있다. 상기 유기산은 이에 제한되는 것은 아니나, 구연산, 초산, 젖산, 주석산, 말레인산, 푸마르산, 포름산, 프로피온산, 옥살산, 트리플로오로아세트산, 벤조산, 글루콘산, 메탄설폰산, 글리콜산, 석신산, 4-톨루엔설폰산, 캄페설폰산, 글루탐산, 아스파르트산, 살리실산, 말론산, 말산 및 벤조설폰산을 포함한다. 또한 상기 무기산은 이에 제한되는 것은 아니나, 염산, 브롬산, 황산 및 인산을 포함한다.

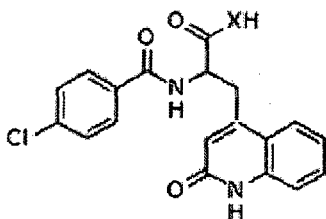
<245> 한편, 본 발명은 상기 화학식 I의 화합물의 이성질체 화합물도 범주에 포함한다. 예를 들어, 비대칭 탄소중심을 가질 수 있으므로 R 또는 S 이성질체를 포함하는 광학이성질체, 라세믹 화합물, 부분입체이성질체 혼합물, 또는 개개 부분입체 이성질체로서 존재할 수 있으며, 이들 모든 입체 이성질체 및 혼합물은 본 발명의 범위에 포함된다.

<246> 그 외에도, 화학식 I의 화합물의 용매화물 및 수화물 형태도 본 발명의 범위에 포함된다.

<247>

<248> 한편, 본 발명에 따른 화학식 I로 표시되는 레바미피드 전구체는, 하기 화학식 II의 화합물을 하기 화학식 III의 화합물과 반응시킴으로써 제조될 수 있다.

<249> [화학식 II]



<250>

<251> [화학식 III]

<252> Y-Z

<253> 상기 식에서,

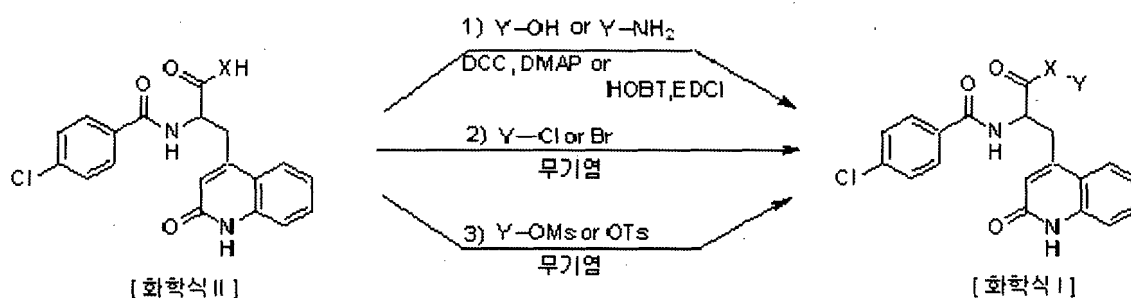
<254> X 및 Y는 전술한 바와 같으며, Z는 하이드록시, 아미노, 아민, 할로젠 또는 이탈기(Leaving group)이다.

<255> 본 발명의 하나의 실시형태에서, Z는 하이드록시, $-NH_2$, Cl, Br, 알킬설포닐 또는 아릴설포닐이다.

<256>

<257> 구체적으로, 본 발명의 화합물은 하기 [반응식 1]에 표기한 방법으로 제조할 수 있지만, 이에 제한되는 것은 아니다.

<258> [반응식 1]



<259>

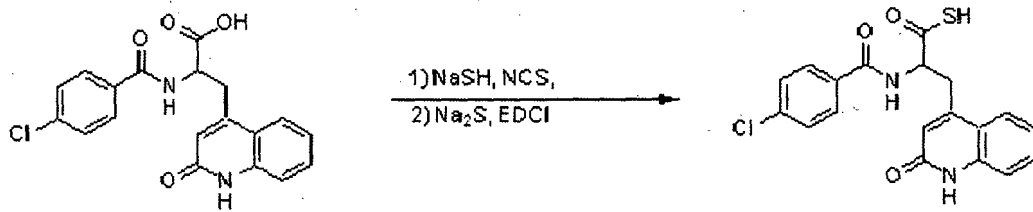
<260> (상기 식에서, X는 산소, 질소 또는 황 중 어느 하나이다).

<261> 상기 [반응식 1]에서 출발물질로 사용된 [화학식 II]의 화합물은 미국 특허 제4,578,381호에 기술된 방법에 의해 제조될 수 있다. 상기 [반응식 1]에 표기한 무기염은 소듐바이카보네이트, 소듐카보네이트, 포타슘바이카보네이트, 포타슘 카보네이트 또는 세슘카보네이트와 같은 무기 염기일 수 있으며, 용매는 아세톤, 다이메틸포름아마이드, 다이메틸설폭사이드, 또는 아세토나이트릴일 수 있고, 반응은 10 내지 100°C에서 1 내지 24시간 동안 수행할 수 있다. 상기 반응식에서 DCC는 다이사이클로헥실카보다이아이드; DMAP는 4-다이메틸아미노피리딘; HOBT는 1-하이드록시벤조트리아졸; 및 EDCI는 1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카보다이아이드 염산을 의미하며, Y-OMs 또는 Y-OTs은 설포닐기로서 메탄설포닐기와 같은 알킬설포닐기; 또는 파라톨루엔설포닐, 벤젠설포닐 또는 4-니트로벤젠설포닐기와 같은 아릴설포닐기를 포함한다.

<262>

<263> 상기 [반응식 1]에서 X가 황인 [화학식 II]의 화합물은 하기 [반응식 2]의 과정에 따라 제조될 수 있다.

<264> [반응식 2]



<265>

<266>

상기 [반응식 2]에서 소듐하이드로설파이드는 1 내지 10 당량, 바람직하게는 4 내지 6당량의 양으로 사용될 수 있고, 소듐설파이드는 1 내지 5 당량, 바람직하게는 2 내지 3 당량의 양으로 사용될 수 있다. 상기 [반응식 2]에서 용매로서 다이메틸포름아마이드, 다이메틸설폭사이드 또는 아세토나이트릴이 사용될 수 있고, 반응은 10 내지 100℃에서 1 내지 24시간 동안 수행될 수 있다. 상기 반응식에서 NCS는 N-클로로석시니마이드를 지칭한다.

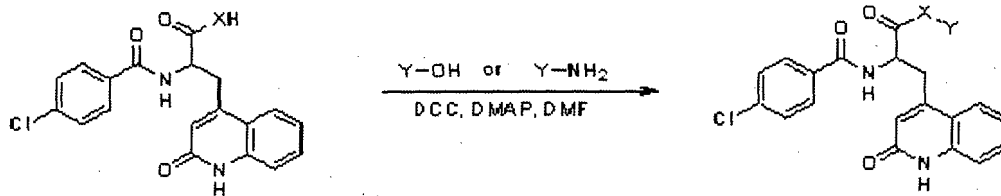
<267>

<268>

구체적으로, 본 발명의 화합물은 하기의 일반적인 실험방법에 따라 제조될 수 있다.

<269>

실험방법 A



<270>

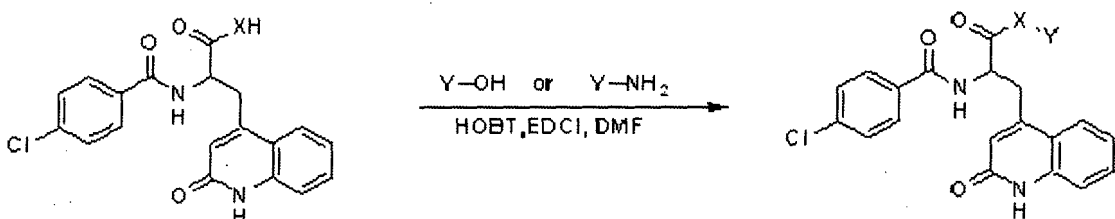
<271>

[화학식 II]의 화합물을 DMF(다이메틸포름아마이드, 화학식 II 화합물 무게의 8~10배 부피량)에 가열하여 녹인 후 0℃로 냉각시킨다. 상기 혼합물에 DCC(다이사이클로헥실카보다이아이드, 1~1.5 당량) 및 DMAP(다이메틸아미노피리딘, 0.1~0.3 당량)를 첨가한다. 첨가 후 내부온도가 안정화되면 알콜 또는 아민(1~1.2 당량)을 천천히 첨가한다. 상기 혼합물을 실온에서 4 내지 24시간 동안 교반한 후, 생성된 부산물을 여과하여 제거하고, 감압 하에 DMF를 제거한다. 이후, 메틸렌클로라이드 : 메탄올 (9:1, v/v)을 이용한 컬럼 크로마토그래피를 수행하여 고체 상태의 [화학식 I]의 화합물을 수득한다. 필요한 경우 재결정을 수행한다.

<272>

<273>

실험방법 B



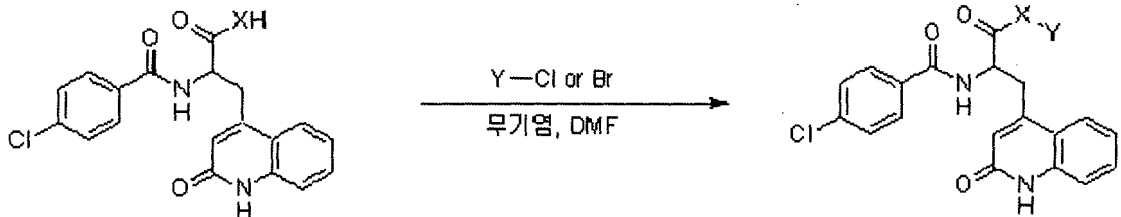
<274>

<275>

[화학식 II]의 화합물을 DMF(다이메틸포름아마이드, 화학식 II 화합물의 8~10배 부피량)에 가열하여 녹인 후 0℃로 냉각시킨다. 상기 혼합물에 EDCI(1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카보다이어마이드 염산, 1~3 당량) 및 HOBT(1-하이드록시벤조트리아졸, 1~3 당량)를 첨가한다. 첨가 후 내부온도가 안정화되면 알콜 또는 아민(1~1.5 당량)을 천천히 첨가한다. 상기 혼합물을 실온에서 4 내지 24시간 동안 교반한 후, 생성된 부산물을 여과하여 제거하고, 감압 하에 DMF를 제거한다. 이후, 메틸렌클로라이드 : 메탄올 (9:1, v/v)을 이용한 컬럼 크로마토그래피를 수행하여 고체 상태의 [화학식 I]의 화합물을 수득한다. 필요한 경우 재결정을 수행한다.

<276>

<277>

실험방법 C

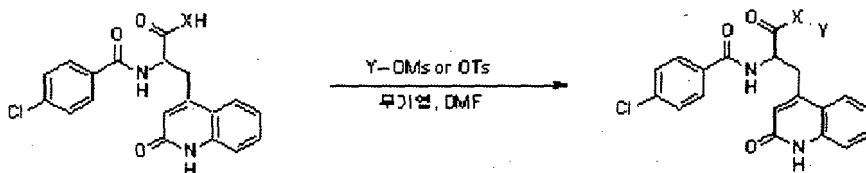
<278>

<279>

[화학식 II]의 화합물에 DMF(다이메틸포름아마이드, 화학식 II 화합물의 8~10배 부피량), 할로젠 화합물(1~1.5 당량) 및 무기염(1~2 당량)을 차례로 첨가하여 20~80℃에서 1~24시간 동안 반응시킨다. 반응 종료 후, 부산물을 여과하여 제거하고, 감압 하에 DMF를 제거한다. 이후, 메틸렌클로라이드 : 메탄올 (9:1, v/v)을 이용한 컬럼 크로마토그래피를 수행하여 고체 상태의 [화학식 I]의 화합물을 수득한다. 필요한 경우 재결정을 수행한다.

<280>

<281>

실험방법 D

<282>

<283>

[화학식 II]의 화합물에 DMF(다이메틸포름아마이드, 화학식 II 화합물의 8~10배 부피량), 설포네이트 화합물(1~1.5 당량) 및 무기염(1~2 당량)을 차례로 첨가하여 20~80℃에서 1~24시간 동안 반응시킨다. 반응 종료 후, 부산물을 여과하여 제거하고, 감압 하에 DMF를 제거한다. 이후, 메틸렌클로라이드 : 메탄올 (9:1, v/v)을 이용한 컬럼 크로마토그래피를 수행하여 고체 상태의 [화학식 I]의 화합물

을 수득한다. 필요한 경우 재결정을 수행한다.

<284>

<285>

더욱 구체적으로, 본 발명의 실시예 113의 화합물 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)-티오프로피온산은 실험방법 A 또는 B에 따라 다음과 같이 제조된다

<286>

실험방법 A

<287>

레바미피드 50 g(134.8 mmol)을 DMF(다이메틸포름아마이드) 400 mL에 가열하여 녹인 후 실온으로 냉각시킨다. 상기 혼합물에 DCC(다이사이클로헥실카보다이미드) 28.1 g(1.0eq, 134.8 mmol)을 가한 후 30분간 교반한다. 상기 혼합물에 NaSH(소듐하이드로설파이드) 16.0 g(1.0eq, 134.8 mmol)을 가한 후 실온에서 15 시간 동안 교반한다. 반응 종료 후, 상기 혼합물에 물 800 mL를 가한 다음, 에틸초산 800 mL로 3번 추출한다. 유기상에 무수 황산마그네슘을 가하여 건조하고 여과하고 농축한 다음, 잔류물에 에틸초산 800 mL를 가하여 실온에서 교반한다. 생성된 침전물을 여과하고 건조하여 노란색 고체의 표제화합물(42.0 g)을 수득한다.

<288>

실험방법 B

<289>

레바미피드 10 g(26.97 mmol)을 DMF(다이메틸포름아마이드) 80 mL에 가열하여 녹인 후 0°C로 냉각시킨다. 상기 혼합물에 EDCI(1-에틸-3-(3-다이메틸아미노프로필)카보다이미드 염산) 5.69 g(1.1eq, 29.67 mmol) 및 Na₂S(소듐설파이드) 13.6 g (3.0eq, 80.9 mmol)을 가한 후 얼음 수조를 제거한 다음 실온에서 3시간 교반한다. 반응 종료 후, 상기 혼합물에 물 160 mL를 가한 다음, 에틸초산 160 mL로 3번 추출한다. 유기상에 무수 황산마그네슘을 가하여 건조하고 여과하고 농축한 다음, 잔류물에 에틸초산 200 mL를 가하여 실온에서 교반한다. 생성된 침전물을 여과하고 건조하여 노란색 고체의 표제화합물(6.5 g)을 수득한다.

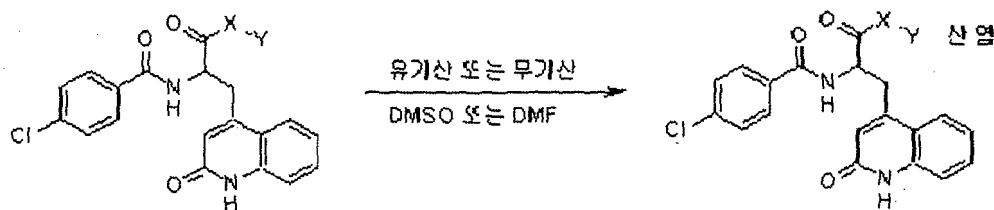
<290>

<291>

한편, 본 발명에 따른 레바미피드 전구체의 염은 하기의 일반적인 실험방법 E에 따라 제조될 수 있으나, 이에 제한되지 않는다.

<292>

실험방법 E



<293>

<294> [화학식 I]의 화합물을 다이메틸설폭사이드 또는 다이메틸포름아마이드([화학식 I]의 화합물 무게의 3~10배 부피)에 녹인다. 상기 혼합물에 유기산 또는 무기산([화학식 I]의 화합물의 1 당량)을 가하고 교반하여 고체화시켜 상기 [화학식 III]의 화합물을 수득한다.

<295>

<296> 본 발명의 화학식 I의 화합물은 유리산 상태의 레바미피드에 비해 체내 흡수율이 뛰어나므로, 레바미피드를 대체하여 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 또는 비만을 예방 또는 치료하는데 유용하게 사용될 수 있다. 상기 질환은 레바미피드가 예방 또는 치료할 수 있는 것으로 이미 공개되어 있는 것으로서, 본 발명의 레바미피드 전구체는 레바미피드보다 상기 질환에 더 효과적으로 사용될 것이다. 이에, 본 발명은 화학식 I의 화합물 또는 이의 약제학적으로 허용가능한 염을 유효성분으로 포함하는, 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 또는 비만의 예방 또는 치료용 약제학적 조성물을 제공한다.

<297>

<298> 본 발명에 따른 레바미피드 화합물 또는 그의 염의 약학적으로 유효한 양은 환자의 체중 1kg 당 0.5 ~ 100 mg/day, 바람직하게는 1 ~ 30 mg/day이다. 그러나 상기 약학적으로 유효한 양은 질환 증상의 정도, 환자의 연령, 체중, 건강상태, 성별, 투여 경로 및 치료기간 등에 따라 적절히 변화될 수 있다.

<299>

<300> 또한, 본 발명에 따른 약제학적 조성물을 약제학적으로 허용가능한 첨가제를 추가로 포함할 수 있다. 상기에서 약학적으로 허용가능한이란 생리학적으로 허용되고 인간에게 투여될 때, 통상적으로 위장 장애, 현기증과 같은 알레르기 반응 또는 이와 유사한 반응을 일으키지 않는 것을 의미한다. 상기 첨가제의 예로는 담체, 부형제 및 희석제 등을 들 수 있다. 상기 담체, 부형제 및 희석제의 예로는, 락토즈, 덱스트로즈, 수크로즈, 솔비톨, 만니톨, 자일리톨, 에리스리톨, 말티톨, 전분, 아카시아 고무, 알지네이트, 젤라틴, 칼슘 포스페이트, 칼슘 실리케이트, 셀룰로즈, 메틸 셀룰로즈, 폴리비닐피롤리돈, 물, 메틸하이드록시벤조에이트, 프로필하이드록시벤조에이트, 탈크, 마그네슘 스테아레이트 및 광물유를 들 수 있다. 또한, 충전제, 향응집제, 윤활제, 습윤제, 향료, 유화제 및 방부제 등을 추가로 포함할 수 있다.

<301>

또한, 본 발명의 약제학적 조성물은 포유동물에 투여된 후 활성 성분의 신

속, 지속 또는 지연된 방출을 제공할 수 있도록 당업계에 공지된 방법을 사용하여 제형화될 수 있다. 제형은 분말, 과립, 정제, 에멀전, 시럽, 에어로졸, 연질 또는 경질 젤라틴 캡셀, 멸균 주사용액, 멸균 분말의 형태일 수 있다.

<302> 본 발명에 따른 약제학적 조성물은 경구, 경피, 피하, 정맥 또는 근육을 포함한 여러 경로를 통해 투여될 수 있으며, 활성 성분의 투여량은 투여 경로, 환자의 연령, 성별, 체중 및 환자의 중증도 등의 여러 인자에 따라 적절히 선택될 수 있고, 치료하고자 하는 질환의 종류에 따라 상기 질환에 예방 또는 치료 용도가 있다고 공지되어 있는 화합물과 병용하여 투여될 수 있다.

<303>

<304> 또한, 본 발명은 화학식 I의 화합물을 이를 필요로 하는 대상에 투여하는 것을 포함하는, 대상에서의 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 또는 비만의 예방 또는 치료방법을 제공한다.

<305> 나아가, 본 발명은 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염 또는 비만의 예방 또는 치료를 위한 화학식 I의 화합물의 용도를 제공한다.

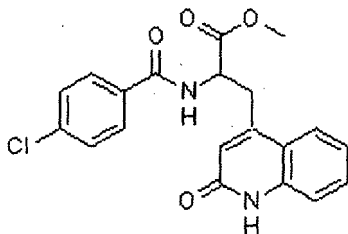
<306>

【발명의 실시를 위한 형태】

<307> 이하 본 발명을 실시예를 들어 상세히 설명하고자 하나, 본 발명의 범주가 상기 실시예에 의해 한정되는 것은 아니다.

<308>

<309> 실시예 1: 메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<310>

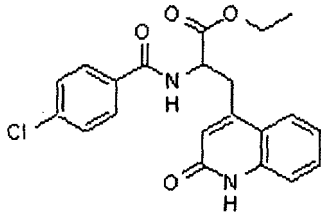
<311> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 메틸이오다이드 0.36 g(1.5 eq, 0.40 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<312> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.55(d, 2H), 7.31(d, 1H), 7.24(dd, 1H), 6.44(s, 1H), 4.79(m, 1H), 3.69(s,

3H), 3.47(dd, 1H), 3.27(q, 1H)

<313>

<314> 실시예 2: 에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



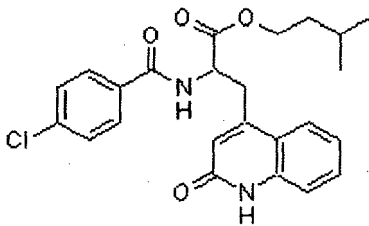
<315>

<316> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 아이오도에탄 0.62 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

<317> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.82(m, 3H), 7.55(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.12(q, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 1.17(t, 3H)}

<318>

<319> 실시예 3: 3-메틸부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



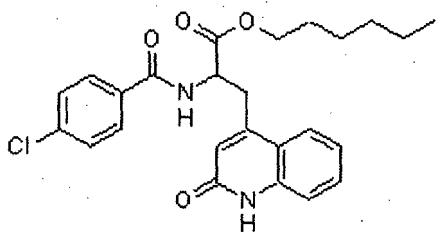
<320>

<321> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-브로모-3-메틸부탄 0.60 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

<322> ^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.84-7.80(m, 3H), 7.58-7.50(m, 2H), 7.50(t, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.24-7.21(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.77-4.74(m, 1H), 4.09(t, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 1.57-1.53(m, 1H), 1.43-1.40(m, 2H), 0.83(q, 6H)

<323>

<324> 실시예 4: 헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<325>

<326>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol)와 1-브로모헥산 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.1 g)을 얻었다.

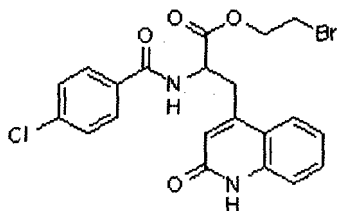
<327>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.82(q, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.06(t, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 1.51(t, 3H), 1.19(br-s, 6H), 0.81(t, 3H)

<328>

<329>

실시예 5: 2-브로모에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<330>

<331>

일반적인 실험방법 A에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-브로모에탄올 0.33 g(1.0 eq, 2.69 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

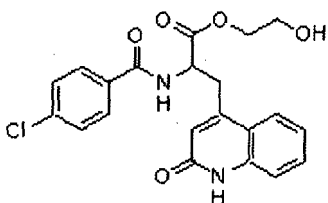
<332>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.11(d, 1H), 8.03(d, 1H), 7.85(m, 3H), 7.74(d, 1H), 7.55(m, 4H), 7.44(m, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.83(m, 3H), 4.52(m, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.33(m, 1H)

<333>

<334>

실시예 6: 2-하이드록시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



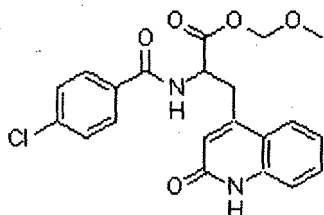
<335>

<336> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-브로모에탄올 0.50 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

<337> ^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.85-7.82(m, 3H), 7.57(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.88(t, 1H), 4.16-4.11(m, 2H), 3.61-3.58(m, 2H), 3.51(dd, 1H), 3.26(q, 1H)

<338>

<339> 실시예 7: 메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



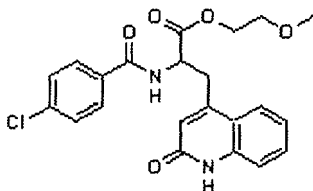
<340>

<341> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 클로로메틸 메틸 에테르 0.32 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

<342> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.83(br-s, 3H), 7.59-7.51(m, 3H), 7.32(d, 1H), 7.25(t, 1H), 6.47(s, 1H), 5.29(s, 2H), 4.80(m, 1H), 3.56-3.49(m, 5H)

<343>

<344> 실시예 8: 2-메톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<345>

<346> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 메틸 에테르 0.38g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

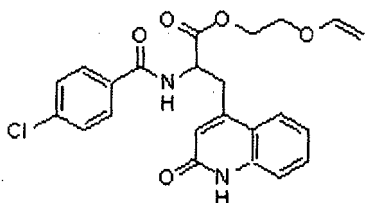
<347> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.82(t, 3H),

7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.21(m, 2H), 3.56-3.49(m, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 3.24(s, 3H)

<348>

<349>

실시예 9: 2-비닐옥시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<350>

<351>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 비닐 에테르 0.43 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

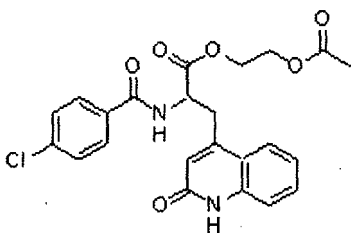
<352>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.57(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.52(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.21(m, 1H), 6.49(q, 1H), 6.45(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.36-4.27(m, 2H), 4.19(dd, 1H), 3.97(dd, 1H), 3.94-3.84(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.28(q, 1H)

<353>

<354>

실시예 10: 2-아세톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<355>

<356>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 아세테이트 0.49 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

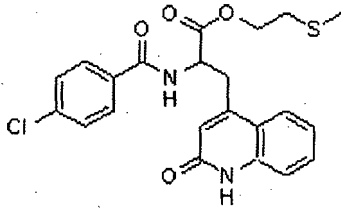
<357>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.36-4.29(m, 2H), 4.22-4.18(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 1.99(s, 3H)

<358>

<359>

실시예 11: 2-메틸설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<360>

<361>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 메틸 설파이드 0.44 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

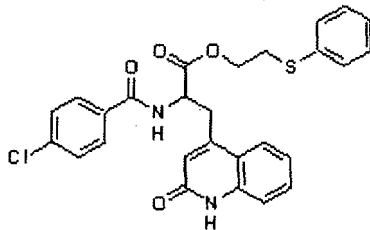
<362>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.84(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.25(m, 2H), 3.48(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 2.72(t, 2H), 2.07(s, 3H)

<363>

<364>

실시예 12: 2-페닐설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<365>

<366>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 페닐 설파이드 0.69 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

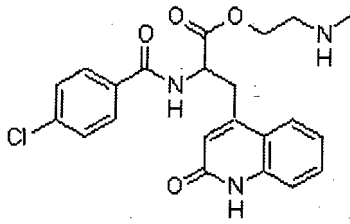
<367>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.58(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.39-7.30(m, 5H), 7.25-7.18(m, 2H), 6.45(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.25(m, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.29-3.22(m, 3H)

<368>

<369>

실시예 13: 2-메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<370>

<371>

일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (2-메틸아미노)에탄올 0.24 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

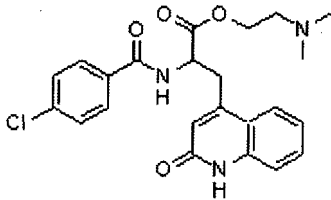
<372>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(s, 1H), 8.84(d, 1H), 8.17(q, 1H), 7.91(d, 1H), 7.86(d, 2H), 7.55(d, 2H), 7.48(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(m, 1H), 6.46(s, 1H), 4.79(m, 1H), 3.44(dd, 1H), 3.14(q, 1H), 2.90(d, 3H)

<373>

<374>

실시예 14: 2-다이메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<375>

<376>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (2-다이메틸아미노)에틸클로라이드 염산 0.57 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

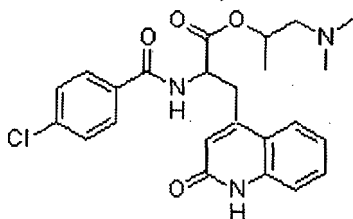
<377>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.15(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 2.43(m, 2H), 2.13(s, 6H)

<378>

<379>

실시예 15: 2-다이메틸아미노-1-메틸-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



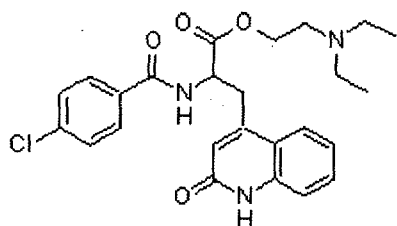
<380>

<381> 일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-다이메틸아미노-2-프로판올 0.33 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

<382> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.56(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.22(m, 1H), 6.46(t, 1H), 4.77(m, 1H), 4.18(m, 1H), 3.94(m, 1H), 3.46(dd, 1H), 3.30(m, 1H), 2.75(m, 1H), 2.15(dd, 6H), 1.16(m, 1H), 0.89(q, 2H)

<383>

<384> 실시예 16: 2-다이에틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



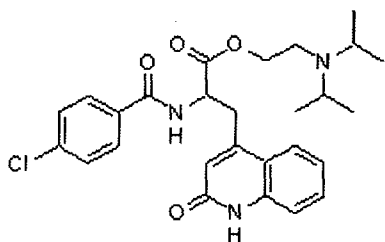
<385>

<386> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(다이에틸아미노)에틸 클로라이드 염산 0.69 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

<387> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.50(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.11(m, 2H), 3.49(dd, 1H), 3.28(m, 1H), 2.60(m, 2H), 2.48(q, 4H), 0.90(t, 6H)

<388>

<389> 실시예 17: 2-다이아이소프로필아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<390>

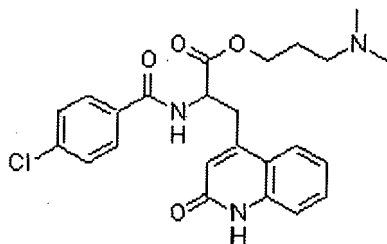
<391> 일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(다이아이소프로필아미노)에틸 클로라이드 염산 0.80 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색

고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

<392> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.02(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.80(m, 1H), 3.98(m, 2H), 3.46(dd, 1H), 3.27(m, 1H), 2.93(m, 2H), 2.55(t, 2H), 0.93(s, 6H), 0.91(s, 6H)

<393>

<394> 실시예 18: 3-다이메틸아미노프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



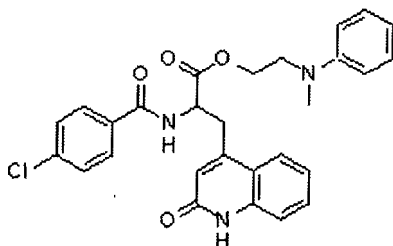
<395>

<396> 일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-다이메틸아미노-1-프로판올 0.33 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

<397> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.54(m, 3H), 7.32(d, 1H), 7.23(m, 1H), 6.45(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.09(m, 1H), 3.46(dd, 1H), 3.30(m, 1H), 2.16(t, 2H), 2.06(s, 6H), 1.66(m, 2H)

<398>

<399> 실시예 19: 2-(메틸 페닐 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<400>

<401> 일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(메틸페닐아미노)에탄올 0.49 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

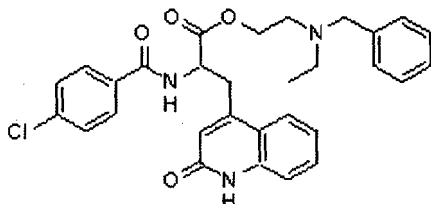
<402> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.80(d, 2H),

7.73(d, 1H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.21(t, 1H), 7.13(t, 2H), 6.70(d, 2H), 6.59(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.25(m, 2H), 3.66-3.54(m, 2H), 3.38(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.87(s, 3H)

<403>

<404>

실시예 20: 2-(벤질 에틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<405>

<406>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(벤질 에틸 아미노)에틸 클로라이드 염산 0.61 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

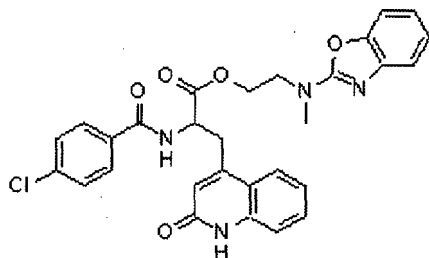
<407>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.83(d, 2H), 7.79(d, 1H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.27-7.24(m, 4H), 7.20(q, 2H), 6.47(s, 1H), 4.83-4.79(m, 1H), 4.22-4.14(m, 2H), 3.56(s, 2H), 3.46(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 2.69-2.64(m, 2H), 2.51-2.43(m, 2H), 0.92(t, 3H)

<408>

<409>

실시예 21: 2-(벤조옥사졸-2-일 메틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<410>

<411>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 벤조옥사졸-2-일-(2-클로로에틸)메틸 아민 0.85 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

<412>

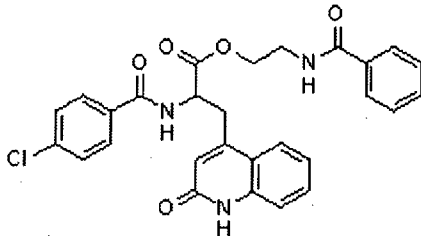
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 8.99(d, 1H), 7.96(s, 1H), 7.75(d, 2H), 7.63(d, 1H), 7.50(d, 2H), 7.46(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.27(d, 1H), 7.22(d, 1H), 7.09(t, 1H), 6.95(t, 1H), 6.38(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.41(m,

2H), 3.83(m, 2H), 3.38(dd, 1H), 3.17(dd, 1H), 3.14(s, 3H)

<413>

<414>

실시예 22: 2-벤조일아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<415>

<416>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로에틸 벤즈아마이드 0.74 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

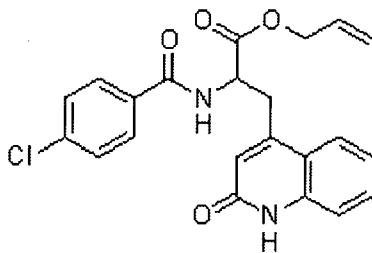
<417>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 8.67(d, 1H), 8.64(t, 1H), 7.84-7.77(m, 5H), 7.54-7.43(m, 6H), 7.29(d, 1H), 7.13(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.80(m, 1H), 4.38(m, 1H), 4.23(m, 1H), 3.61-3.50(m, 3H), 3.21(q, 1H)

<418>

<419>

실시예 23: 알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<420>

<421>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 알릴브로마이드 0.48 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

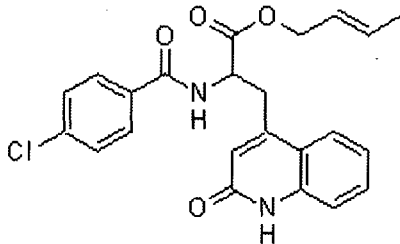
<422>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 5.94-5.84(m, 1H), 5.32-5.27(m, 1H), 5.22-5.19(dd, 1H), 4.85-4.80(m, 1H), 4.63-4.62(m, 2H), 3.47(dd, 1H), 3.30(q, 1H)

<423>

<424>

실시예 24: 부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<425>

<426>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-클로로-2-부텐 0.36 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

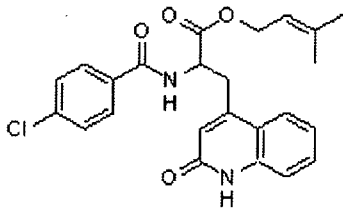
<427>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.02(d, 1H), 7.84-7.80(m, 3H), 7.57(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.43(s, 1H), 5.78-5.71(m, 1H), 5.55-5.48(m, 1H), 4.83-4.66(m, 1H), 4.54(d, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 1.65(t, 3H)

<428>

<429>

실시예 25: 3-메틸부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트



<430>

<431>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-클로로-3-메틸-2-부텐 0.42 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

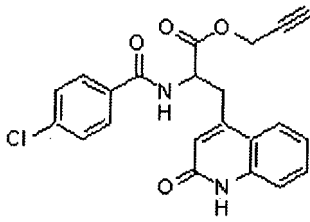
<432>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.00(d, 1H), 7.84-7.82(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.52-7.50(m, 2H), 7.49-7.46(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.22-7.20(m, 1H), 6.44(s, 1H), 5.26-5.25(m, 1H), 4.80-4.77(m, 1H), 4.60-4.59(m, 2H), 3.42(dd, 1H), 3.27(q, 1H), 1.71(s, 3H), 1.65(s, 3H)

<433>

<434>

실시예 26: 프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<435>

<436>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 프로파질토실레이트 0.84 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

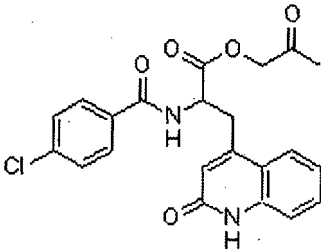
<437>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.84-7.80(m, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.81-4.76(m, 2H), 3.50-4.3(m, 1H), 3.32-3.26(m, 3H)

<438>

<439>

실시예 27: 2-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<440>

<441>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 클로로아세톤 0.37 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 이용하여 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

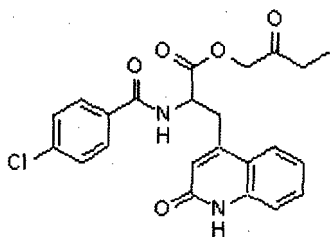
<442>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.84(t, 1H), 7.83(t, 1H), 7.81(d, 1H), 7.57(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.53-7.51(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.26-7.24(m, 1H), 6.50(s, 1H), 4.95-4.86(m, 3H), 3.58(dd, 1H), 3.31(q, 1H), 2.15(s, 3H)

<443>

<444>

실시예 28: 2-옥소부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<445>

<446>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-클로로-2-부탄온 0.43 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

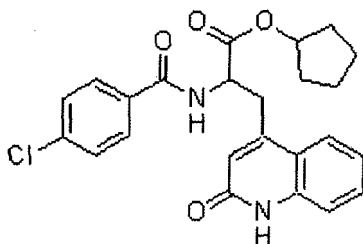
<447>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.25(t, 1H), 6.50(s, 1H), 4.97-4.85(m, 3H), 3.58(dd, 1H), 3.31(q, 1H), 2.47(q, 2H), 0.96(t, 3H)

<448>

<449>

실시예 29: 사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<450>

<451>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 클로로사이클로펜탄 0.42 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8g)을 얻었다.

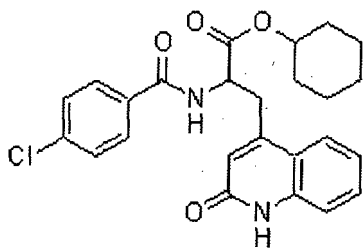
<452>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.02(d, 1H), 7.83(d, 2H), 7.81(d, 1H), 7.57(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.11-5.10(m, 1H), 4.71-4.68(m, 1H), 3.40(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 1.81-1.74(m, 2H), 1.65-1.62(m, 1H), 1.58-1.55(m, 5H)

<453>

<454>

실시예 30: 사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<455>

<456>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 클로로사이클로헥산 0.47 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

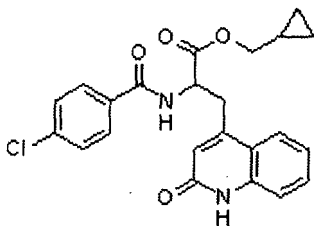
<457>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.01(d, 1H), 7.85-7.81(m, 3H), 7.58(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75-4.70(m, 1H), 3.45-3.37(m, 2H), 3.28(q, 1H), 1.75-1.56(m, 4H), 1.44-1.27(m, 6H)

<458>

<459>

실시예 31: 사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<460>

<461>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (클로로메틸) 사이클로프로판 0.36 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8g)을 얻었다.

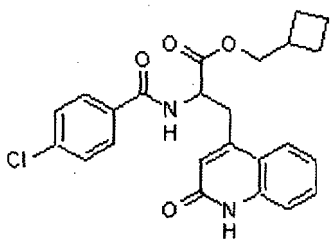
<462>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.86-7.80(m, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.78(m, 1H), 3.93(d, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 1.10-1.01(m, 1H), 0.51-0.45(m, 2H), 0.29-0.23(m, 2H)

<463>

<464>

실시예 32: 사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<465>

<466>

일반적인 실험방법 A에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 사이클로부탄 메탄올 0.28 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

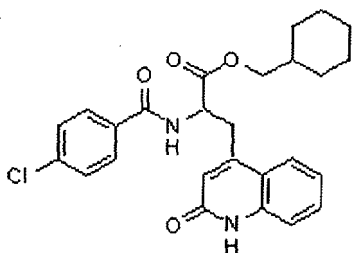
<467>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.84(t, 1H), 7.82(t, 1H), 7.81(d, 1H), 7.57(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.53-7.50(m, 1H), 7.321(dd, 1H), 7.24-7.22(m, 1H), 6.45(s, 1H), 4.77-4.75(m, 1H), 4.05-4.02(m, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 2.55-2.51(m, 1H), 1.94-1.90(m, 2H), 1.83-1.79(m, 1H), 1.75-1.69(m, 3H)

<468>

<469>

실시예 33: 사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<470>

<471>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 사이클로헥산 메탄올 0.37 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

<472>

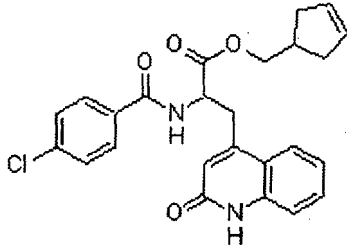
^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.84(t, 1H), 7.83(t, 1H), 7.81(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.53-7.50(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.24-7.22(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.79-4.76(m, 1H), 3.87(d, 2H), 3.42(dd, 1H), 3.31(q, 1H), 1.63-1.55(m, 5H), 1.50-1.49(m, 1H), 1.18-1.12(m, 2H), 1.07-1.03(m, 1H), 0.89-0.85(m, 2H)

<473>

<474>

실시예 34: 사이클로펜트-3-엔일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-

1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<475>

<476>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (사이클로펜트-3-엔일)메틸 토실레이트 1.02 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8g)을 얻었다.

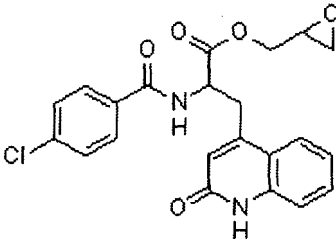
<477>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.84(t, 1H), 7.82(t, 1H), 7.80(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.53-7.50(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.25-7.22(m, 1H), 6.44(s, 1H), 5.64(s, 2H), 4.77-4.73(m, 1H), 4.02-3.97(m, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 2.53-2.51(m, 1H), 2.39-2.35(m, 2H), 2.05-2.01(m, 2H)

<478>

<479>

실시예 35. 옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<480>

<481>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)옥시란 0.37 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

<482>

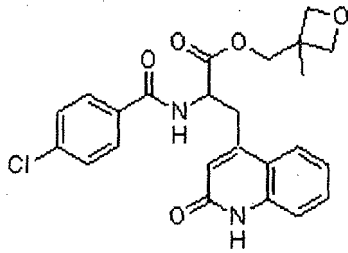
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.81(m, 3H), 7.57(s, 1H), 7.56(d, 1H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.09(m, 1H), 4.80(m, 1H), 4.60(t, 1H), 4.47-4.31(m, 3H), 4.22-4.18(m, 2H), 3.47(dd, 1H), 3.28(q, 1H)

<483>

<484>

실시예 36: 3-메틸옥세탄-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-

1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<485>

<486>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-메틸-3-옥세탄메틸 메탄설포네이트 0.72 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제 화합물(0.5 g)을 얻었다.

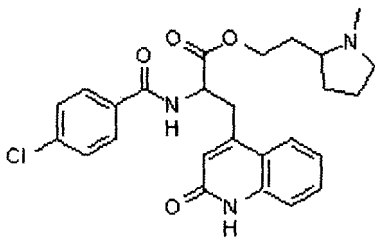
<487>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.82(d, 3H), 7.58-7.50(m, 3H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.36(t, 2H), 4.21(t, 4H), 3.48(dd, 1H), 3.36-3.30(m, 1H)

<488>

<489>

실시예 37: 2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<490>

<491>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-메틸-2-피롤리딘 에틸 메탄설포네이트 0.83 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

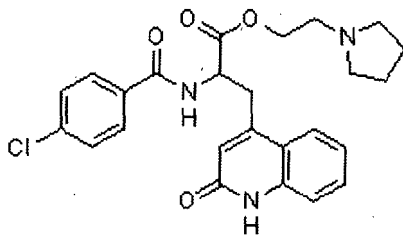
<492>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.95(m, 1H), 4.70(m, 1H), 3.41(dd, 1H), 3.30(m, 2H), 2.51-2.36(m, 3H), 2.20(s, 3H), 1.99-1.81(m, 2H), 1.70-1.51(m, 4H)

<493>

<494>

실시예 38: 2-피롤리딘-1-일-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<495>

<496>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-피롤리딘 에틸 메탄설포네이트 0.78 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

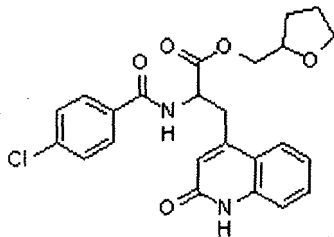
<497>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(m, 1H), 6.46(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.18(m, 2H), 3.46(dd, 1H), 3.30(m, 2H), 2.60(m, 1H), 2.41(d, 4H), 1.59(m, 4H)

<498>

<499>

실시예 39: 테트라하이드로퓨란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<500>

<501>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)테트라하이드로퓨란 0.48 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8g)을 얻었다.

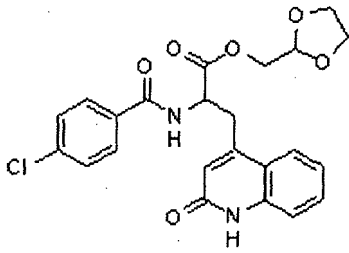
<502>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.85-7.81(m, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.79(m, 1H), 4.12-3.98(m, 32H), 3.72-3.58(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.32(q, 1H), 1.93-1.78(m, 1H), 1.77-1.72(m, 2H), 1.61-1.49(m, 1H)

<503>

<504>

실시예 40: [1,3]다이옥솔란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<505>

<506>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로메틸-1,3-다이옥솔란 0.49 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

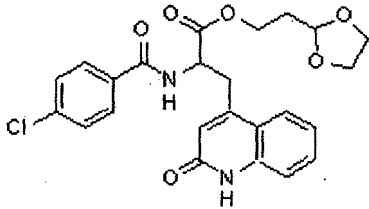
<507>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.84-7.82(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.53-7.51(m, 2H), 7.50-7.47(m, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23-7.21(m, 1H), 6.46(s, 1H), 5.07(t, 1H), 4.83-4.80(m, 1H), 4.17-4.10(m, 2H), 3.90-3.87(m, 2H), 3.84-3.80(m, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.29(q, 1H)

<508>

<509>

실시예 41: 2-[1,3]-다이옥소란-2-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<510>

<511>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(2-브로모에틸)-1,3-다이옥솔란 0.73 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

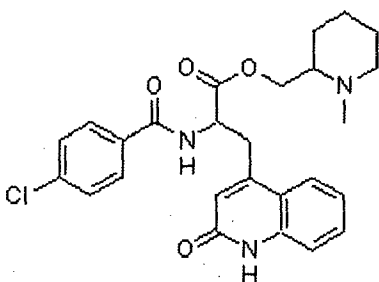
<512>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.82(d, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.83(t, 1H), 4.76(m, 1H), 4.19(m, 2H), 3.89-3.86(m, 2H), 3.76-3.72(m, 2H), 3.47(dd, 1H), 3.26(q, 1H), 1.88(q, 2H)

<513>

<514>

실시예 42: 1-메틸피페리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<515>

<516>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-메틸-2-피페리딘메틸 메탄설포네이트 0.83 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

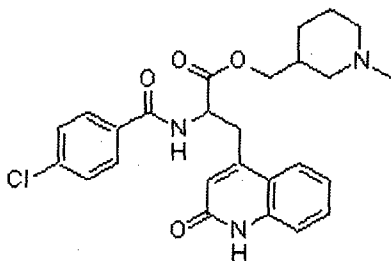
<517>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.85-7.81(m, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.77-4.69(m, 1H), 4.09-4.05(m, 1H), 3.45-3.40(m, 1H), 3.33-3.27(m, 4H), 2.73-2.67(m, 1H), 2.47-2.44(m, 2H), 1.99-1.91(m, 1H), 1.62-1.47(m, 4H), 1.41-1.38(m, 1H), 1.20-1.15(m, 1H)

<518>

<519>

실시예 43: 1-메틸피페리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<520>

<521>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-클로로메틸-1-메틸피페리딘 염산 0.74 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.3 g)을 얻었다.

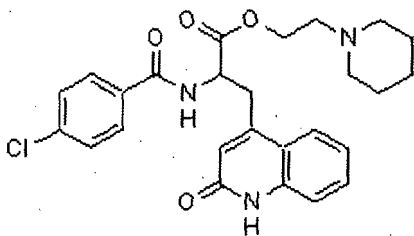
<522>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.07(dd, 1H), 7.86-7.81(m, 3H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.00-3.82(m, 2H), 3.47-3.40(m, 1H), 3.35-3.28(m, 1H), 2.58-2.50(m, 2H), 2.05(s, 3H), 1.77-1.72(m, 2H), 1.63-1.39(m, 4H), 0.92-0.84(m, 1H)

<523>

<524>

실시예 44: 2-피페리딘-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<525>

<526>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-클로로에틸)피페리딘 염산 0.74 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

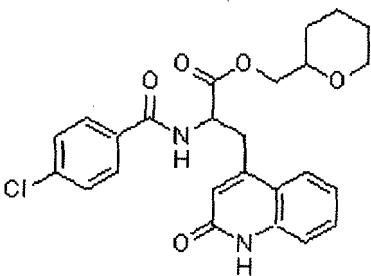
<527>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.58(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.50(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.23(m, 1H), 6.47(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.24(m, 1H), 4.12(m, 1H), 3.47(dd, 1H), 3.31(m, 2H), 2.48(m, 1H), 2.33(br-s, 4H), 1.40(m, 4H), 1.32(m, 2H)

<528>

<529>

실시예 45: 테트라하이드로피란-2-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<530>

<531>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)테트라하이드로-2H-피란 0.54 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

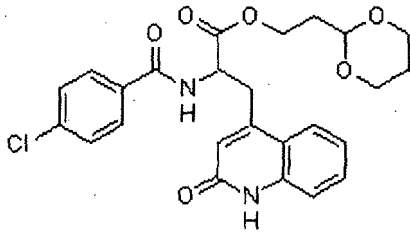
<532>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.07(dd, 1H), 7.85-7.82(m, 3H), 7.58(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.52(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.09-3.98(m, 2H), 3.89-3.86(m, 2H), 3.82(d, 1H), 3.47-3.39(m, 2H), 3.34-3.27(m, 2H), 1.74(br-s, 1H), 1.50-1.36(m, 4H), 1.21-1.17(m, 1H)

<533>

<534>

실시예 46: 2-[1,3]다이옥산-2-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<535>

<536>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(2-브로모에틸)-1,3-다이옥산 0.78 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

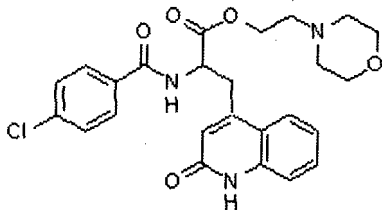
<537>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.57(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.54(t, 1H), 4.12(m, 2H), 3.95(dd, 2H), 3.62-3.56(m, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.28(q, 1H), 1.89-1.74(m, 3H), 1.28(d, 1H)

<538>

<539>

실시예 47: 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<540>

<541>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(2-클로로에틸)모폴린 염산 0.75 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

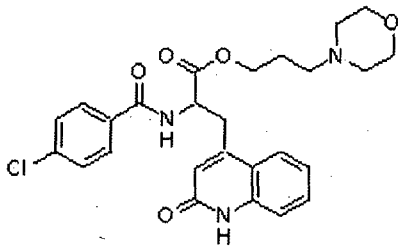
<542>

^1H NMR (DMSO- d_6): 9.0(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.53(m, 4H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.78-4.72(m, 1H), 4.26-4.14(m, 2H), 3.74(t, 1H), 3.66(t, 1H), 3.46(t, 6H), 3.30-3.24(m, 2H), 3.01-2.95(m, 2H)

<543>

<544>

실시예 48: 3-모폴린-4-일프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<545>

<546>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-(모폴린-4-일)프로필 염산메탄설포네이트 0.90 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

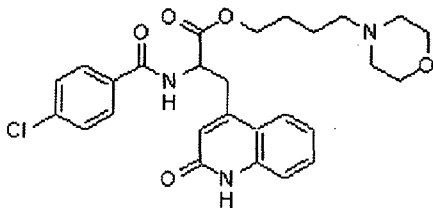
<547>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.81(d, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.17(t, 2H), 4.05(t, 2H), 3.53(t, 4H), 3.46(dd, 1H), 3.38-3.26(m, 6H), 1.89(m, 2H)

<548>

<549>

실시예 49: 4-모폴린-4-일부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<550>

<551>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(4-브로모부틸)모폴린 0.89 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

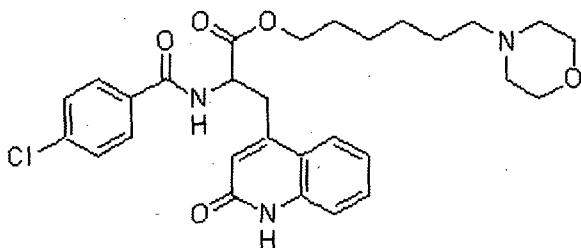
<552>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(d, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.13-4.08(m, 2H), 3.98(t, 2H), 3.52(m, 5H), 3.36-3.26(m, 5H), 1.61-1.54(m, 4H)

<553>

<554>

실시예 50: 6-모폴린-4-일헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<555>

<556>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(6-브로모헥실)모폴린 1.01 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

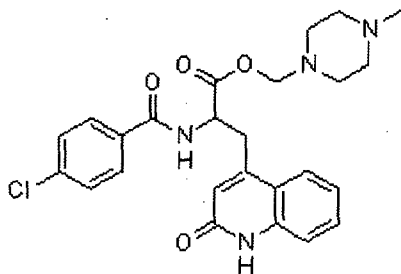
<557>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.82(m, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.06(m, 2H), 3.54(t, 4H), 3.43(dd, 1H), 3.35-3.27(m, 2H), 2.27(br-s, 4H), 2.16(t, 2H), 1.52(m, 2H), 1.31(m, 2H), 1.21(s, 4H)

<558>

<559>

실시예 51: (4-메틸피페라진-1-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<560>

<561>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-클로로메틸-4-메틸피페라진 0.60 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

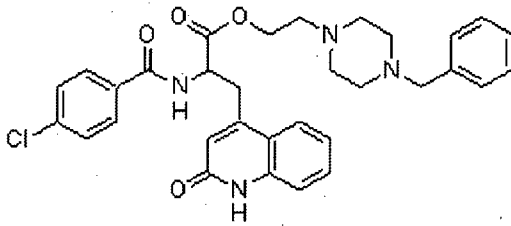
<562>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.85-7.82(m, 3H), 7.58-7.56(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.75-4.72(m, 1H), 3.42(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 1.76-1.57(m, 4H), 1.45-1.31(m, 6H)

<563>

<564>

실시예 52: 2-(4-벤질피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<565>

<566>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-벤질-4-(2-클로로에틸)피페라진 0.96 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

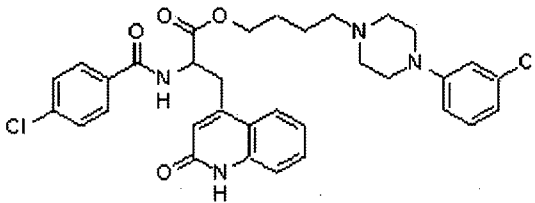
<567>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83-7.81(m, 3H), 7.55-7.53(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.33-7.30(m, 3H), 7.26-7.24(m, 3H), 7.21(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.77-4.74(m, 1H), 4.25-4.22(m, 1H), 4.17-4.13(m, 1H), 3.47(dd, 1H), 3.38(s, 2H), 3.28(q, 1H), 2.57-2.48(m, 4H), 2.41-2.26(m, 6H)

<568>

<569>

실시예 53: 4-[4-(3-클로로페닐)피페라진-1-일]부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<570>

<571>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-[4-(3-클로로페닐)피페라진-1-일]부틸 톨루엔설포네이트 1.70 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

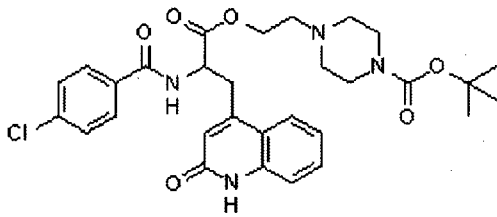
<572>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.84(m, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.22(m, 2H), 6.91(br-s, 1H), 6.86(dd, 1H), 6.77(dd, 1H), 6.46(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.11(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.56-3.28(m, 3H), 3.12(t, 4H), 2.40(t, 4H), 2.28(t, 2H), 1.72(m, 2H)

<573>

<574>

실시예 54: (4-*tert*-부틸옥시카르보닐피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<575>

<576>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 tert-부틸 4-(2-브로모에틸)피페라진-1-카르복실레이트 1.18 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

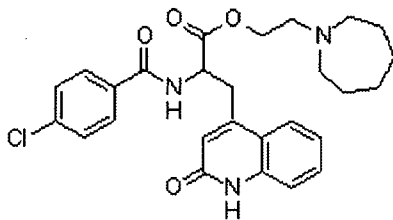
<577>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.85-7.81(m, 3H), 7.58-7.56(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.77-4.74(m, 1H), 4.25-4.16(m, 2H), 3.47(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 3.19(t, 4H), 2.74-2.50(m, 2H), 2.32(m, 4H), 1.38(s, 9H)

<578>

<579>

실시예 55: 2-아제판-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<580>

<581>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol)과 2-(헥사메틸렌이미노)에틸 클로라이드 염산 0.80 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 일반적인 실험방법 C를 이용하여 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

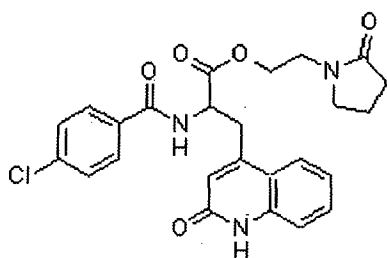
<582>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.84(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(m, 1H), 6.47(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.19(m, 1H), 4.11(m, 1H), 3.47(dd, 1H), 3.32(m, 1H), 2.57(m, 4H), 1.47(s, 8H)

<583>

<584>

실시예 56: 2-(2-옥소피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<585>

<586>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-브로모에틸)피롤리딘-2-온 0.77 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.3 g)을 얻었다.

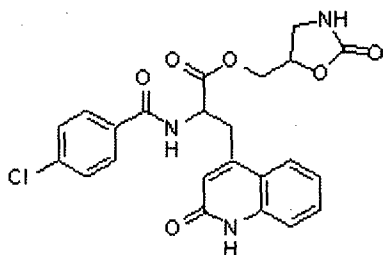
<587>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.24(m, 1H), 6.45(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.30-4.17(m, 2H), 3.50-3.45(m, 3H), 3.32(t, 2H), 3.24(q, 1H), 2.17-2.09(m, 2H), 1.86-1.78(m, 2H)

<588>

<589>

실시예 57: (2-옥소옥사졸리딘-5-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<590>

<591>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 5-클로로메틸-2-옥사졸리딘은 0.54 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

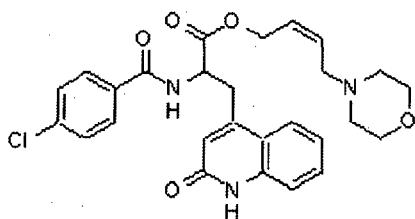
<592>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.82(d, 3H), 7.59-7.49(m, 4H), 7.31(d, 1H), 7.27-7.23(m, 1H), 6.46(s, 1H), 4.84-4.79(m, 2H), 4.31(d, 1H), 4.27(q, 1H), 3.62-3.53(m, 1H), 3.52(-3.47(m, 1H), 3.30-3.25(m, 2H)

<593>

<594>

실시예 58: 4-모폴린-4-일-시스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<595>

<596>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(4-브로모-시스-부트-2-엔일)모폴린 0.88 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제 화합물(0.6 g)을 얻었다.

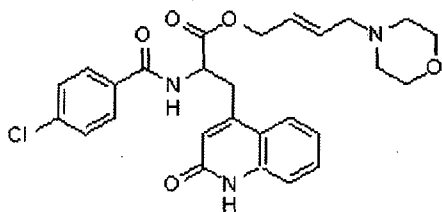
<597>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.76-5.62(m, 2H), 4.78(m, 1H), 4.60(m, 2H), 3.52(t, 4H), 3.44(dd, 1H), 3.30(m, 2H), 2.89(d, 2H), 2.28(s, 4H)

<598>

<599>

실시예 59: 4-모폴린-4-일-트랜스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<600>

<601>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(4-브로모-트랜스-부트-2-엔일)모폴린 0.88 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제 화합물(0.7 g)을 얻었다.

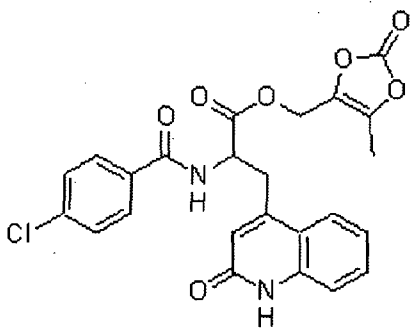
<602>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.82(t, 3H), 7.56(d, 2H), 7.50(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.75-5.63(m, 2H), 4.60(m, 2H), 3.52(t, 3H), 3.44(dd, 1H), 3.39-3.27(m, 2H), 2.89(d, 2H), 2.28(s, 3H)

<603>

<604>

실시예 60: 5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<605>

<606>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-클로로메틸-5-메틸-1,3-다이옥솔-2-온 0.60 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

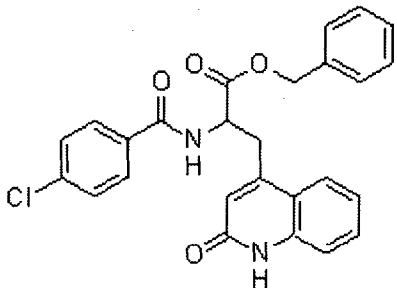
<607>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.82(m, 3H), 7.56(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.33(d, 1H), 7.20(t, 1H), 6.51(s, 1H), 5.05(s, 2H), 4.80(m, 1H), 3.47(dd, 1H), 3.32(m, 1H), 2.16(s, 3H)

<608>

<609>

실시예 61: 벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<610>

<611>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 벤질 브로마이드 0.69 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

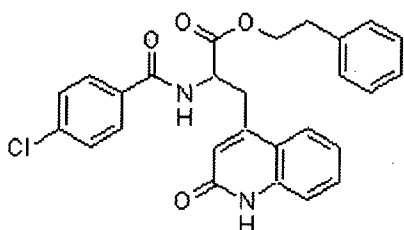
<612>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.84-7.82(m, 3H), 7.58-7.56(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.37-7.32(m, 6H), 7.21(t, 1H), 6.47(s, 1H), 5.16(q, 2H), 4.87-4.84(m, 1H), 3.50(dd, 1H), 3.33(q, 1H)

<613>

<614>

실시예 62: 펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<615>

<616>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (1-브로모에틸)벤젠 0.74 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

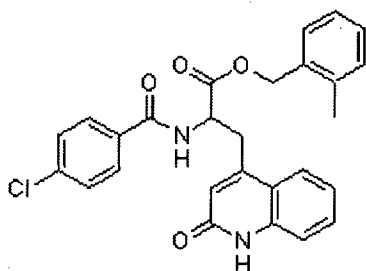
<617>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.01(d, 1H), 7.83(t, 1H), 7.81(t, 1H), 7.72(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.52(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.25-7.19(m, 6H), 6.43(s, 1H), 4.72(m, 1H), 4.39-4.02(m, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.89(t, 2H)

<618>

<619>

실시예 63: 2-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<620>

<621>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-메틸벤질 클로라이드 0.56 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

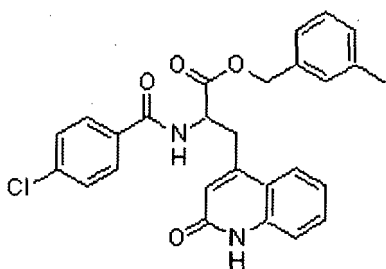
<622>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.81(d, 2H), 7.80(s, 1H), 7.57-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.27(d, 1H), 7.25-7.19(m, 3H), 7.16(t, 1H), 6.45(s, 1H), 5.21-5.12(q, 2H), 4.84-4.82(m, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.32(q, 1H), 2.24(s, 3H)

<623>

<624>

실시예 64: 3-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<625>

<626>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-메틸벤질 클로라이드 0.56 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

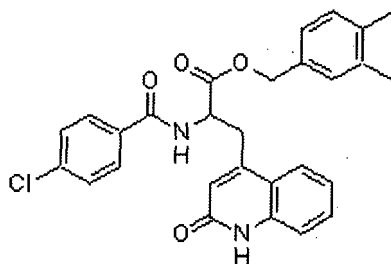
<627>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.58-7.56(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24-7.20(q, 2H), 7.13-7.09(m, 3H), 6.45(s, 1H), 5.15-5.07(q, 2H), 4.85-4.81(m, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.32(q, 1H), 2.25(s, 3H)

<628>

<629>

실시예 65: 3,4-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<630>

<631>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3,4-다이메틸벤질 클로라이드 0.62 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

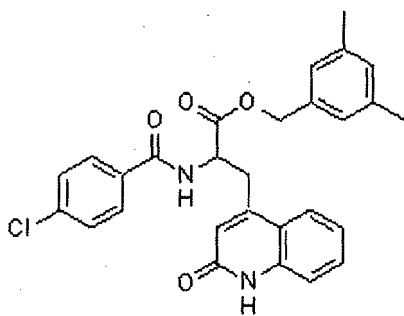
<632>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.84-7.79(m, 3H), 7.58-7.56(m, 2H), 7.52-7.51(m, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23-7.20(m, 1H), 7.14(t, 1H), 7.09(d, 1H), 7.06-7.03(m, 2H), 6.44(d, 1H), 5.11-5.03(q, 2H), 4.82(br-s, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.32(q, 1H), 2.19(s, 3H), 2.16(s, 3H)

<633>

<634>

실시예 66: 3,5-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<635>

<636>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3,5-다이메틸 벤질 클로라이드 0.62 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

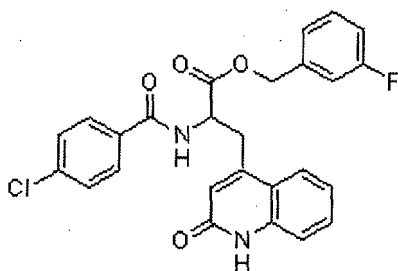
<637>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.84(d, 2H), 7.81(d, 1H), 7.57(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.93(s, 1H), 6.89(d, 1H), 6.46(s, 1H), 5.11-5.01(q, 2H), 4.83-4.82(m, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.33(q, 1H), 2.21(s, 6H)

<638>

<639>

실시예 67: 3-플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이 하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<640>

<641>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-플루오로벤 질 클로라이드 0.58 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

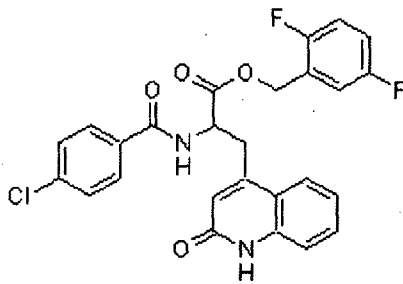
<642>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.83-7.81(m, 3H), 7.57-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.39(q, 1H), 7.31(d, 1H), 7.21(t, 1H), 7.18-7.14(m, 3H), 6.45(s, 1H), 5.23-5.15(q, 2H), 4.88-4.84(m, 1H), 3.51(dd, 1H), 3.33(q, 1H)

<643>

<644>

실시예 68: 2,5-다이플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이 하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<645>

<646>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2,5-다이플루오로벤질 브로마이드 0.83 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

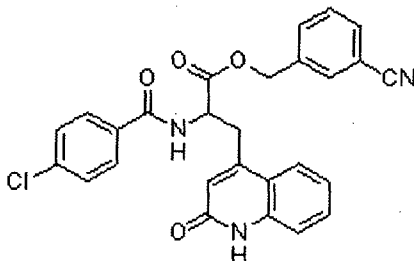
<647>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.79(d, 3H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.32-7.18(m, 5H), 6.44(s, 1H), 5.20(q, 2H), 4.86-4.83(m, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.29(q, 1H)

<648>

<649>

실시예 69: 3-시아노벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<650>

<651>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-메틸벤질 클로라이드3-(브로모메틸)벤조나이트릴 0.79 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

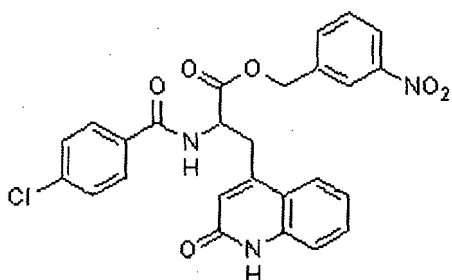
<652>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.84-7.80(m, 5H), 7.67(d, 1H), 7.60-7.55(m, 3H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.24-7.20(m, 1H), 6.45(s, 1H), 5.18(q, 2H), 4.87(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.33(q, 1H)

<653>

<654>

실시예 70: 3-니트로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<655>

<656>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-나이트로벤질 클로라브로마이드 0.87 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

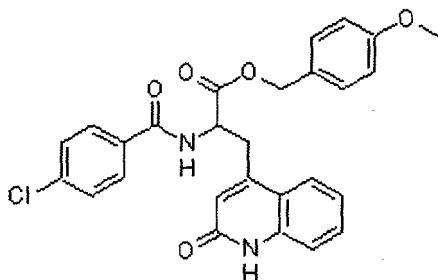
<657>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.13(d, 1H), 8.23(d, 1H), 8.18((dd, 1H), 7.83-7.80(m, 3H), 7.79(d, 1H), 7.66(t, 1H), 7.57-7.55(m, 2H), 7.51-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.21(t, 1H), 6.43(s, 1H), 5.35-5.28(q, 2H), 4.88-4.85(m, 1H), 3.51(dd, 1H), 3.33(q, 1H)

<658>

<659>

실시예 71: 4-메톡시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<660>

<661>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-메톡시벤질 클로라이드 0.63 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

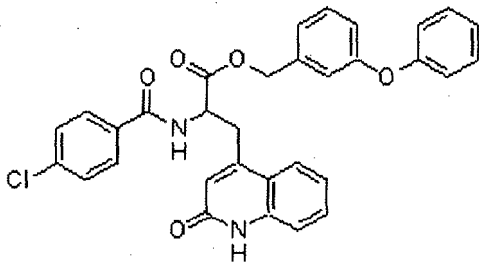
<662>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.82-7.79(m, 3H), 7.57-7.55(m, 2H), 7.50(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.26(d, 2H), 7.21(t, 1H), 6.91-6.89(m, 2H), 6.44(s, 1H), 5.12-5.06(q, 2H), 4.81-4.79(m, 1H), 3.75(s, 3H), 3.46(dd, 1H), 3.28(q, 1H)

<663>

<664>

실시예 72: 3-페녹시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<665>

<666>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-페녹시벤질 클로라이드 0.88 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.1 g)을 얻었다.

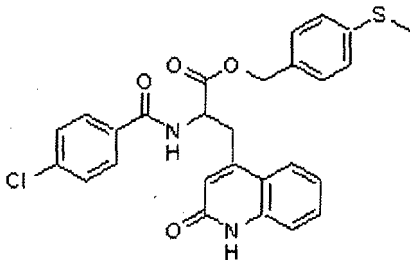
<667>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.07(d, 1H), 7.81-7.78(m, 3H), 7.52(d, 2H), 7.50(t, 1H), 7.38-7.30(m, 4H), 7.19(t, 1H), 7.121(t, 2H), 7.03(s, 1H), 6.95(d, 2H), 6.93(dd, 1H), 6.44(s, 1H), 5.22-5.13(q, 2H), 4.83(m, 1H), 3.46(dd, 1H), 3.29(q, 1H)

<668>

<669>

실시예 73: 4-메틸설파닐벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<670>

<671>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(메틸티오)벤질 클로라이드 0.69 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

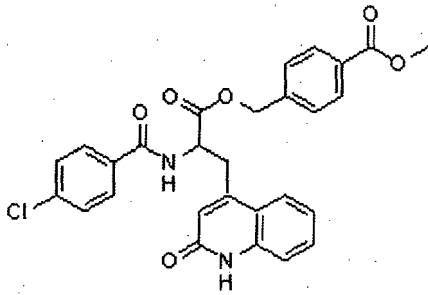
<672>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.82-7.80(m, 3H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.28-7.19(m, 5H), 6.45(s, 1H), 5.11(q, 2H), 4.86-4.80(m, 1H), 3.47(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 2.47(s, 3H)

<673>

<674>

실시예 74: (4-메틸옥시카르보닐)벤질 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<675>

<676>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 메틸(4-브로모메틸)벤조에이트 0.92 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

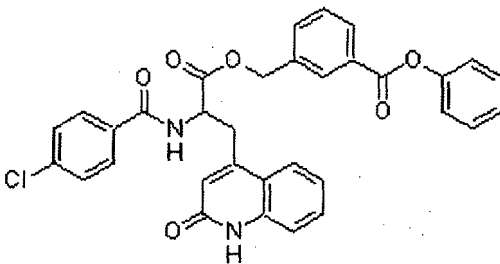
<677>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.96(d, 1H), 7.93-7.90(m, 1H), 7.83-7.79(m, 3H), 7.60(d, 1H), 7.57-7.48(m, 4H), 7.32(dd, 1H), 7.23-7.19(m, 1H), 6.44(s, 1H), 5.30-5.21(q, 2H), 4.88-4.82(m, 1H), 3.84(s, 3H), 3.50(dd, 1H), 3.31(q, 1H)

<678>

<679>

실시예 75: (3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<680>

<681>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (3-페닐옥시카르보닐)벤질 메실레이트 1.11 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

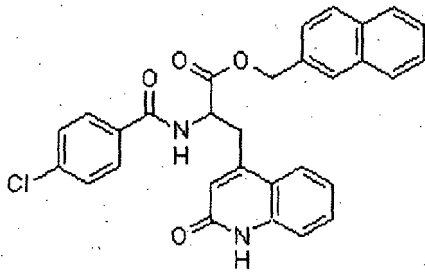
<682>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.10(d, 1H), 8.15(s, 1H), 8.08(d, 1H), 7.83-7.79(m, 3H), 7.69(d, 1H), 7.58(t, 1H), 7.58-7.46(m, 5H), 7.35-7.26(m, 4H), 7.21-7.17(m, 1H), 6.45(s, 1H), 5.30(q, 2H), 4.90-4.84(m, 1H), 3.51(dd, 1H), 3.30(q, 1H)

<683>

<684>

실시예 76: 나프탈렌-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<685>

<686>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (1-클로로메틸)나프탈렌 0.71 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

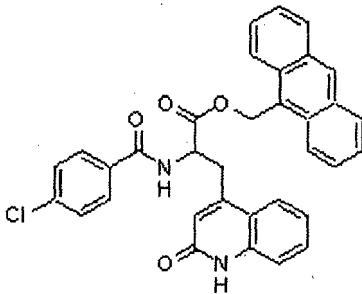
<687>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.12(d, 1H), 7.93-7.82(m, 7H), 7.58-7.45(m, 6H), 7.31(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.48(s, 1H), 5.29(q, 2H), 4.88(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.32(q, 1H)

<688>

<689>

실시예 77: 안트라센-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<690>

<691>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (9-클로로메틸)안트라센 0.91 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

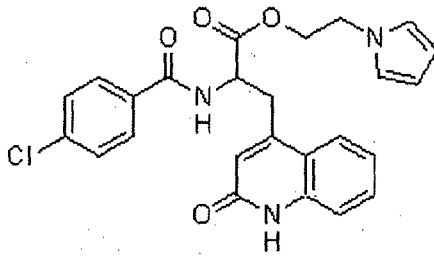
<692>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.01(d, 1H), 8.71(s, 1H), 8.32(d, 2H), 8.12(d, 2H), 7.70(t, 3H), 7.68-7.45(m, 7H), 7.28(d, 1H), 7.08(t, 1H), 6.40(s, 1H), 6.15(dd, 2H), 4.69(m, 1H), 3.40(dd, 1H), 3.22(q, 1H)

<693>

<694>

실시예 78: 2-피롤-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<695>

<696>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-브로모에틸)피롤 0.70 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

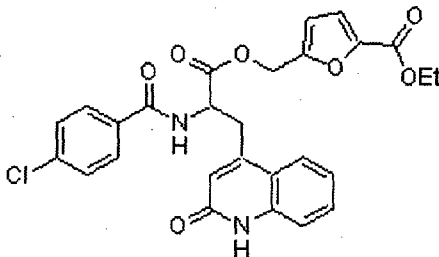
<697>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.83(t, 1H), 7.57(t, 1H), 7.73(d, 1H), 7.52(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.24(m, 1H), 6.76(t, 2H), 6.44(s, 1H), 5.93(t, 2H), 4.74-4.73(m, 1H), 4.40-4.35(m, 1H), 4.33-4.27(m, 1H), 4.17-4.13(m, 2H), 3.37(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<698>

<699>

실시예 79: (2-에톡시카르보닐)푸란-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<700>

<701>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 에틸 5-(클로로메틸)-2-푸란카르복실레이트 0.76 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

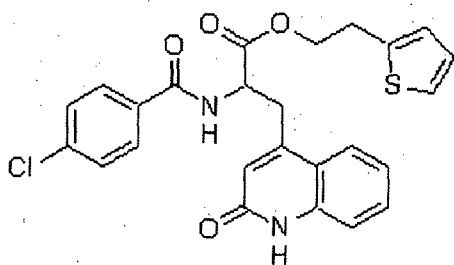
<702>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.79(d, 3H), 7.56(t, 2H), 7.50(t, 1H), 7.31-7.26(m, 2H), 7.21(t, 1H), 6.71(d, 1H), 6.43(s, 1H), 5.26-5.21(m, 2H), 4.82(br-s, 1H), 4.27(q, 2H), 3.45(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 1.27(t, 3H)

<703>

<704>

실시예 80: 2-티오펜-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<705>

<706>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-티오펜에틸 메탄설포네이트 0.83 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.6 g)을 얻었다.

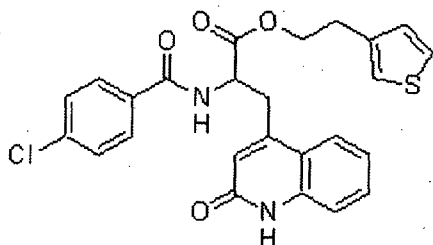
<707>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.83(t, 1H), 7.83(s, 1H), 7.81(s, 1H), 7.76(d, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.34-7.32(m, 2H), 7.25(t, 1H), 6.92-6.90(m, 2H), 6.45(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.37-4.26(m, 2H), 3.41(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 3.14(t, 2H)

<708>

<709>

실시예 81: 2-티오펜-3-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<710>

<711>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-티오펜에틸 메탄설포네이트 0.83 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.6 g)을 얻었다.

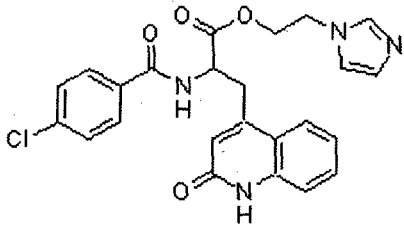
<712>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.83(t, 1H), 7.84(s, 1H), 7.82(s, 1H), 7.73(d, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.42(q, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24-7.21(m, 2H), 7.03(dd, 2H), 6.45(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.38-4.26(m, 2H), 3.37(dd, 1H), 3.23(q, 1H), 2.90(t, 2H)

<713>

<714>

실시예 82: 2-이미다졸-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<715>

<716>

일반적인 실험방법 A에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-하이드록시에틸)이미다졸 0.45 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.3 g)을 얻었다.

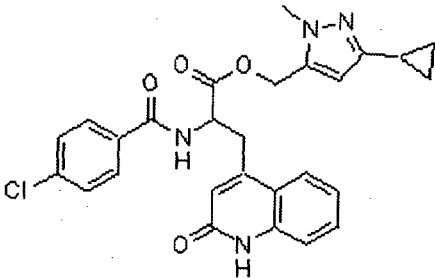
<717>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.04(d, 1H), 7.80(d, 2H), 7.73(d, 1H), 7.66(s, 1H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.25(t, 1H), 7.18(s, 1H), 6.85(s, 1H), 6.43(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.40(m, 2H), 4.28(m, 2H), 3.42(dd, 1H), 3.21(q, 1H)

<718>

<719>

실시예 83: 5-사이클로프로필-2-메틸-2H-피라졸-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<720>

<721>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 5-클로로메틸-3-사이클로프로필-1-메틸-1H-피라졸 0.68 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

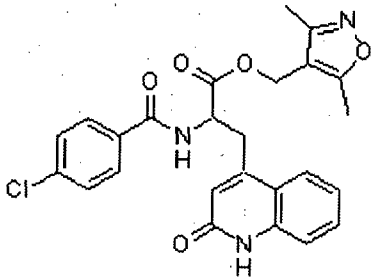
<722>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.79(d, 3H), 7.55(d, 2H), 7.49(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.99(s, 1H), 5.12(q, 2H), 4.80(m, 1H), 3.63(s, 3H), 3.46(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 1.80(m, 1H), 0.81(m, 2H), 0.57(m, 2H)

<723>

<724>

실시예 84: 3,5-다이메틸아이소옥사졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<725>

<726>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-클로로메틸-3,5-다이메틸아이소옥사졸 0.58 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

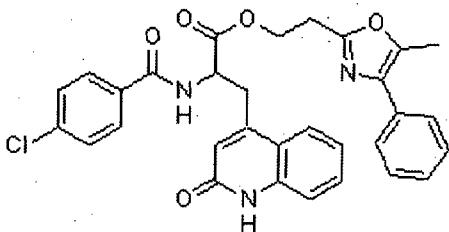
<727>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.05(d, 1H), 7.78(m, 3H), 7.57(t, 1H), 7.52(t, 1H), 7.50(m, 1H), 7.30(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.42(s, 1H), 4.99(q, 2H), 4.78(m, 1H), 3.43(dd, 1H), 3.27(q, 1H), 2.36(s, 3H), 2.13(s, 3H)

<728>

<729>

실시예 85: 2-(5-메틸-4-페닐옥사졸-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<730>

<731>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(2-브로모에틸)-5-메틸-4-페닐옥사졸 1.07 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

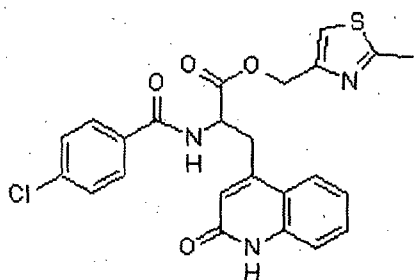
<732>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 8.98(d, 1H), 7.87(m, 2H), 7.79(s, 1H), 7.77(s, 1H), 7.73(d, 1H), 7.52-7.46(m, 6H), 7.30(d, 1H), 7.16(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.38(m, 1H), 4.36(m, 1H), 3.43(dd, 1H), 3.22(dd, 1H), 2.80(t, 2H), 2.25(s, 3H)

<733>

<734>

실시예 86: 2-메틸티아졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<735>

<736>

일반적인 실험방법 A에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-메틸-4-티아졸메탄올 0.42 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

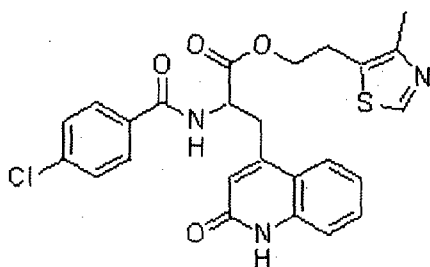
<737>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.81(d, 3H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.46(s, 1H), 7.36(d, 1H), 7.30(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.19(s, 2H), 4.84(m, 1H), 3.48(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 2.64(s, 3H)

<738>

<739>

실시예 87: 2-(4-메틸티아졸-5-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<740>

<741>

일반적인 실험방법 A에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-메틸-5-티아졸메탄올 0.46 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

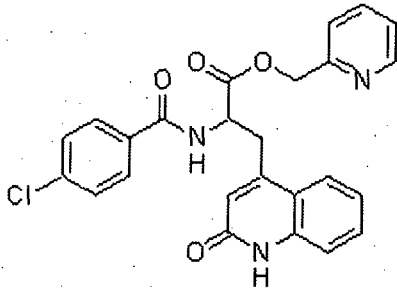
<742>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.04(d, 1H), 8.82(s, 1H), 7.81(d, 3H), 7.76(d, 1H), 7.56(d, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.80-4.77(m, 1H), 4.30-4.24(m, 2H), 3.42(dd, 1H), 3.24(q, 1H), 3.13-3.08(m, 2H), 2.30(s, 3H)

<743>

<744>

실시예 88: 피리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<745>

<746>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)피리딘 염산 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

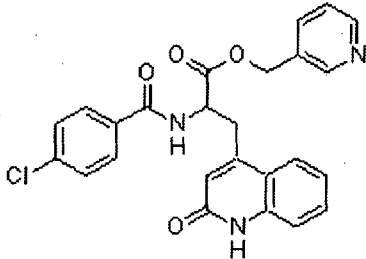
<747>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.13(d, 1H), 8.55(d, 1H), 7.86-7.78(m, 4H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.36(d, 1H), 7.34(m, 1H), 7.22(t, 1H), 6.48(s, 1H), 5.26(s, 2H), 4.92(m, 1H), 3.56(dd, 1H), 3.32-3.41(m, 1H)

<748>

<749>

실시예 89: 피리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<750>

<751>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 23-(클로로메틸)피리딘 염산 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

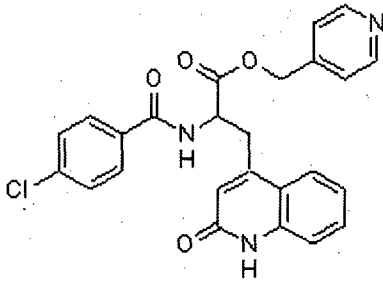
<752>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.09(d, 1H), 8.58(d, 1H), 8.54(dd, 1H), 7.83(t, 3H), 7.74(m, 1H), 7.57(m, 2H), 7.48(m, 1H), 7.39(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.21(m, 1H), 6.45(s, 1H), 5.21(q, 2H), 4.86(m, 1H), 3.50(dd, 1H), 3.33(m, 1H)

<753>

<754>

실시예 90: 피리딘-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<755>

<756>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-(클로로메틸)피리딘 염산 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

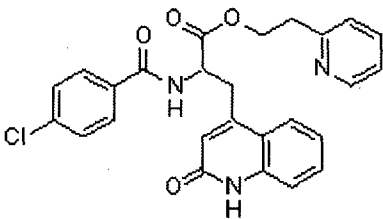
<757>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.14(d, 1H), 8.55(d, 2H), 8.54(d, 1H), 7.85(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.32(m, 3H), 7.21(t, 1H), 6.48(s, 1H), 5.23(q, 2H), 4.93(m, 1H), 3.54(dd, 1H), 3.38(m, 1H)

<758>

<759>

실시예 91: 2-(피리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<760>

<761>

일반적인 실험방법 D에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-피리딘에틸 메탄설포네이트 0.81 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

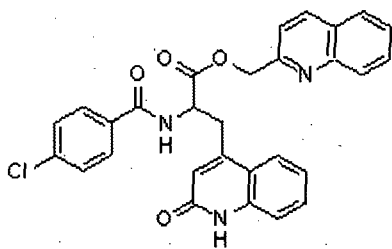
<762>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 8.99(d, 1H), 8.55(d, 2H), 8.48(s, 1H), 7.78(d, 2H), 7.66-7.51(m, 5H), 7.32-7.20(m, 4H), 6.42(s, 1H), 4.69(br-s, 1H), 4.54-4.45(m, 2H), 3.34(d, 1H), 3.18(d, 1H), 3.06(d, 2H)

<763>

<764>

실시예 92: 퀴놀린-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<765>

<766>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)퀴놀린 염산 0.86 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

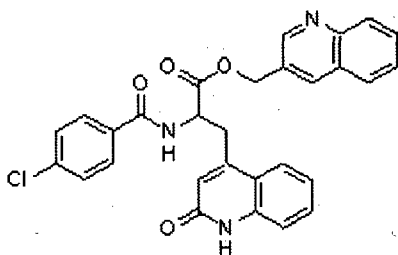
<767>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.16(d, 1H), 8.38(d, 2H), 7.99(t, 2H), 7.88(t, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.78(m, 1H), 7.62(m, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 2H), 7.32(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.52(s, 1H), 5.47(s, 2H), 4.97(m, 1H), 3.67(dd, 1H), 3.39(m, 1H)

<768>

<769>

실시예 93: 퀴놀린-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<770>

<771>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-(클로로메틸)피리딘 염산 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.8 g)을 얻었다.

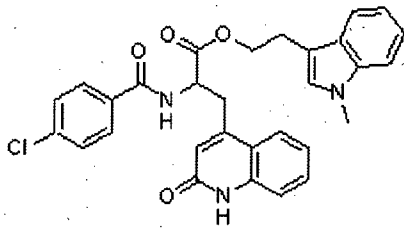
<772>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.31(s, 1H), 9.15(d, 1H), 8.13(d, 2H), 7.87-7.84(m, 4H), 7.81-7.78(m, 1H), 7.75(s, 1H), 7.72-7.68(m, 1H), 7.58-7.77(m, 2H), 7.52-7.48(m, 1H), 7.23(q, 1H), 7.21-7.20(m, 1H), 6.50(s, 1H), 5.39(q, 2H), 4.97-4.91(m, 1H), 3.57(dd, 1H), 3.37(m, 1H)

<773>

<774>

실시예 94: 2-(1-메틸-1H-인돌-3-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<775>

<776>

일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 3-(2-하이드록시에틸)-1-메틸인돌 0.56 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 일반적인 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.3 g)을 얻었다.

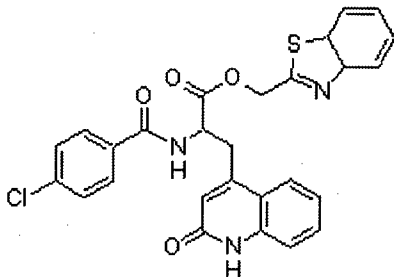
<777>

^1H NMR (400MHz, DMSO-d₆): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.84(s, 1H), 7.82(s, 1H), 7.73(d, 1H), 7.57(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.34(q, 2H), 7.19(t, 1H), 7.13(t, 1H), 7.11(s, 1H), 6.99(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.40-4.27(m, 2H), 3.65(s, 3H), 3.39(dd, 1H), 3.24(m, 1H), 2.98(t, 2H)

<778>

<779>

실시예 95: 벤조티아졸-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<780>

<781>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(클로로메틸)벤조티아졸 0.74 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

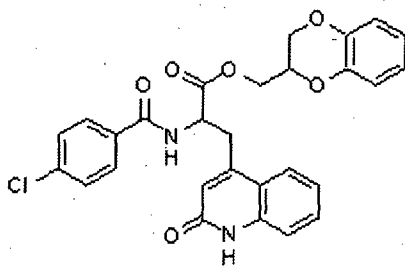
<782>

^1H NMR (400MHz, DMSO-d₆): 11.70(s, 1H), 9.17(d, 1H), 8.12(d, 2H), 8.01(d, 1H), 7.88-7.82(m, 3H), 7.56(d, 2H), 7.53-7.46(m, 3H), 7.31(d, 1H), 7.20(t, 1H), 6.50(s, 1H), 5.59(s, 2H), 4.93(m, 1H), 3.59(dd, 1H), 3.35(q, 1H)

<783>

<784>

실시예 96: 2,3-다이하이드로벤조[1,4]다이옥신-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<785>

<786>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-(브로모메틸)-1,4-벤조다이옥산 0.92 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

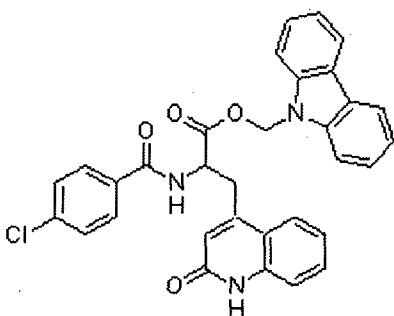
<787>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(d, 1H), 9.09(dd, 1H), 7.81(t, 3H), 7.55-7.50(m, 3H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.78(m, 1H), 7.62(m, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 2H), 7.32(q, 1H), 7.18(q, 1H), 6.88-6.81(m, 4H), 6.46(d, 1H), 4.81(m, 1H), 4.46-4.29(m, 4H), 4.06-3.98(m, 1H), 3.51-3.47(m, 1H), 3.36-3.30(m, 1H)

<788>

<789>

실시예 97: 카바졸-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<790>

<791>

일반적인 실험방법 B에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 9H-카바졸-9-메탄올 0.64 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

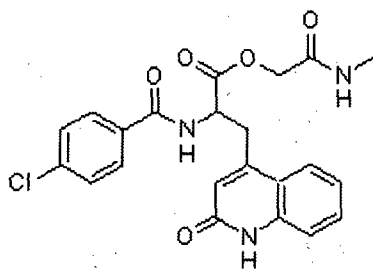
<792>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 8.85(d, 1H), 8.13(d, 2H), 7.71(d, 2H), 7.65(d, 1H), 7.53-7.46(m, 4H), 7.36(t, 2H), 7.29(d, 1H), 7.18-7.12(m, 3H), 6.33(s, 1H), 4.64(m, 2H), 3.09(dd, 1H), 2.95(dd, 1H)

<793>

<794>

실시예 98: 메틸카바모일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<795>

<796>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로-N-메틸아세트아마이드 0.43 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

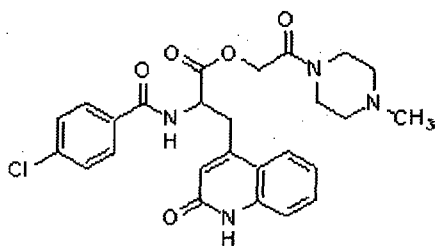
<797>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.95(m, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.96-4.90(m, 1H), 4.59(s, 2H), 3.58(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 2.64(d, 3H)

<798>

<799>

실시예 99: 2-(4-메틸피페라진-1-일)-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<800>

<801>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 2.0 g(5.38 mmol) 및 1-(2-브로모아세틸)-4-메틸피페라진-1-이움 브로마이드 1.40 g(1.2 eq, 6.48 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.1 g)을 얻었다.

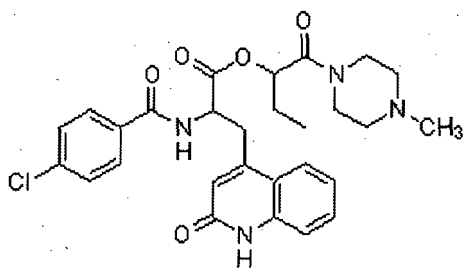
<802>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 9.10(d, 1H), 7.81(t, 3H), 7.53(m, 4H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.48(s, 1H), 4.93-4.90(m, 2H), 4.23(t, 1H), 3.45-3.42(m, 4H), 2.71-2.50(m, 2H), 2.29-2.25(m, 4H), 2.12(s, 3H)

<803>

<804>

실시예 100: 1-(4-메틸피페라진-1-카르보닐)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<805>

<806>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 2.0 g(5.38 mmol) 및 1-(2-브로모부타노일)-4-메틸피페라진-1-이움 브로마이드 1.60 g(1.2 eq, 6.48 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.1 g)을 얻었다.

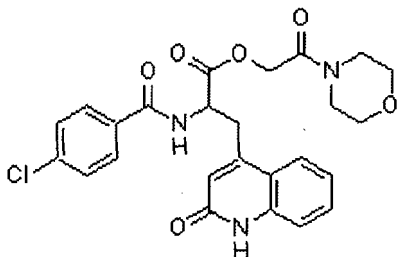
<807>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 9.09(d, 1H), 7.81(t, 3H), 7.53(m, 4H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 7.25-7.23(m, 1H), 6.48(d, 1H), 5.06-4.78(m, 1H), 4.52-4.50(m, 1H), 3.33-3.30(m, 4H), 2.60-2.51(m, 6H), 2.16-2.10(m, 5H), 1.10(t, 3H)

<808>

<809>

실시예 101: 2-모폴린-4-일-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<810>

<811>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-클로로아세틸)모폴린 0.66 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

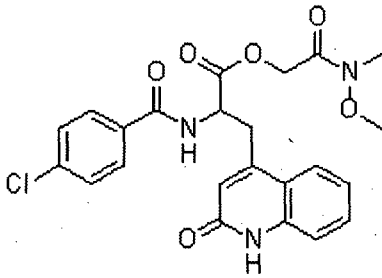
<812>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.53(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.26(t, 1H), 6.52(s, 1H), 4.93(dd, 2H), 4.87(m, 1H), 3.65(dd, 1H), 3.58(br-s, 4H), 3.44(m, 4H), 3.29(m, 1H)

<813>

<814>

실시예 102: (메톡시메틸카바모일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<815>

<816>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 2-클로로-N-메톡시-N-메틸아세트아마이드 0.55 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

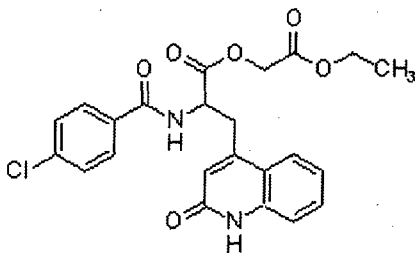
<817>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.86-7.81(m, 3H), 7.59-7.51(m, 3H), 7.33(dd, 1H), 7.26(m, 1H), 6.52(s, 1H), 5.09-4.89(m, 3H), 3.74(s, 3H), 3.63(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 3.14(s, 3H)

<818>

<819>

실시예 103: 2-에톡시카르보닐메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<820>

<821>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 에틸 클로로아세테이트 0.49 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

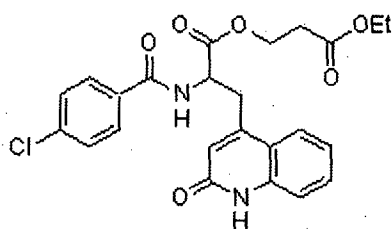
<822>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.85(t, 1H), 7.83-7.80(m, 2H), 7.77(d, 1H), 7.57(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.54-7.50(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.27-7.23(m, 1H), 6.51(s, 1H), 4.95-4.89(m, 1H), 4.81(q, 2H), 4.16(q, 2H), 3.55(dd, 1H), 3.30(q, 1H), 1.21(t, 3H)

<823>

<824>

실시예 104: 2-에톡시카르보닐메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<825>

<826>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 에틸 3-클로로프로피오네이트 0.55 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.8 g)을 얻었다.

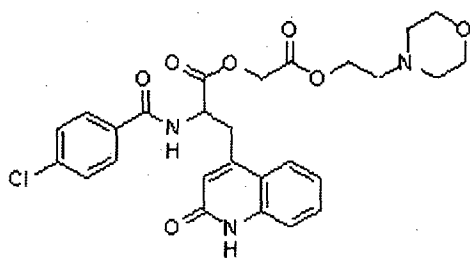
<827>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.82(t, 1H), 7.81(t, 1H), 7.77(d, 1H), 7.57(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.52-7.50(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.23-7.21(m, 1H), 6.45(s, 1H), 4.77-4.73(m, 1H), 4.34-4.30(m, 2H), 4.01(q, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.26(q, 1H), 2.69-2.66(m, 2H), 1.13(t, 3H)

<828>

<829>

실시에 105: 2-모폴린-4-일-에톡시카르보닐메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<830>

<831>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 4-[2-(2-브로모아세톡시)에틸]모폴린-4-이움 브로마이드 1.07 g(1.2 eq, 3.23 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.1 g)을 얻었다.

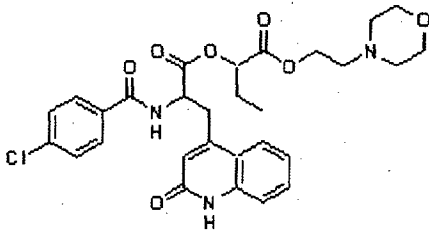
<832>

^1H NMR (DMSO- d_6): 9.09(d, 1H), 7.81(t, 3H), 7.53(m, 3H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.48(s, 1H), 4.87-4.80(m, 2H), 4.23(t, 1H), 3.57-3.52(m, 4H), 3.31-3.25(m, 2H), 3.14(t, 4H), 2.62(t, 4H)

<833>

<834>

실시에 106: 2-모폴린-4-일에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐옥시]부티레이트의 제조



<835>

<836>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 2.0 g(5.38 mmol) 및 에틸 클로로아세테이트 1.8 g(1.2 eq, 6.47 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

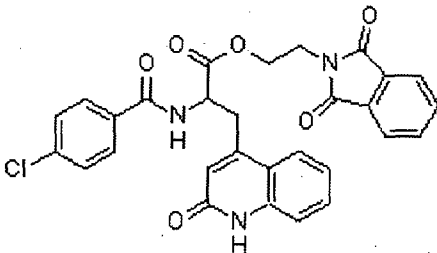
<837>

^1H NMR (DMSO- d_6): 9.09(d, 1H), 7.81(t, 3H), 7.53(m, 3H), 7.31(d, 1H), 7.25-7.23(m, 1H), 6.48(d, 1H), 5.06-4.78(m, 1H), 4.30-4.11(m, 1H), 3.61-3.24(m, 8H), 3.35-3.25(m, 4H), 2.54-2.35(m, 2H), 1.90-1.75(m, 2H), 0.95(t, 3H)

<838>

<839>

실시예 107: 2-(1,3-다이옥소-1,3-다이하이드로아이소인돌-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<840>

<841>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 N-(클로로메틸)프탈이미드 0.79 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

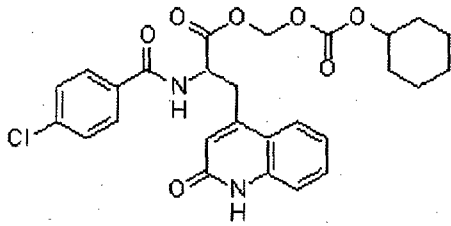
<842>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 8.94(d, 1H), 7.82(s, 4H), 7.76-7.70(m, 3H), 7.52-7.48(m, 3H), 7.29(dd, 1H), 7.21(m, 1H), 6.41(s, 1H), 4.71(m, 1H), 4.48-4.42(m, 1H), 4.36-4.31(m, 1H), 3.92(t, 2H), 3.43(dd, 1H), 3.15(dd, 1H)

<843>

<844>

실시예 108: 사이클로헥실옥시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<845>

<846>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 에틸 클로로메틸 사이클로헥실 카보네이트 0.77 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

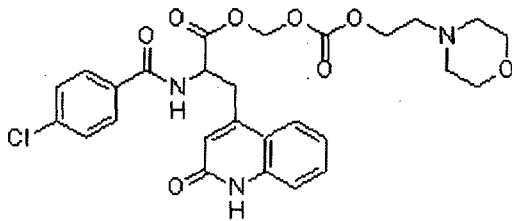
<847>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.81(m, 3H), 7.52(m, 3H), 7.33(d, 1H), 7.21(m, 1H), 6.45(s, 1H), 5.77(s, 2H), 4.81(m, 1H), 4.53(m, 1H), 3.28-3.49(m, 2H), 1.80(m, 2H), 1.63(m, 2H), 1.14-1.51(m, 6H)

<848>

<849>

실시예 109: 2-모르폴린-4-일-에톡시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<850>

<851>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 2.0 g(5.38 mmol) 및 클로로메틸 (2-모폴린-4-일)에틸 카보네이트 염산 1.68 g(1.2 eq, 6.47 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.1 g)을 얻었다.

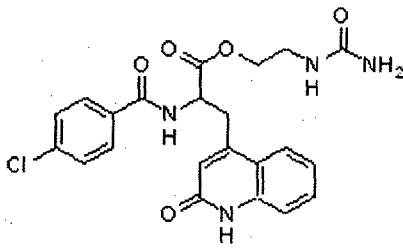
<852>

^1H NMR (DMSO- d_6): 9.09(d, 1H), 7.81(t, 3H), 7.53(m, 4H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 7.26-6.95(m, 3H), 6.48(s, 1H), 4.23(t, 1H), 3.57-3.52(m, 4H), 3.31-3.25(m, 2H), 3.14(t, 4H), 2.62(t, 4H)

<853>

<854>

실시예 110: 2-유레이도에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<855>

<856>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 (2-브로모에틸)우레아 0.67 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.2 g)을 얻었다.

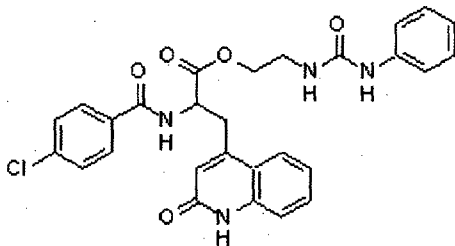
<857>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.01(d, 1H), 8.64(t, 1H), 7.87-7.82(m, 3H), 7.57(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.52(m, 1H), 7.31(d, 1H), 7.26(m, 1H), 6.46(s, 1H), 6.12(t, 1H), 5.57(s, 2H), 4.81(m, 1H), 4.13(m, 1H), 4.06(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.28-3.22(m, 3H)

<858>

<859>

실시예 111: 2-(3-페닐-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<860>

<861>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-브로모에틸)-3-페닐 우레아 0.98 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.3 g)을 얻었다.

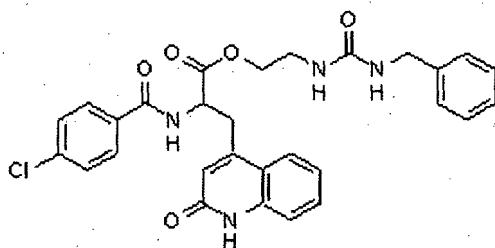
<862>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.02(d, 1H), 8.60(s, 1H), 7.83(t, 3H), 7.54(s, 1H), 7.52(s, 1H), 7.49(t, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38(s, 1H), 7.30(d, 1H), 7.21-7.15(m, 3H), 6.88(t, 1H), 6.45(s, 1H), 6.30(t, 1H), 4.83(m, 1H), 4.25(m, 1H), 4.13(m, 1H), 3.56(dd, 1H), 3.41(t, 2H), 3.27(m, 1H)

<863>

<864>

실시예 112: 2-(3-벤질-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<865>

<866>

일반적인 실험방법 C에 따라, 레바미피드 1.0 g(2.69 mmol) 및 1-(2-브로모에틸)-3-벤질 우레아 1.04 g(1.5 eq, 4.03 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.3 g)을 얻었다.

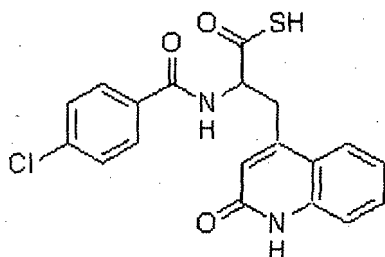
<867>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 9.03(d, 1H), 7.87-7.82(m, 3H), 7.55(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.33-7.17(m, 6H), 6.52(t, 1H), 6.46(s, 1H), 6.15(t, 1H), 4.82(m, 1H), 4.23-4.17(m, 3H), 4.07(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.33(m, 2H), 3.24(dd, 1H)

<868>

<869>

실시예 113: 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산의 제조



<870>

<871>

일반적인 실험방법 A 또는 B에 따라, 옅은 노란색의 표제 화합물(200 g)을 합성하였다.

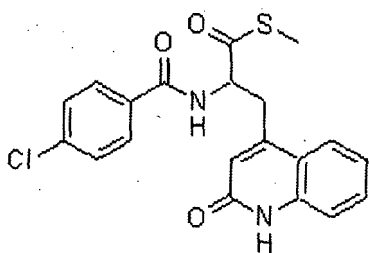
<872>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.52(s, 1H), 8.40(d, 1H), 8.22(d, 1H), 7.81(dd, 2H), 7.54(d, 1H), 7.52(d, 1H), 7.48(m, 1H), 7.28(d, 1H), 7.22(m, 1H), 6.37(s, 1H), 4.65-4.60(m, 1H), 4.11(q, 1H), 3.72(dd, 1H), 2.93(q, 1H)

<873>

<874>

실시예 114: S-메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<875>

<876>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 아이오도메탄 1.10 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

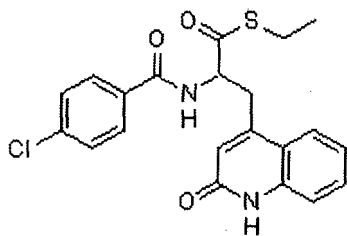
<877>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 3.54(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 2.28(s, 3H)

<878>

<879>

실시예 115: S-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<880>

<881>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 아이오도메탄 1.21 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

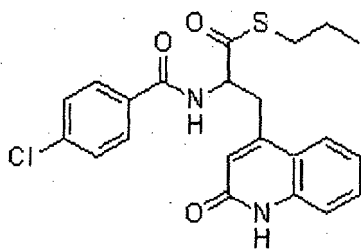
<882>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.68(s, 1H), 9.28(d, 1H), 7.88(t, 1H), 7.85(t, 1H), 7.82(t, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.34-7.31(m, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.44(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 2.86(q, 2H), 1.19(t, 3H)

<883>

<884>

실시예 116: S-프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<885>

<886>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-브로모프로판 0.95 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

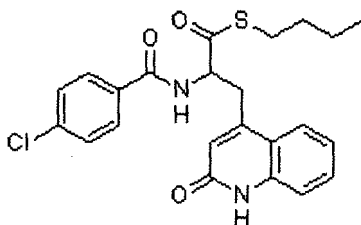
<887>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.86-7.79(m, 3H), 7.64(s, 1H), 7.62(s, 1H), 7.49(d, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.93-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.85(t, 2H), 1.51(q, 2H), 0.91(t, 3H)

<888>

<889>

실시예 117: *S*-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<890>

<891>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-브로모부탄 1.06 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

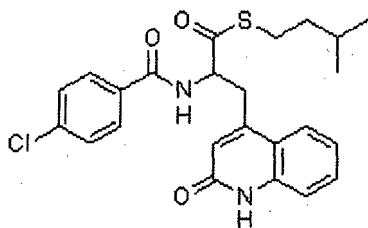
<892>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.21(d, 1H), 7.87-7.79(m, 3H), 7.58(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.52-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.25-7.20(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.96-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.87(t, 2H), 1.53-1.46(m, 2H), 1.35-1.24(m, 2H), 0.87(t, 3H)

<893>

<894>

실시예 118: *S*-(3-메틸부틸)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<895>

<896>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-브로모-3-메틸부탄 1.17 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

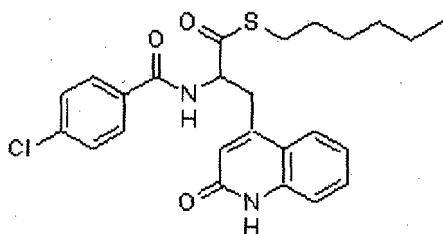
<897>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.86-7.79(m, 3H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.92(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.89-2.85(m, 2H), 1.60-1.55(m, 1H), 1.42-1.37(m, 2H), 0.87(dd, 6H)

<898>

<899>

실시예 119: *S*-헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<900>

<901>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-브로모헥산 1.28 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

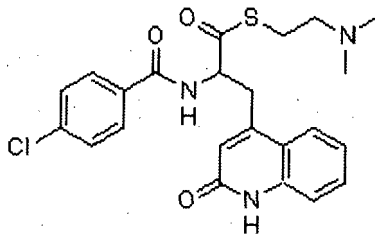
<902>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.21(d, 1H), 7.86-7.79(m, 3H), 7.58(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.25-7.16(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.86(t, 2H), 1.54-1.47(m, 2H), 1.34-1.8(m, 6H), 0.85(t, 3H)

<903>

<904>

실시예 120: *S*-(2-다이메틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<905>

<906>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(다이에틸아미노)에틸 클로라이드 염산 1.12 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

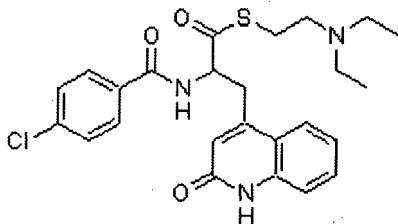
<907>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.87-7.84(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.58(d, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.92(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.99(t, 2H), 2.40(t, 2H), 2.16(s, 6H)

<908>

<909>

실시예 121: S-(2-다이에틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<910>

<911>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(다이에틸아미노)에틸 클로라이드 염산 1.33 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

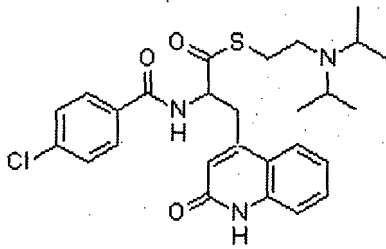
<912>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.87(t, 1H), 7.84(t, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(d, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.93-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.22(q, 1H), 2.97(t, 2H), 2.62-2.58(m, 6H), 0.98(t, 6H)

<913>

<914>

실시예 122: S-(2-다이아이소프로필아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<915>

<916>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(다이아이소프로필아미노)에틸 클로라이드 염산 1.55 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

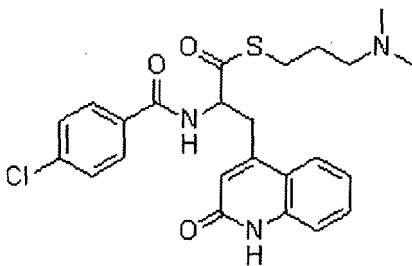
<917>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.64(s, 1H), 7.62(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.96-4.91(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 3.00(br-s, 2H), 2.87(br-s, 2H), 2.51(br-s, 2H), 0.99(d, 12H)

<918>

<919>

실시에 123: S-(2-다이메틸아미노)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<920>

<921>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 3-다이메틸아미노-1-프로필 클로라이드 염산 1.22 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

<922>

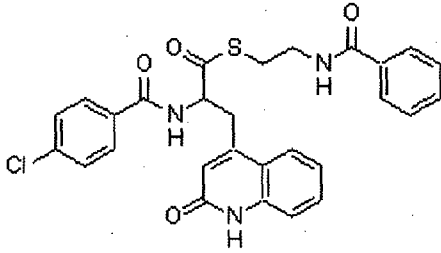
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.86(t, 1H), 7.84(t, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.23-7.20(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.88(t, 2H), 2.25(t, 2H), 2.09(s, 6H), 1.68(m, 2H)

<923>

<924>

실시에 124: S-(2-벤조일아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-

1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 옥살레이트의 제조



<925>

<926>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 N-(2-클로로에틸)벤즈아마이드 1.42 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

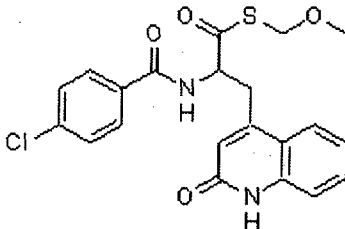
<927>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.24(d, 1H), 8.66(t, 1H), 7.85-7.83(m, 4H), 7.77(d, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.51-7.44(m, 3H), 7.30(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.91(m, 1H), 3.55-3.42(m, 3H), 3.20(q, 1H), 3.11(t, 2H)

<928>

<929>

실시예 125: S-메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<930>

<931>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 클로로메틸 메틸 에테르 0.62 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

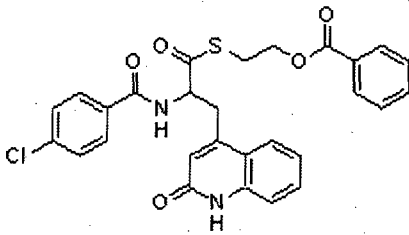
<932>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.29(d, 1H), 7.86-7.80(m, 3H), 7.60-7.58(dd, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(d, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.43(s, 1H), 5.08(s, 2H), 4.99-4.93(m, 1H), 3.54(dd, 1H), 3.24(q, 2H), 3.22(s, 3H)

<933>

<934>

실시예 126: S-(2-벤조일옥시)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<935>

<936>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-클로로에틸 벤조에이트 1.43 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

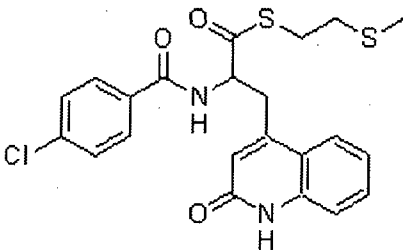
<937>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.27(d, 1H), 7.96(s, 1H), 7.94(d, 1H), 7.84(s, 1H), 7.82(s, 1H), 7.72(d, 1H), 7.66(t, 1H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.50(q, 3H), 7.30(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.42(s, 1H), 4.95(m, 1H), 4.41(t, 2H), 3.49(dd, 1H), 3.34-3.30(m, 2H), 3.19(q, 1H)

<938>

<939>

실시예 127: *S*-(2-메틸설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<940>

<941>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-클로로에틸 메틸 설파이드 0.86 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

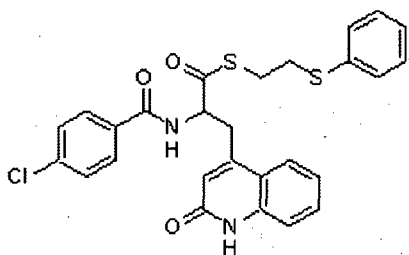
<942>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.86(t, 1H), 7.84(t, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 3.12-3.08(m, 2H), 2.65-2.49(m, 2H), 2.11(s, 3H)

<943>

<944>

실시예 128: *S*-(2-페닐설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<945>

<946>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 2-브로모에틸 페닐 설파이드 1.68 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.6 g)을 얻었다.

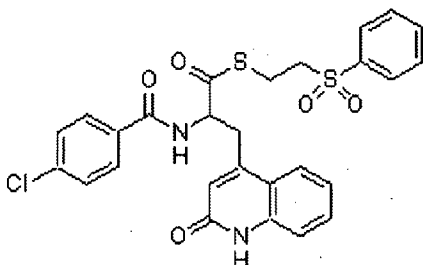
<947>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.39(dd, 2H), 7.33(q, 3H), 7.25-7.21(m, 2H), 6.43(s, 1H), 4.98-4.93(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.22(q, 1H), 3.15-3.07(m, 4H)

<948>

<949>

실시예 129: *S*-(2-벤젠설폰일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<950>

<951>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 2-클로로에틸 페닐 설폰 1.68 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.6 g)을 얻었다.

<952>

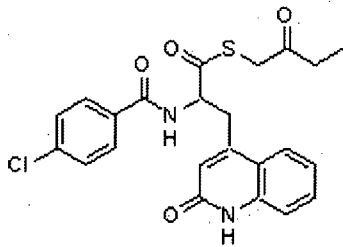
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.92(t, 2H), 7.83-7.79(m, 2H), 7.76(d, 2H), 7.70-7.64(m, 2H), 7.62-7.58(m, 2H), 7.53-7.47(m, 1H), 7.31(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.39(s, 1H), 4.92-4.86(m, 1H), 3.57-3.47(m, 3H), 3.17(q, 1H), 3.07-3.02(m, 2H)

<953>

<954>

실시예 130: *S*-(2-옥소부틸)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하

이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<955>

<956>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol)과 1-클로로-2-부탄온 0.82
g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 일반적인 실험방법 C를 이용하여 백색 고체의 표제화합물
(1.1 g)을 얻었다.

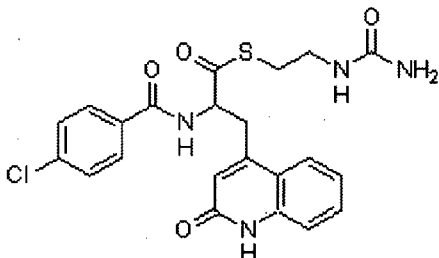
<957>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.32(d, 1H), 7.87(s, 1H),
7.85(s, 1H), 7.77(d, 1H), 7.61(s, 1H), 7.59(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H),
7.23(t, 1H), 6.44(s, 1H), 4.96-4.93(m, 1H), 3.91(d, 2H), 3.52(dd, 1H),
3.20(q, 1H), 2.58(q, 2H), 0.96(t, 3H)

<958>

<959>

실시예 131: S-(2-우레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-
다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<960>

<961>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-클로로에틸우레아
0.95 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.1 g)을 얻었다.

<962>

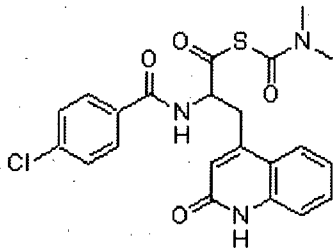
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.86(s, 1H),
7.84(s, 1H), 7.81(t, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.57(d, 1H), 7.51(t, 1H),
7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 6.14(t, 1H), 5.51(s, 2H), 4.96-4.92(m,
1H), 3.54(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 3.17-3.11(m, 2H), 2.93(t, 2H)

<963>

<964>

실시예 132: N,N-다이메틸 S-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이

하이드로퀴놀린-4-일)티오키바메이트의 제조



<965>

<966>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 다이메틸 카바밀 클로라이드 0.83 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

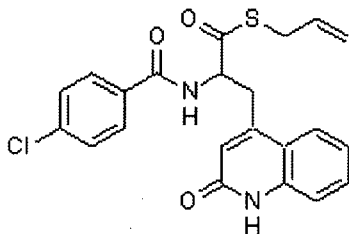
<967>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(s, 1H), 8.95(d, 1H), 7.89(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.53-7.47(m, 3H), 7.29(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.44(s, 1H), 5.28-5.22(m, 1H), 3.28(dd, 1H), 3.19(q, 1H), 2.96(s, 3H), 2.84(s, 3H)

<968>

<969>

실시예 133: S-알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<970>

<971>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 알릴브로마이드 0.94 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

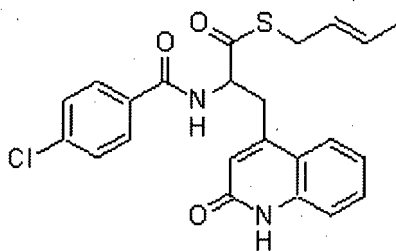
<972>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.86-7.82(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.64-7.58(m, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.32-7.30(dd, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.43(s, 1H), 5.84-5.74(m, 1H), 5.29-5.24(m, 1H), 5.12-5.09(tt, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 3.57-3.52(m, 3H), 3.21(q, 2H)

<973>

<974>

실시예 134: S-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<975>

<976>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-브로모-2-부텐 1.05
g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

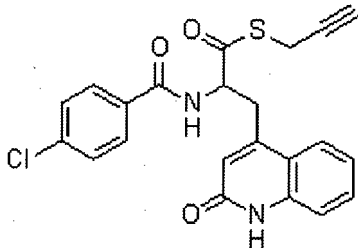
<977>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.86-7.79(m, 3H),
7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.26-7.22(m, 1H),
6.42(s, 1H), 5.71-5.66(m, 1H), 5.46-5.38(m, 1H), 4.97-4.91(m, 1H), 3.58-
3.50(m, 3H), 3.20(q, 2H), 1.65(t, 3H).

<978>

<979>

실시예 135: *S*-프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<980>

<981>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 프로파질브로마이드
0.92 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

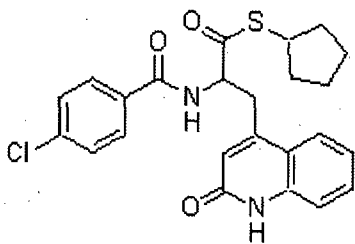
<982>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.29(d, 1H), 7.86(t, 1H),
7.83(t, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(d,
1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.42(s, 1H), 4.99-4.96(m, 1H), 3.72(d, 1H), 3.53(dd,
3H), 3.32(s, 2H), 3.21(q, 2H)

<983>

<984>

실시예 136: *S*-사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<985>

<986>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 클로로사이클로펜탄 0.81 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

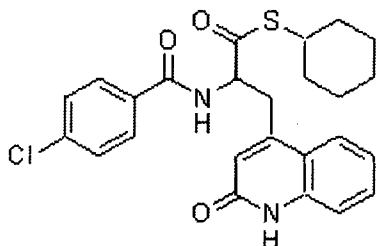
<987>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.19(d, 1H), 7.85(d, 1H), 7.83(d, 1H), 7.79(d, 1H), 7.59(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(d, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.42(s, 1H), 4.94-4.88(m, 1H), 3.65-3.62(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.19(q, 2H), 2.09-2.02(m, 2H), 1.64-1.55(m, 4H), 1.49(m, 2H)

<988>

<989>

실시예 137: *S*-사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<990>

<991>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 브로모사이클로헥산 1.26 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.3 g)을 얻었다.

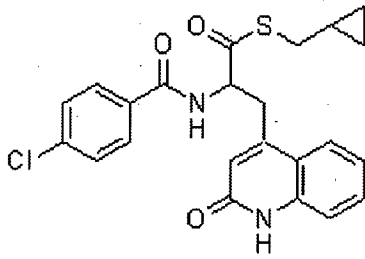
<992>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.20(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.42(s, 1H), 4.93-4.88(m, 1H), 3.51(m, 1H), 3.42(m, 1H), 3.18(q, 2H), 1.86-1.82(m, 2H), 1.64-1.52(m, 3H), 1.45-1.32(m, 4H), 1.19(m, 1H)

<993>

<994>

실시예 138: *S*-사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<995>

<996>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 (클로로메틸)사이클로프로판 0.70 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.1 g)을 얻었다.

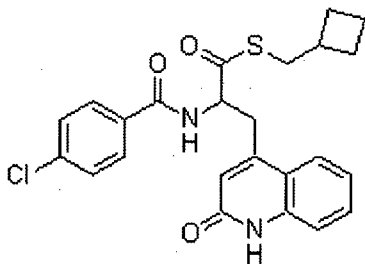
<997>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.88-7.84(m, 2H), 7.80(d, 1H), 7.61-7.58(m, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95(m, 1H), 3.54(dd, 1H), 3.20(q, 2H), 0.98-0.94(m, 1H), 0.53-0.48(m, 2H), 0.25-0.24(m, 2H)

<998>

<999>

실시예 139: S-사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1000>

<1001>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 (브로모메틸)사이클로부탄 1.12 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.4 g)을 얻었다.

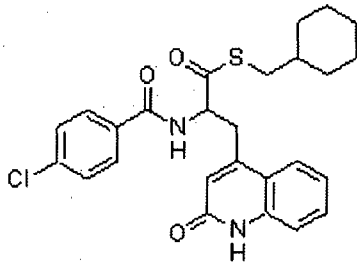
<1002>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.86-7.82(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.60-7.55(m, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.35-7.30(m, 1H), 7.26-7.20(m, 1H), 6.51(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.51(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.89(d, 2H), 2.46-2.38(m, 1H), 2.03-1.96(m, 2H), 1.83-1.71(m, 2H), 1.68-1.66(m, 2H)

<1003>

<1004>

실시예 140: *S*-사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1005>

<1006>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 (브로모메틸)사이클로헥산 1.37 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.3 g)을 얻었다.

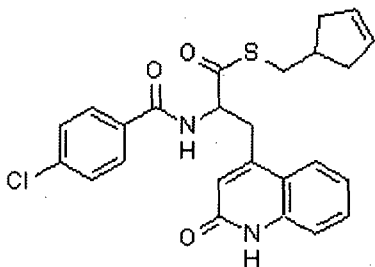
<1007>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.86-7.82(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.62-7.58(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.91(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.20(q, 1H), 2.78(d, 2H), 1.67(t, 4H), 1.41(d, 1H), 1.40-1.34(m, 3H), 1.22-1.16(m, 2H)

<1008>

<1009>

실시예 141: *S*-(사이클로펜트-3-엔일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1010>

<1011>

일반적인 실험방법 D에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 (사이클로펜트-3-엔일)메틸 톨루엔설포네이트 1.96 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

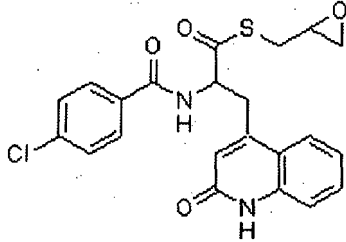
<1012>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.38(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.86-7.84(m, 2H), 7.79(d, 1H), 7.64-7.62(m, 2H), 7.50(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.50(s, 1H), 5.63(s, 2H), 4.95-4.93(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.21(q, 1H), 2.93(d, 2H), 2.46-2.43(m, 3H), 2.00(dd, 2H)

<1013>

<1014>

실시예 142: *S*-옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1015>

<1016>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(클로로메틸)옥시란 0.72 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

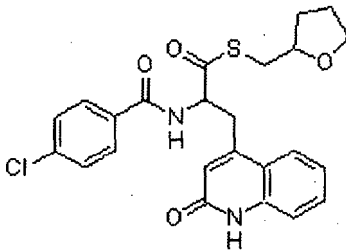
<1017>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83-7.72(m, 3H), 7.57-7.41(m, 3H), 7.31(dd, 1H), 7.24-7.20(m, 1H), 6.46(s, 1H), 5.24-5.20(m, 1H), 4.96(m, 1H), 4.81-4.76(m, 1H), 3.87-3.84(m, 2H), 3.45(dd, 1H), 2.86(q, 2H)

<1018>

<1019>

실시예 143: *S*-(테트라하이드로퓨란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1020>

<1021>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 테트라하이드로퓨어퓨릴 클로라이드 0.94 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.3 g)을 얻었다.

<1022>

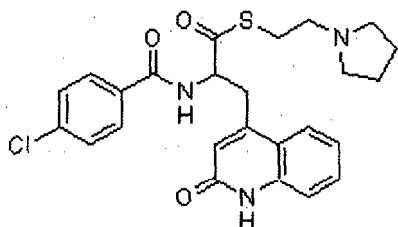
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.64(s, 1H), 7.61(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 3.89(s, 1H), 3.77(t, 1H), 3.61(t, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.18(q, 2H), 3.09-2.98(m, 2H), 1.97-1.89(m, 1H), 1.87-

1.78(m, 2H), 1.54-1.48(m, 1H).

<1023>

<1024>

실시예 144: *S*-(2-피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1025>

<1026>

일반적인 실험방법 D에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-피롤리딘 에틸 메탄설포네이트 1.50 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

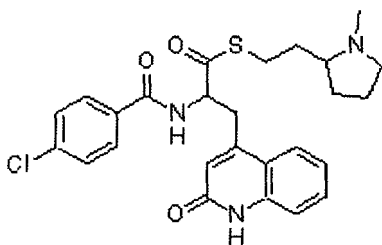
<1027>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.87(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.81(t, 1H), 7.61(s, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58-7.47(m, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.96-4.91(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 3.01(t, 2H), 2.62-2.50(m, 6H), 1.68(s, 4H)

<1028>

<1029>

실시예 145: *S*-[2-(1-메틸피롤리딘-2-일)]에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1030>

<1031>

일반적인 실험방법 D에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-메틸-2-피롤리딘 에틸 메탄설포네이트 1.61 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

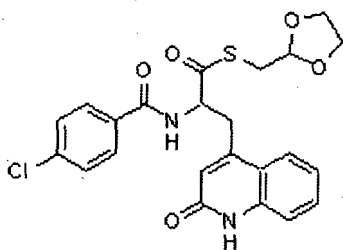
<1032>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.22(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(d, 1H), 7.81(t, 1H), 7.59(d, 1H), 7.58(d, 1H), 7.52-7.48(m, 1H), 7.35-7.30(m, 1H), 7.25-7.18(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.93(m, 1H), 3.52(dd, 1H),

3.20(q, 2H), 2.94-2.80(m, 2H), 2.19(s, 3H), 2.09-2.05(m, 2H), 1.90-1.85(m, 1H), 1.77-1.75(m, 1H), 1.64-1.58(m, 2H), 1.50-1.45(m, 2H)

<1033>

<1034> 실시예 146: *S*-([1,3]-다이옥솔란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1035>

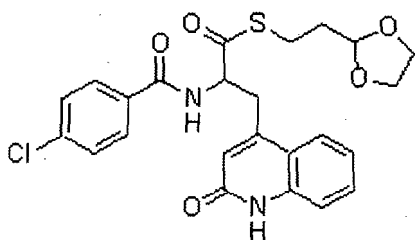
<1036> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-브로모메틸-1,3-다이옥솔란 1.30 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<1037>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.27(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.68(d, 1H), 7.61(s, 1H), 7.59(s, 1H), 7.53-7.48(m, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.95(m, 1H), 4.33(s, 1H), 3.92-3.89(m, 2H), 3.82-3.78(m, 2H), 3.53(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 3.13(d, 2H)

<1038>

<1039> 실시예 147: *S*-(2-[1,3]-다이옥솔란-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1040>

<1041> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(2-브로모에틸)-1,3-다이옥솔란 1.40 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<1042>

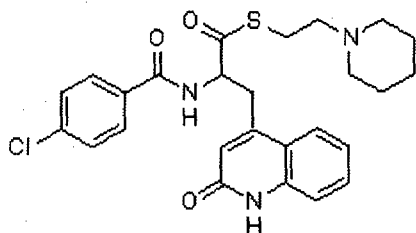
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.86-7.80(m, 3H),

7.61-7.55(m, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.93-4.91(m, 1H), 4.84(t, 1H), 3.91-3.85(m, 2H), 3.79-3.74(m, 2H), 3.53(dd, 1H), 3.20(q, 2H), 2.91(t, 2H), 1.86-1.82(m, 2H)

<1043>

<1044>

실시예 148: *S*-(2-피페리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1045>

<1046>

일반적인 실험방법 D에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-(2-클로로에틸)피페리딘 염산 1.43 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

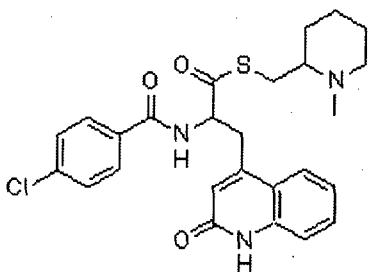
<1047>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.27(d, 1H), 7.87-7.79(m, 3H), 7.58-7.48(m, 3H), 7.31(d, 1H), 7.21(t, 1H), 6.45(s, 1H), 4.93(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 3.05(t, 2H), 2.74-2.67(m, 2H), 2.54(br-s, 4H), 1.52-1.44(m, 4H), 1.39-1.34(m, 2H)

<1048>

<1049>

실시예 149: *S*-(1-메틸피페리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1050>

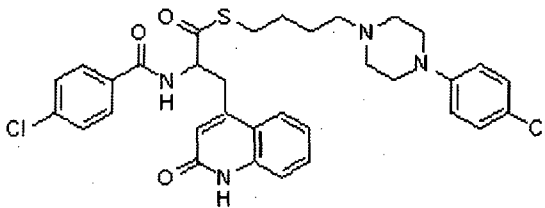
<1051>

일반적인 실험방법 D에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-메틸-2-피페리딘메틸 메탄설포네이트 1.61 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

<1052> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.87(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.81(t, 1H), 7.62(s, 1H), 7.61(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.92(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.32(br-s, 2H), 3.21(q, 2H), 3.13-3.06(m, 1H), 2.74-2.71(m, 1H), 2.15-2.02(m, 4H), 2.02-1.97(m, 1H), 1.65-1.47(m, 4H), 1.24-1.16(m, 2H)

<1053>

<1054> 실시예 150: *S*-4-[4-(4-클로로페닐)피페라진-1-일]-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



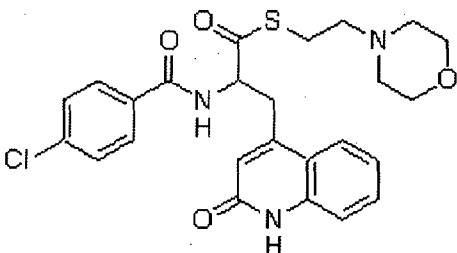
<1055>

<1056> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 [4-(4-클로로페닐)피페라진-1-일]부틸 브로마이드 2.57 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

<1057> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.86(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.80(d, 1H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.25-7.18(m, 2H), 6.92(s, 1H), 6.86(d, 1H), 6.77(d, 1H), 6.43(s, 1H), 4.96-4.90(m, 1H), 3.53(dd, 3H), 3.21(q, 1H), 3.14(br-s, 4H), 2.91(t, 2H), 2.33(br-s, 2H), 1.73(br-s, 2H)

<1058>

<1059> 실시예 151: *S*-(2-모폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<1060>

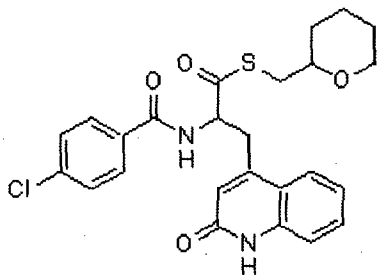
<1061> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-(2-클로로에틸)모폴린

염산 1.44 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

<1062> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.87(t, 1H), 7.84(t, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(t, 1H), 7.58(t, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(dd, 1H), 7.26-7.22(m, 1H), 6.43(s, 1H), 4.96-4.90(m, 1H), 3.56-3.51(m, 3H), 3.32(s, 2H), 3.21(q, 1H), 2.12(t, 2H), 2.53(t, 2H), 2.39(br-s, 4H)

<1063>

<1064> 실시예 152: *S*-(테트라하이드로피란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



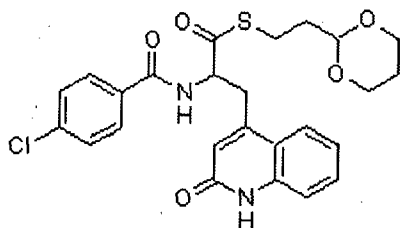
<1065>

<1066> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(클로로메틸)테트라하이드로-2H-피란 1.04 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

<1067> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.25(dd, 1H), 7.87(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.61(t, 1H), 7.59(t, 1H), 7.54-7.49(m, 1H), 7.29(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.97-4.92(m, 1H), 3.84-2.81(m, 1H), 3.53(dd, 1H), 3.33-3.28(m, 2H), 3.21(q, 2H), 3.06-3.00(m, 1H), 2.94-2.86(m, 1H), 1.74(br-d, 1H), 1.60(d, 1H), 1.45-1.40(m, 3H), 1.23-1.16(m, 1H)

<1068>

<1069> 실시예 153: *S*-(2-[1,3]다이옥산-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



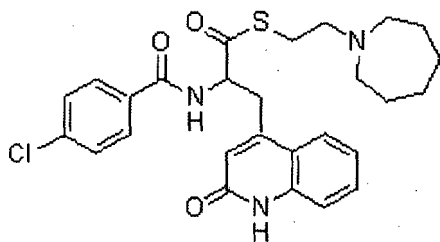
<1070>

<1071> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol)과 2-(2-브로모에틸)-1,3-다이옥산 1.51 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<1072> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.85(d, 1H), 7.83(d, 1H), 7.79(d, 1H), 7.59(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.42(s, 1H), 4.93-4.92(m, 1H), 4.56(t, 1H), 4.04-3.97(m, 2H), 3.72-3.66(m, 2H), 3.52(dd, 1H), 2.91-2.87(m, 2H), 1.87-1.72(m, 4H)

<1073>

<1074> 실시예 154: S-(2-아제판-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



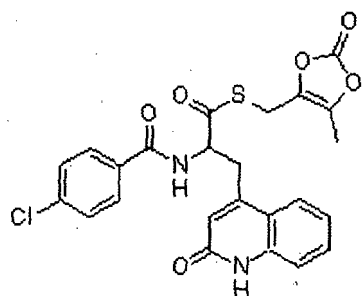
<1075>

<1076> 일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2-(헥사메틸렌이미노)에틸 클로라이드 염산 1.54 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

<1077> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.87(s, 1H), 7.84(s, 1H), 7.79(d, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.31(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.52(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 2.98(t, 2H), 2.67-2.62(m, 6H), 1.56-1.51(d, 8H)

<1078>

<1079> 실시예 155: S-(5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1080>

<1081>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-클로로메틸-5-메틸-1,3-다이옥솔-2-온 1.15 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

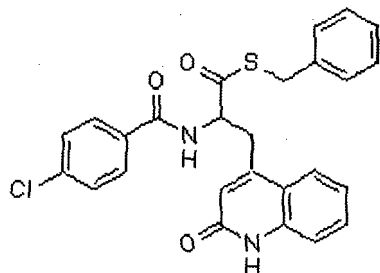
<1082>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.29(d, 1H), 7.85(s, 1H), 7.83(s, 1H), 7.78(d, 1H), 7.60(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.41(s, 1H), 5.03-4.98(m, 1H), 4.06(s, 2H), 3.55(dd, 1H), 3.22(q, 1H), 2.15(s, 3H)

<1083>

<1084>

실시예 156: S-벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1085>

<1086>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 벤질 브로마이드 1.33 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.3 g)을 얻었다.

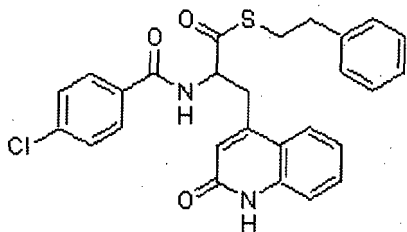
<1087>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.84-7.80(m, 3H), 7.59-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.35-7.29(m, 5H), 7.28-7.22(m, 2H), 6.42(s, 1H), 5.02-4.96(m, 1H), 4.15(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 2H)

<1088>

<1089>

실시예 157: S-펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1090>

<1091>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 펜에틸 브로마이드 1.43 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.2 g)을 얻었다.

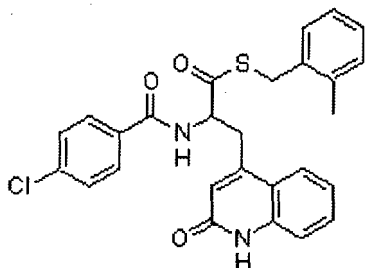
<1092>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.85-7.79(m, 3H), 7.62-7.49(m, 4H), 7.33-7.16(m, 6H), 6.43(s, 1H), 4.96-4.87(m, 1H), 4.34(s, 1H), 3.50(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 3.13(t, 1H), 2.90-2.73(m, 2H)

<1093>

<1094>

실시예 158: *S*-(2-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1095>

<1096>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 2-메틸벤질 브로마이드 1.44 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.2 g)을 얻었다.

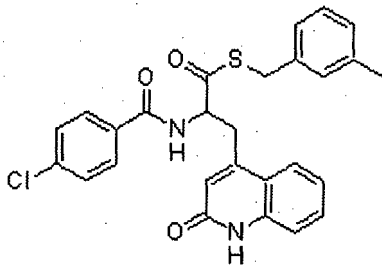
<1097>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.83-7.79(m, 3H), 7.58-7.54(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(t, 2H), 7.26-7.19(m, 1H), 7.17-7.12(m, 3H), 6.42(s, 1H), 5.02-4.96(m, 1H), 4.16(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.21(q, 2H), 2.27(s, 3H)

<1098>

<1099>

실시예 159: *S*-(3-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1100>

<1101>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 3-메틸벤질 브로마이드 1.44 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

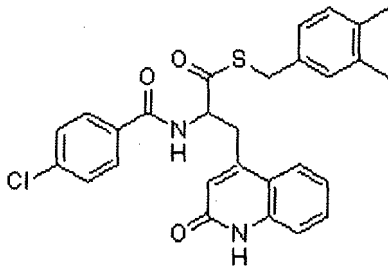
<1102>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.83-7.80(m, 3H), 7.58-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.25-7.18(m, 2H), 7.12-7.05(m, 3H), 6.43(s, 1H), 5.02-4.96(m, 1H), 4.11(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 2H), 2.27(s, 3H)

<1103>

<1104>

실시예 160: *S*-(3,4-다이메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1105>

<1106>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 3,4-다이메틸벤질 클로라이드 1.20 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

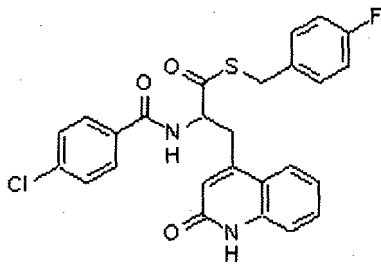
<1107>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.23(d, 1H), 7.87-7.79(m, 3H), 7.58-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t, 1H), 7.13(d, 1H), 7.08-7.02(m, 2H), 6.42(s, 1H), 5.00-4.96(m, 1H), 4.17(d, 1H), 4.08(d, 1H), 3.56(d, 1H), 3.20(t, 1H), 2.22-2.09(m, 6H)

<1108>

<1109>

실시예 161: *S*-(4-플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1110>

<1111>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-플루오로벤질 브로마이드 1.47 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.1 g)을 얻었다.

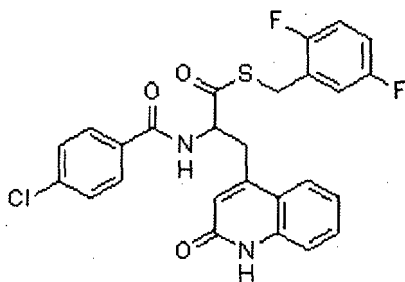
<1112>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.84-7.72(m, 3H), 7.74-7.72(m, 2H), 7.68-7.64(q, 1H), 7.59-7.48(m, 4H), 7.33-7.30(m, 1H), 7.24-7.19(m, 1H), 6.41(s, 1H), 5.03-4.97(m, 1H), 4.21(d, 2H), 3.55(dd, 1H), 3.21(q, 2H)

<1113>

<1114>

실시예 162: *S*-(2,5-다이플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1115>

<1116>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 2,5-다이플루오로벤질 브로마이드 1.61 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

<1117>

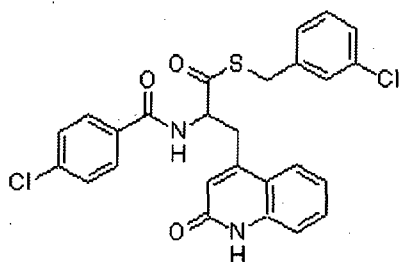
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.84-7.79(m, 3H), 7.59-7.55(m, 1H), 7.52-7.48(m, 1H), 7.35-7.15(m, 5H), 6.41(s, 1H), 5.03-4.97(m, 1H), 4.16(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1118>

<1119>

실시예 163: *S*-(3-클로로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다

이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1120>

<1121>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 3-클로로벤질 브로마이드 1.59 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.5 g)을 얻었다.

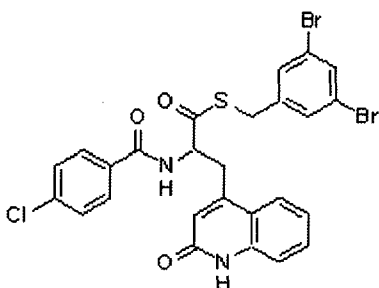
<1122>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.84-7.79(m, 3H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.40(s, 1H), 7.38-7.28(m, 4H), 7.23(t, 1H), 6.42(s, 1H), 5.00(m, 1H), 4.16(d, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1123>

<1124>

실시예 164: S-(3,5-다이브로모벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1125>

<1126>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 3,5-다이브로모벤질 브로마이드 2.55 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.5 g)을 얻었다.

<1127>

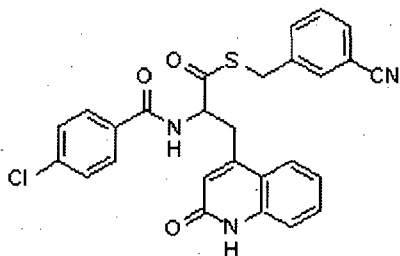
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.84-7.78(m, 4H), 7.59-7.55(m, 4H), 7.50(t, 1H), 7.31(t, 1H), 7.22(t, 1H), 6.42(s, 1H), 5.02-4.97(m, 1H), 4.14(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1128>

<1129>

실시예 165: S-(3-시아노벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다

이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1130>

<1131>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 3-시아노벤질 클로라이
드 1.28 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었
다.

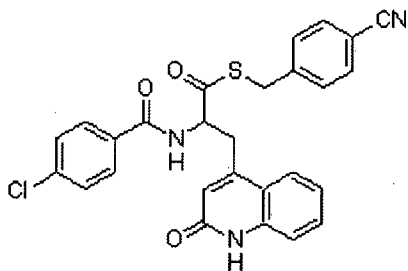
<1132>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.84-7.79(m, 3H),
7.59-7.55(m, 2H), 7.53-7.49(m, 1H), 7.38-7.30(m, 3H), 7.25(t, 1H), 7.21-
7.12(m, 2H), 6.42(s, 1H), 5.00-4.96(m, 1H), 4.15(d, 2H), 3.55(dd, 1H),
3.20(q, 2H)

<1133>

<1134>

실시예 166: S-(4-시아노벤질)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1135>

<1136>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이
하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 4-시아노벤질 클로라이
드 1.28 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.0 g)을 얻
었다.

<1137>

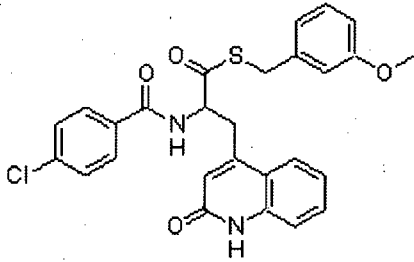
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.27(d, 1H), 7.84-7.78(m, 5H),
7.59-7.55(m, 2H), 7.53-7.49(m, 3H), 7.30(d, 1H), 7.22(t, 1H), 6.40(s, 1H),
5.02-4.96(m, 1H), 4.23(s, 2H), 3.54(dd, 1H), 3.21(q, 2H)

<1138>

<1139>

실시예 167: S-(3-메톡시벤질)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이

하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1140>

<1141>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이 하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 3-메톡시벤질 클로라이 드 1.21 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.2 g)을 얻 었다.

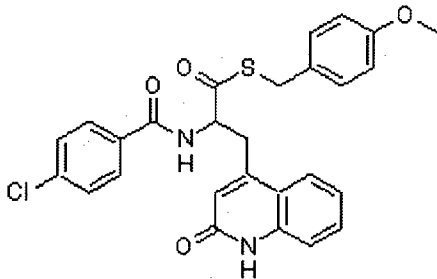
<1142>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.83-7.80(m, 3H), 7.59(s, 1H), 7.58(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.26-7.21(m, 2H), 6.88(d, 2H), 6.81(d, 1H), 6.43(s, 1H), 5.01-4.97(m, 1H), 4.13(q, 2H), 3.71(s, 3H), 3.50(dd, 1H), 3.21(q, 2H)

<1143>

<1144>

실시예 168: S-(4-메톡시벤질)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이 하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1145>

<1146>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이 하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-메톡시벤질 클로라이 드 1.21 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었 다.

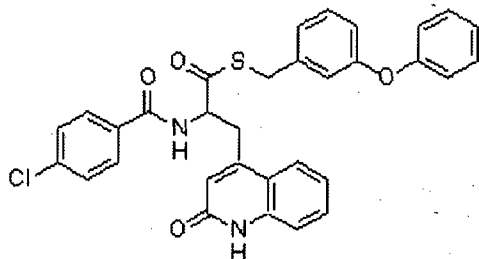
<1147>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.84-7.79(m, 3H), 7.59-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.53-7.48(m, 1H), 7.35-7.30(m, 1H), 7.25-7.18(m, 3H), 6.87-6.51(dd, 2H), 6.42(s, 1H), 5.00-4.94(m, 1H), 4.10(d, 2H), 3.73(s, 3H), 3.56(dd, 1H), 3.19(q, 2H)

<1148>

<1149>

실시예 169: *S*-(3-페녹시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1150>

<1151>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 3-페녹시벤질 클로라이드 1.70 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

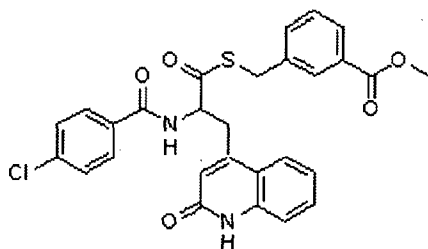
<1152>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.28(d, 1H), 7.84(t, 1H), 7.82(t, 1H), 7.78(d, 1H), 7.59(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.53-7.48(m, 1H), 7.40-7.36(m, 2H), 7.32(t, 2H), 7.25-7.21(m, 1H), 7.16-7.11(m, 1H), 7.10(t, 1H), 7.02(t, 1H), 6.99(t, 2H), 6.89-6.86(m, 1H), 6.43(s, 1H), 5.01-4.95(m, 1H), 4.14(q, 2H), 3.53(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1153>

<1154>

실시예 170: *S*-(3-메톡시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1155>

<1156>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 메틸(3-브로모메틸)벤조에이트 1.78 g(1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<1157>

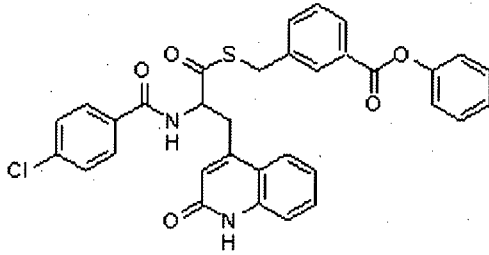
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.25(d, 1H), 7.94(t, 1H), 7.86-7.79(m, 4H), 7.64-7.56(m, 3H), 7.54-7.51(m, 2H), 7.32-7.29(m, 1H), 7.25-

7.21(m, 1H), 6.41(s, 1H), 5.02-4.96(m, 1H), 4.23(d, 2H), 3.85(s, 3H), 3.55(dd, 1H), 3.32(s, 2H), 3.20(q, 2H)

<1158>

<1159>

실시예 171: *S*-(3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트의 제조



<1160>

<1161>

일반적인 실험방법 A에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 페닐 2-하이드록시벤조에이트 1.33 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

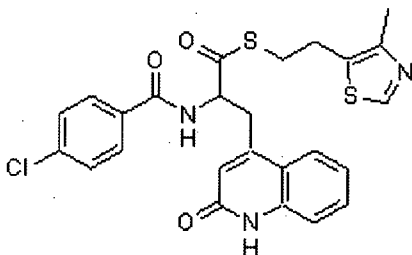
<1162>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.27(d, 1H), 8.11(s, 1H), 8.01(d, 1H), 7.94(t, 1H), 7.84-7.79(m, 3H), 7.69(d, 1H), 7.59-7.55(m, 3H), 7.52-7.46(m, 3H), 7.34-7.28(m, 4H), 7.22(t, 1H), 6.41(s, 1H), 5.02-4.99(m, 1H), 4.29(s, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.21(s, 1H)

<1163>

<1164>

실시예 172: *S*-[2-(4-메틸티아졸-5일)에틸] 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1165>

<1166>

일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-메틸-5-티아졸에탄올 0.89 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

<1167>

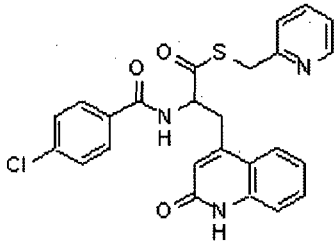
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.67(s, 1H), 9.25(d, 1H), 8.84(s, 1H), 7.83(d, 2H), 7.79(d, 1H), 7.64-7.55(m, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.24(t,

1H), 6.43(s, 1H), 4.95-4.90(m, 1H), 3.50(dd, 1H), 3.20(q, 2H), 3.11-2.99(m, 4H), 2.32(s, 3H)

<1168>

<1169>

실시예 173: *S*-(피리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1170>

<1171>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 2-(클로로메틸)피리딘 염산 1.27 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 일반적인 실험방법 C를 이용하여 백색 고체의 표제화합물 (0.8 g)을 얻었다.

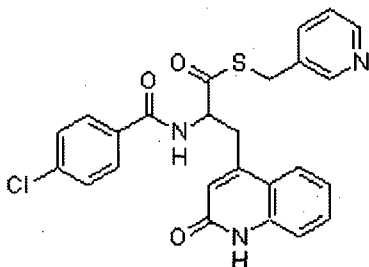
<1172>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.65(s, 1H), 9.28(d, 1H), 8.48(d, 1H), 7.82-7.79(dd, 2H), 7.78-7.74(m, 1H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.51(t, 1H), 7.40(d, 1H), 7.32-7.21(m, 3H), 6.42(s, 1H), 5.02-4.97(m, 1H), 4.26(q, 2H), 3.56(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1173>

<1174>

실시예 174: *S*-(피리딘-3-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1175>

<1176>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 3-(클로로메틸)피리딘 염산 1.27 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

<1177>

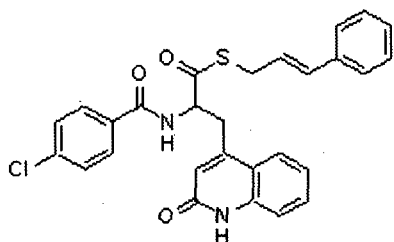
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(s, 1H), 9.25(d, 1H), 8.55(d, 1H),

8.45(dd, 1H), 7.83-7.79(m, 3H), 7.73-7.70(m, 1H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.36-7.30(m, 3H), 7.25-7.21(m, 1H), 6.42(s, 1H), 5.02-4.97(m, 1H), 4.18(q, 2H), 3.55(dd, 1H), 3.20(q, 1H)

<1178>

<1179>

실시예 175: S-(3-페닐알릴) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1180>

<1181>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 신나밀 브로마이드 1.52 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.3 g)을 얻었다.

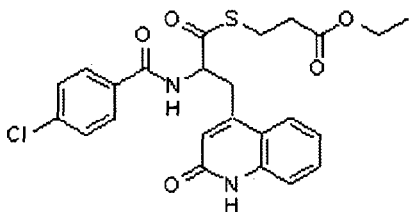
<1182>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.26(d, 1H), 7.86-7.80(m, 3H), 7.59(d, 1H), 7.55(d, 1H), 7.51(m, 1H), 7.42-7.40(m, 2H), 7.34-7.31(m, 3H), 7.26-7.21(m, 2H), 6.62(d, 1H), 6.44(s, 1H), 6.28-6.23(m, 1H), 4.99-4.98(m, 1H), 3.74(d, 2H), 3.57(dd, 1H), 3.23(q, 1H)

<1183>

<1184>

실시예 176: S-에톡시-3-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트의 제조



<1185>

<1186>

일반적인 실험방법 C에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 에틸 3-클로로프로피오네이트 1.06 g (1.5 eq, 7.76 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.7 g)을 얻었다.

<1187>

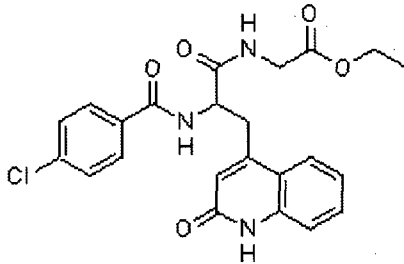
^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.66(s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.85-7.82(m, 2H),

7.79(d, 1H), 7.60-7.58(dd, 2H), 7.51(t, 1H), 7.30(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.42(s, 1H), 4.93(m, 1H), 4.06(q, 2H), 3.52(dd, 1H), 3.19(q, 1H), 3.06(t, 2H), 2.61(t, 2H), 1.17(t, 3H)

<1188>

<1189>

실시예 177: 에틸 [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세테이트의 제조



<1190>

<1191>

일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오산 2.0 g(5.17 mmol) 및 글라이신 에틸 에스테르 염산 0.87 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.4 g)을 얻었다.

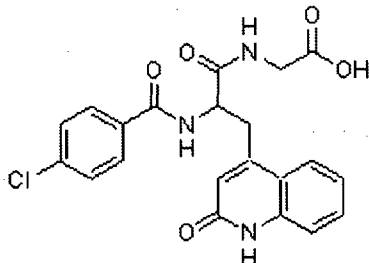
<1192>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.63(s, 1H), 8.88(d, 1H), 8.67(t, 1H), 7.91(d, 1H), 7.87(t, 1H), 7.85(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.53(t, 1H), 7.49(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.24(m, 1H), 6.50(s, 1H), 4.89(m, 1H), 4.10(q, 2H), 3.89(t, 2H), 3.44(dd, 1H), 3.16(q, 1H), 1.19(t, 3H)

<1193>

<1194>

실시예 178: [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세트산의 제조



<1195>

<1196>

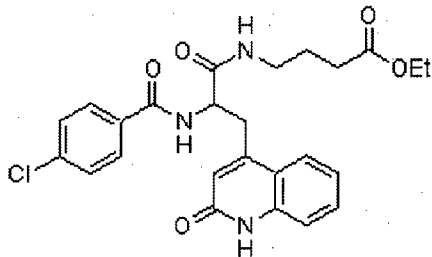
에틸 [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세테이트 1.0 g(2.19 mmol)을 다이메틸포름아마이드 10 mL에 용해시킨 후, 트리플루오로아세트산 0.5 mL를 가한 다음 실온에서 30분간 교반하였다. 반응 혼합액에 물 20mL를 가한 다음 에틸 초산 20 mL로 3번 추출하였다. 유기

층을 모아 무수 황산마그네슘으로 건조하고 여과하여 농축한 다음 에틸 초산하에서 결정화하여 옅은 노란색의 표제 화합물(0.4 g)을 얻었다.

<1197> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(s, 1H), 8.86(d, 1H), 8.49(t, 1H), 7.92(d, 1H), 7.87(s, 1H), 7.85(s, 1H), 7.55(s, 1H), 7.53(s, 1H), 7.50(t, 1H), 7.29(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.49(s, 1H), 4.89(m, 1H), 3.79(d, 2H), 3.46(dd, 1H), 3.14(q, 1H)

<1198>

<1199> 실시예 179: 에틸 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]부티레이트의 제조



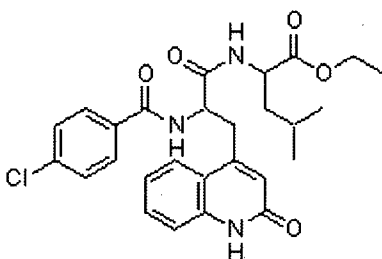
<1200>

<1201> 일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 에틸 4-아미노부티레이트 염산 1.04 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

<1202> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(s, 1H), 8.77(d, 1H), 8.23(t, 1H), 7.92(d, 1H), 7.86(t, 1H), 7.85(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.53(t, 1H), 7.48(m, 1H), 7.31(dd, 1H), 7.23(m, 1H), 6.47(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.04(q, 2H), 3.42(dd, 1H), 3.13(m, 3H), 2.29(t, 2H), 1.67(m, 2H), 1.17(t, 3H)

<1203>

<1204> 실시예 180: 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-4-메틸 펜타노에이트의 제조



<1205>

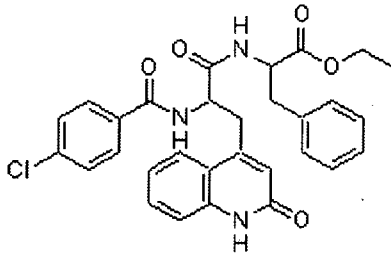
<1206> 일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이

하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 L-루신 에틸 에스테르 염산 1.18 g (1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.5 g)을 얻었다.

<1207> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.62(d, 1H), 8.77(t, 1H), 8.59(dd, 1H), 7.94(t, 1H), 7.85(t, 2H), 7.54-7.48(m, 3H), 7.29(dd, 1H), 7.22(q, 1H), 6.50(d, 1H), 4.95-4.92(m, 1H), 4.34-4.28(m, 1H), 4.12-4.05(m, 2H), 3.29(dd, 1H), 3.18(t, 1H), 1.68-1.48(m, 3H), 1.16(q, 3H), 0.92-0.87(m, 6H)

<1208>

<1209> 실시예 181: 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-3-페닐 프로피오네이트의 제조



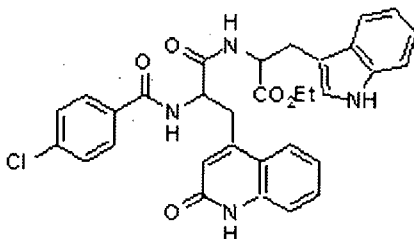
<1210>

<1211> 일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 페닐알라닌 에틸 에스테르 염산 1.38 g (1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.4 g)을 얻었다.

<1212> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(d, 1H), 8.75(dd, 1H), 7.84(d, 2H), 7.55-7.49(m, 3H), 7.31-7.14(m, 8H), 6.46(s, 1H), 4.91-4.87(m, 1H), 4.60-4.57(m, 1H), 4.06(q, 2H), 3.34(m, 1H), 3.09(q, 1H), 2.936-2.90(m, 2H), 1.13(t, 3H)

<1213>

<1214> 실시예 182: 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-3-(1H-인돌-3-일)프로피오네이트의 제조



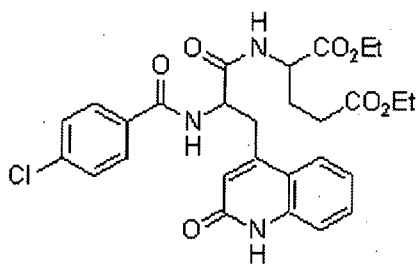
<1215>

<1216> 일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g (5.17 mmol) 및 L-트립토판 에틸 에스테르 염산 1.67 g (1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (1.1 g)을 얻었다.

<1217> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.60(d, 1H), 9.22(s, 1H), 8.77-8.67(m, 2H), 7.90-7.81(m, 3H), 7.53-7.48(m, 3H), 7.31-7.23(m, 2H), 7.02(t, 2H), 6.62(t, 2H), 6.45(s, 1H), 4.89-4.87(m, 1H), 4.51-4.48(m, 1H), 4.12-4.02(m, 2H), 3.16(dd, 1H), 2.99-2.89(m, 2H), 2.81(q, 1H), 1.16(t, 3H)

<1218>

<1219> 실시예 183: 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]펜탄-1,5-다이오에이트의 제조



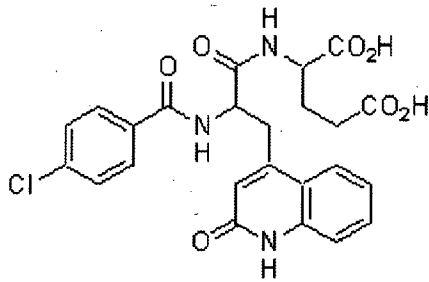
<1220>

<1221> 일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 L-글루탐산 다이에틸에스테르 염산 1.49 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.2 g)을 얻었다.

<1222> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.61(d, 1H), 8.79(t, 1H), 8.64(dd, 1H), 7.93(t, 1H), 7.84(m, 2H), 7.50(m, 3H), 7.31(dd, 1H), 7.23(m, 1H), 6.51(s, 1H), 4.92(m, 1H), 4.31(m, 1H), 4.08(m, 4H), 3.38(m, 1H), 3.18(m, 1H), 2.43(t, 1H), 2.35(t, 1H), 2.03(m, 1H), 1.88(m, 1H), 1.18(m, 6H)

<1223>

<1224> 실시예 184: 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]펜탄-1,5-다이오산의 제조



<1225>

<1226>

다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]펜탄-1,5-다이오에이트 1.0 g (1.80 mmol)을 상기 실시예 164와 같은 방법으로 합성하여 옅은 노란색의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

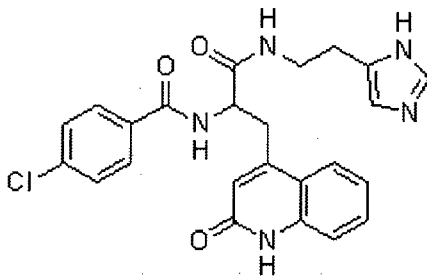
<1227>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.62(s, 1H), 8.84(t, 1H), 8.44(dd, 1H), 7.92(q, 1H), 7.84(m, 2H), 7.52(m, 3H), 7.32(m, 1H), 7.25(m, 1H), 6.51(d, 1H), 4.92(m, 1H), 4.27(m, 1H), 4.08(m, 4H), 3.40(m, 1H), 3.18(m, 1H), 2.29(m, 2H), 2.00(m, 1H), 1.86(m, 1H)

<1228>

<1229>

실시예 185: 4-클로로-N-[1-[2-(3H-이미다졸-4-일)에틸카바모일]-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드의 제조



<1230>

<1231>

일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오산 2.0 g (5.17 mmol) 및 히스타민 0.69 g (1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물 (0.9 g)을 얻었다.

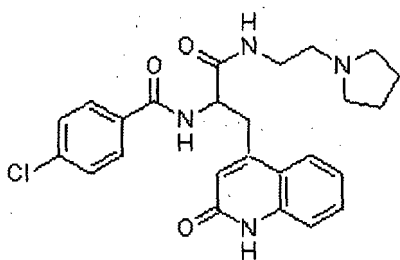
<1232>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.64(d, 1H), 8.83(d, 1H), 8.729(t, 1H), 7.93(d, 1H), 7.86(d, 2H), 7.71(s, 2H), 7.55-7.48(m, 3H), 7.30(d, 1H), 7.23(d, 1H), 7.20(s, 1H), 6.94(s, 1H), 6.62(t, 2H), 6.48(s, 1H), 4.81-4.75(m, 1H), 3.40(dd, 1H), 3.18(q, 1H), 3.11-3.00(m, 2H), 1.87-1.80(m, 2H)

<1233>

<1234>

실시예 186: 4-클로로-N-[2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)-1-(2-피롤리딘-1-일-에틸카바모일)에틸]벤즈아마이드의 제조



<1235>

<1236>

일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 1-(2-아미노에틸)피롤리딘 0.71 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

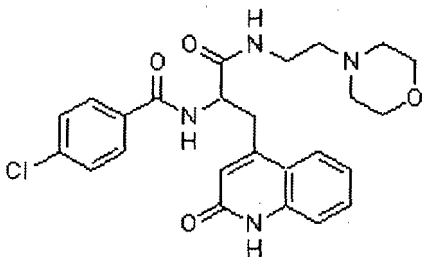
<1237>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.63(s, 1H), 8.80(d, 1H), 8.15(t, 1H), 7.91(d, 1H), 7.87(t, 1H), 7.85(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.54(t, 1H), 7.48(t, 1H), 7.29(dd, 1H), 7.24(m, 1H), 6.46(s, 1H), 4.79(m, 1H), 3.41(m, 1H), 3.21(m, 3H), 2.42(m, 6H), 1.64(m, 4H)

<1238>

<1239>

실시예 187: 4-클로로-N-[1-(2-모폴린-4-일-에틸카바모일)-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드의 제조



<1240>

<1241>

일반적인 실험방법 B에 따라, 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피온산 2.0 g(5.17 mmol) 및 4-(2-아미노에틸)모폴린 0.81 g(1.2 eq, 6.20 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.5 g)을 얻었다.

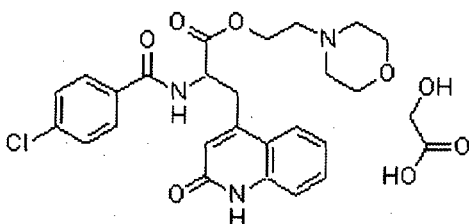
<1242>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.63(s, 1H), 8.81(d, 1H), 8.09(t, 1H), 7.91(d, 1H), 7.87(t, 1H), 7.86(t, 1H), 7.56(t, 1H), 7.54(t, 1H), 7.48(t, 1H), 7.29(dd, 1H), 7.23(m, 1H), 6.47(s, 1H), 4.78(m, 1H), 3.52(t, 4H), 3.39(m, 1H), 3.19(m, 3H), 2.31(m, 6H)

<1243>

<1244>

실시예 188: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 글리콜레이트의 제조



<1245>

<1246>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 글리콜 산 0.16 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

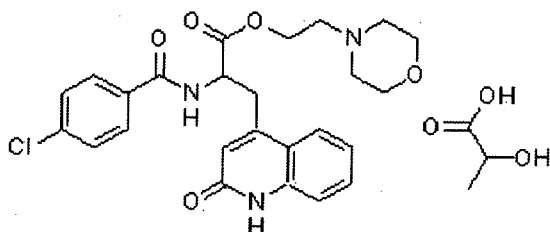
<1247>

¹H NMR (400MHz, DMSO-d₆): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.76(m, 1H), 4.26-4.15(m, 2H), 3.50-3.45(m, 5H), 3.35(s, 2H), 3.29(q, 1H), 2.57-2.47(m, 4H), 2.35(br-s, 4H)

<1248>

<1249>

실시예 189: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 락테이트의 제조



<1250>

<1251>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 락트산 0.19 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

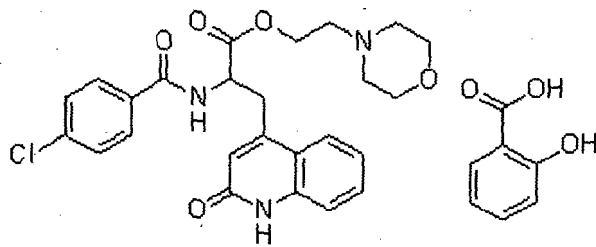
<1252>

¹H NMR (400MHz, DMSO-d₆): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.27-4.14(m, 2H), 3.50-3.45(m, 2H), 3.35-3.26(m, 5H), 2.58-2.46(m, 5H), 2.35(br-s, 4H)

<1253>

<1254>

실시예 190: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 살리실레이트의 제조



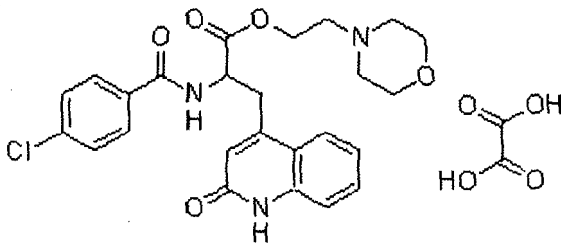
<1255>

<1256> 일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 살리산 0.29 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

<1257> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.76(dd, 1H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.42(m, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.85(q, 1H), 6.46(s, 1H), 4.78(m, 1H), 4.32-4.21(m, 2H), 3.54-3.47(m, 5H), 3.29(q, 2H), 2.78-2.67(m, 2H), 2.54(br-s, 4H)

<1258>

<1259> 실시예 191: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 옥살레이트의 제조



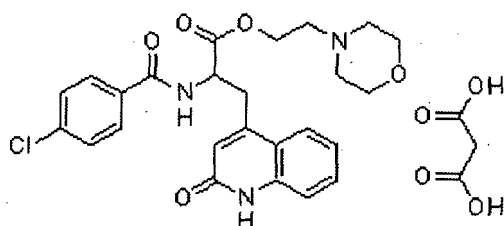
<1260>

<1261> 일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 옥살산 0.19 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

<1262> ^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.79(m, 1H), 4.34-4.25(m, 2H), 3.56(t, 4H), 3.49(dd, 1H), 3.29(q, 1H), 2.87-2.78(m, 2H), 2.65(br-s, 4H)

<1263>

<1264> 실시예 192: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 말로네이트의 제조



<1265>

<1266>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 말론산 0.22 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.1 g)을 얻었다.

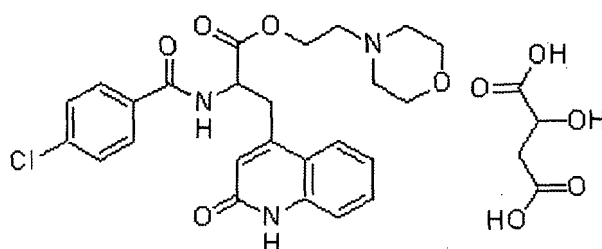
<1267>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.24(m, 2H), 3.51-3.46(m, 5H), 3.29(q, 1H), 3.19(s, 2H), 2.70-2.61(m, 2H), 2.51(t, 2H), 2.47(br-s, 4H)

<1268>

<1269>

실시에 193: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 말레이트의 제조



<1270>

<1271>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 말산 0.28 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

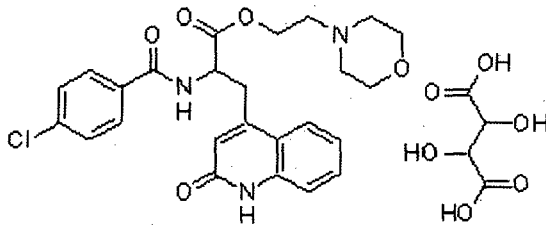
<1272>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.70(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.85-7.82(m, 3H), 7.59-7.57(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.32(q, 1H), 7.23(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.78-4.75(m, 1H), 4.26-4.16(m, 3H), 3.49-3.47(m, 5H), 3.29(q, 2H), 2.63-2.51(m, 2H), 2.45-2.38(m, 5H)

<1273>

<1274>

실시에 194: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 타르타레이트의 제조



<1275>

<1276>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 타르타르산 0.31 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

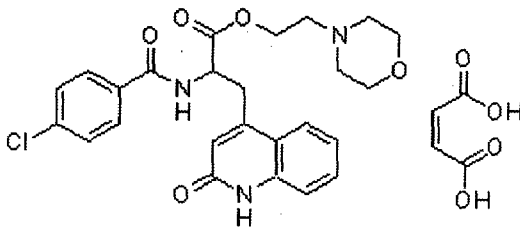
<1277>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.58(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.75(m, 1H), 4.29-4.15(m, 4H), 3.51-3.46(m, 5H), 3.29(q, 1H), 2.60-2.48(m, 2H), 2.37(br-s, 4H)

<1278>

<1279>

실시에 195: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 말이에이트의 제조



<1280>

<1281>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 말레산 0.24 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.8 g)을 얻었다.

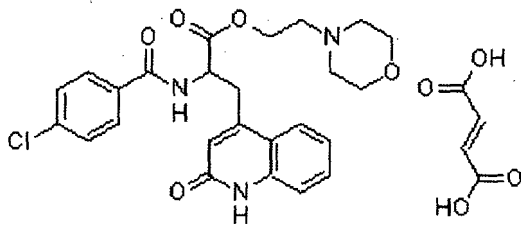
<1282>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.59(s, 1H), 7.57(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 6.11(s, 2H), 4.82(m, 1H), 4.37(m, 2H), 3.65(br-s, 4H), 3.49(dd, 1H), 3.31(q, 1H), 3.14(br-s, 2H), 2.95(br-s, 4H), 2.51(t, 2H)

<1283>

<1284>

실시에 196: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 푸마레이트의 제조



<1285>

<1286>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 푸말산 0.16 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

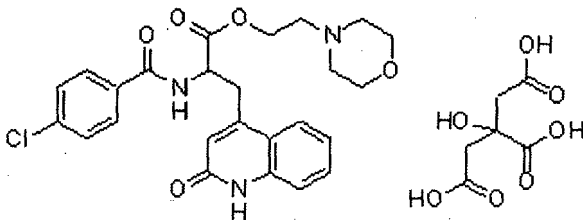
<1287>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.83(m, 3H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.46(s, 1H), 6.12(s, 2H), 4.82(m, 1H), 4.37(m, 2H), 3.65(br-s, 4H), 3.48(dd, 1H), 3.32(q, 1H), 3.15(br-s, 2H), 2.96(br-s, 4H), 2.52(t, 2H)

<1288>

<1289>

실시예 197: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 시트레이트의 제조



<1290>

<1291>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 시트르산 0.40 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.7 g)을 얻었다.

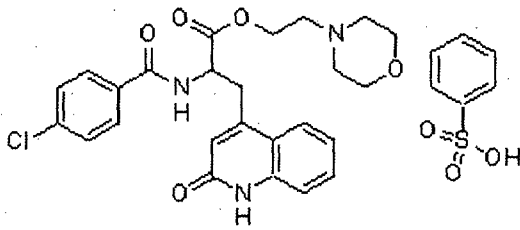
<1292>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.06(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.24(t, 1H), 6.47(s, 1H), 4.77(m, 1H), 4.28-4.18(m, 2H), 3.50-3.46(m, 5H), 3.29(q, 1H), 2.65(dd, 2H), 2.64-2.57(m, 2H), 2.51(t, 2H), 2.43(br-s, 4H)

<1293>

<1294>

실시예 198: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 벤젠설포네이트의 제조



<1295>

<1296>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 벤젠설포산 0.33 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(1.0 g)을 얻었다.

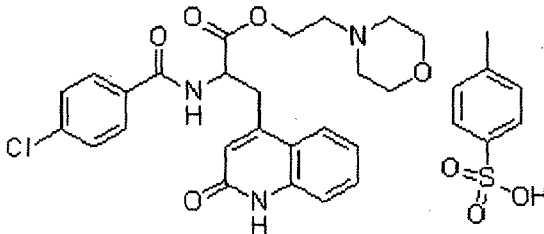
<1297>

^1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.80(br-s, 1H), 9.11(d, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.62-7.61(m, 2H), 7.60-7.57(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.35-7.30(m, 4H), 7.23(t, 1H), 6.45(s, 1H), 6.11(s, 2H), 4.89-4.85(m, 1H), 4.52-4.42(m, 2H), 3.89(t, 2H), 3.62(t, 2H), 3.54-3.52(m, 3H), 3.44(t, 2H), 3.33(q, 1H), 3.15(br-s, 2H)

<1298>

<1299>

실시예 199: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 토실레이트의 제조



<1300>

<1301>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 톨루엔설포산 모노하이드레이트 0.39 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.9 g)을 얻었다.

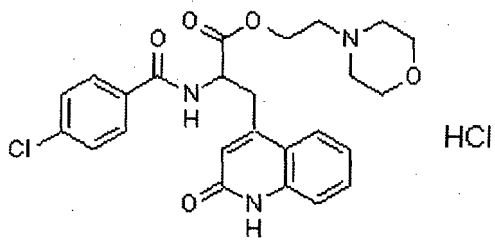
<1302>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.78(br-s, 1H), 9.10(d, 1H), 7.84-7.81(m, 3H), 7.59-7.47(m, 5H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 7.11(d, 2H), 6.45(s, 1H), 6.11(s, 2H), 4.86(m, 1H), 4.52-4.40(m, 2H), 4.02(m, 2H), 3.62(t, 2H), 3.55-3.29(m, 6H), 3.14(m, 2H), 2.29(s, 3H)

<1303>

<1304>

실시예 200: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 하이드로클로라이드의 제조



<1305>

<1306>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 염산 0.19 mL(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

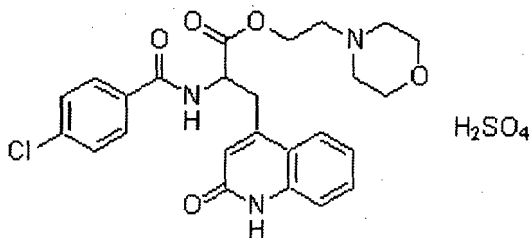
<1307>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.69(s, 1H), 11.52(br-s, 1H), 9.24(d, 1H), 7.89-7.86(m, 3H), 7.57(t, 1H), 7.55(t, 1H), 7.51(m, 1H), 7.32(dd, 1H), 7.22(m, 1H), 6.46(s, 1H), 4.93(m, 1H), 4.60-4.47(m, 2H), 3.87-3.82(m, 4H), 3.57(dd, 1H), 3.60-3.33(m, 5H), 3.12(m, 2H)

<1308>

<1309>

실시예 201: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 설페이트의 제조



<1310>

<1311>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 황산 0.20 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.4 g)을 얻었다.

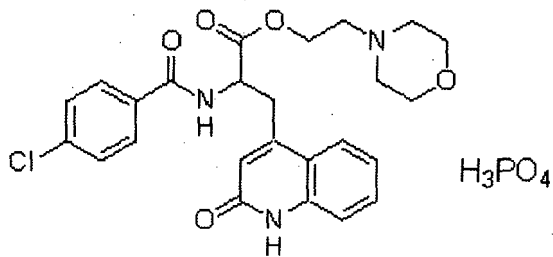
<1312>

^1H NMR (400MHz, DMSO- d_6): 11.71(s, 1H), 9.09(d, 1H), 7.83(t, 3H), 7.59(s, 1H), 7.56(s, 1H), 7.52(t, 1H), 7.32(d, 1H), 7.23(t, 1H), 6.46(s, 1H), 4.82(m, 1H), 4.35(t, 2H), 3.63(s, 4H), 3.50(dd, 1H), 3.1(q, 1H), 3.05(br-s, 2H), 2.86(br-s, 4H), 2.55(s, 1H), 2.51(s, 1H)

<1313>

<1314>

실시예 202: 2-(모르폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 포스포레이트의 제조



<1315>

<1316>

일반적인 실험방법 E에 따라, 2-모폴린-4-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 1 g(2.07 mmol) 및 인산 0.17 g(2.07 mmol)을 반응시켜 백색 고체의 표제화합물(0.6 g)을 얻었다.

<1317>

1H NMR (700MHz, DMSO- d_6): 11.72(br-s, 1H), 9.08(d, 1H), 7.86-7.82(m, 3H), 7.58-7.57(m, 2H), 7.52(t, 1H), 7.33(dd, 1H), 7.24(m, 1H), 6.47(s, 1H), 4.77-4.75(m, 1H), 4.27-4.17(m, 2H), 3.50-3.47(m, 5H), 3.30(dd, 1H), 2.60-2.57(m, 2H), 2.56-2.50(m, 1H), 2.39(br-s, 4H)

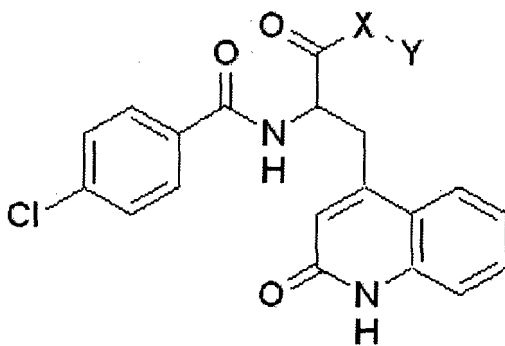
<1318>

<1319>

하기 화학식 I의 구조를 기준으로, 상기 실시예 1 내지 202에서 제조된 레바미피드 전구체의 치환기 X 및 Y를 하기 표 1에 정리하였다.

<1320>

[화학식 I]

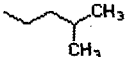
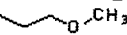
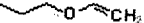
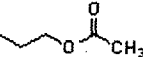
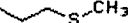
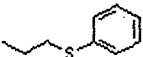
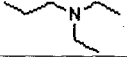
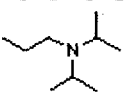
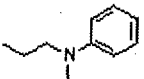
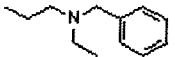
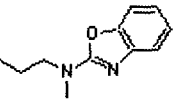
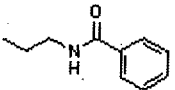
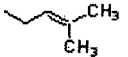
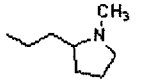
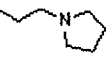
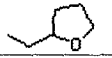
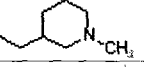
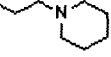
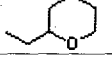
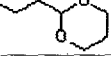
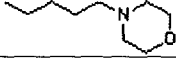
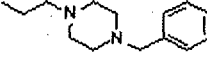
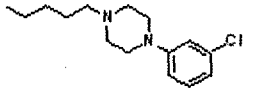
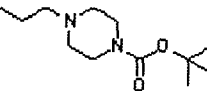


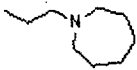
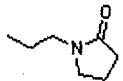
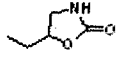
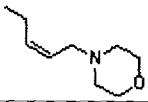
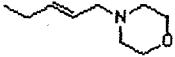
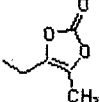
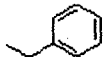
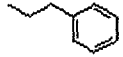
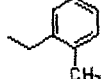
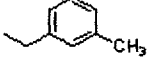
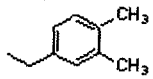
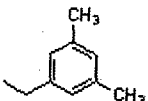
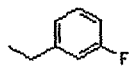
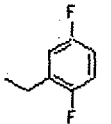
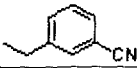
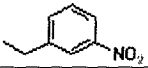
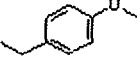
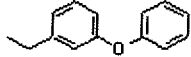
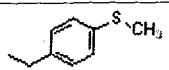
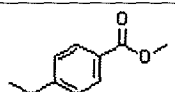
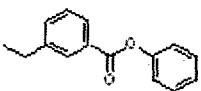
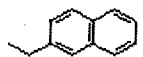
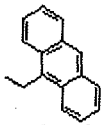
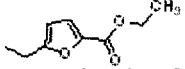
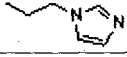
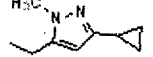
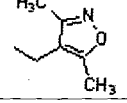
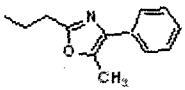
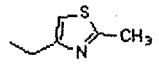
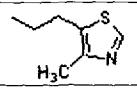
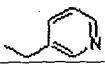
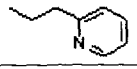
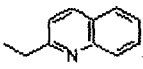
<1321>

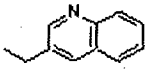
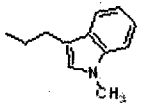
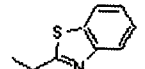
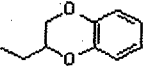
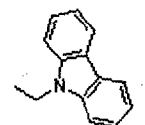
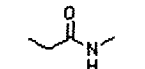
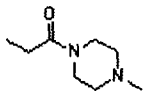
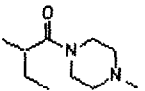
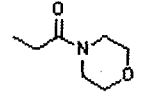
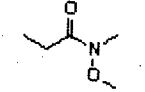
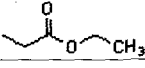
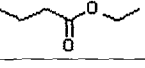
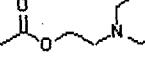
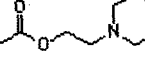
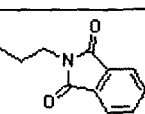
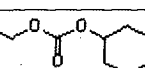
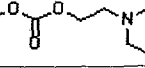
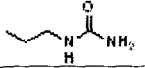
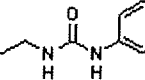
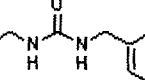
<1322>

<1323>

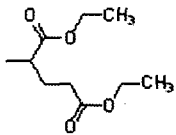
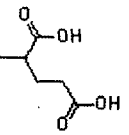
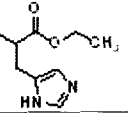
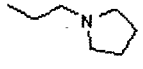
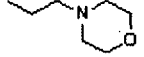
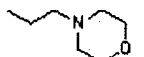
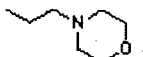
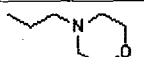
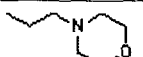
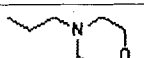
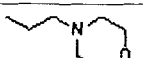
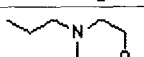
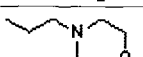
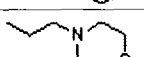
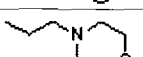
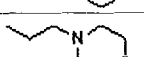
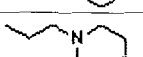
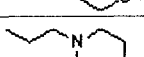
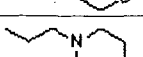
【표 1】

실시예	X	Y	실시예	X	Y
1	0		2	0	
3	0		4	0	
5	0		6	0	
7	0		8	0	
9	0		10	0	
11	0		12	0	
13	0		14	0	
15	0		16	0	
17	0		18	0	
19	0		20	0	
21	0		22	0	
23	0		24	0	
25	0		26	0	
27	0		28	0	
29	0		30	0	
31	0		32	0	
33	0		34	0	
35	0		36	0	
37	0		38	0	
39	0		40	0	
41	0		42	0	
43	0		44	0	
45	0		46	0	
47	0		48	0	
49	0		50	0	
51	0		52	0	
53	0		54	0	

55	0		56	0	
57	0		58	0	
59	0		60	0	
61	0		62	0	
63	0		64	0	
65	0		66	0	
67	0		68	0	
69	0		70	0	
71	0		72	0	
73	0		74	0	
75	0		76	0	
77	0		78	0	
79	0		80	0	
81	0		82	0	
83	0		84	0	
85	0		86	0	
87	0		88	0	
89	0		90	0	
91	0		92	0	

93	0		94	0	
95	0		96	0	
97	0		98	0	
99	0		100	0	
101	0		102	0	
103	0		104	0	
105	0		106	0	
107	0		108	0	
109	0		110	0	
111	0		112	0	
113	S	H	114	S	-CH ₃
115	S	CH ₃	116	S	CH ₃
117	S	CH ₃	118	S	CH ₃
119	S	CH ₃	120	S	CH ₃
121	S	CH ₃	122	S	CH ₃
123	S	CH ₃	124	S	CH ₃
125	S	CH ₃	126	S	CH ₃
127	S	CH ₃	128	S	CH ₃
129	S	CH ₃	130	S	CH ₃
131	S	CH ₃	132	S	CH ₃
133	S	CH ₃	134	S	CH ₃
135	S	CH	136	S	CH

137	S		138	S	
139	S		140	S	
141	S		142	S	
143			144	S	
145	S		146	S	
147	S		148	S	
149	S		150	S	
151	S		152	S	
153	S		154	S	
155	S		156	S	
157	S		158	S	
159	S		160	S	
161	S		162	S	
163	S		164	S	
165	S		166	S	
167	S		168	S	
169	S		170	S	
171	S		172	S	
173	S		174	S	
175	S		176	S	
177	NH		178	NH	
179	NH		180	NH	
181	NH		182	NH	

183	NH		184	NH	
185	NH		186	NH	
187	NH		188	0	
189	0		190	0	
191	0		192	0	
193	0		194	0	
195	0		196	0	
197	0		198	0	
199	0		200	0	
201	0		202	0	

<1324>

<1325>

실험예 1 : 레바미피드 전구체의 흡수율 실험

<1326>

<1327>

1. 검량선용 표준액의 제조

<1328>

<1329>

1) MeOH 레바미피드 용액의 제조

<1330>

레바미피드 약 5mg을 칭량하여 메탄올(MeOH) 250mL에 용해시켜 스톡용액 (20000ng/mL)을 얻는다. 제조된 스톡용액을 이용하여 각각 1000ng/mL, 500ng/mL, 200ng/mL, 100ng/mL를 제조하였다.

<1331>

<1332>

2) 표준액의 제조

<1333>

각 MeOH-레바미피드 용액 100 μ L와 공혈장 100 μ L, 메탄올(MeOH) 300 μ L를 1.5mL의 튜브에 넣고 5분간 교반하고, 5분간 10,000rpm에서 원심분리한 후 상등액 200L를 취해 표준액으로 하였다.

<1334>

<1335>

(Blank는 MeOH 레바미피드 용액 대신 MeOH을 사용, 바이알은 250 μ L insert 사용)

<1336>

<1337> 2. 검액의 제조

<1338> 각 혈장검체 100 μ L와 MeOH 400 μ L를 1.5mL 튜브에 넣고 5분간 교반, 5분간 10,000rpm 원심분리 후 상등액 200 μ L를 취해 검액으로 하였다.

<1339>

<1340> 3. 검체 정보

<1341> 검체로 사용되는 실험동물은 SD(Sprague Dawley) 랫트를 사용하였다.

<1342> 검체에 투여되는 투여액의 농도는 레바미피드의 경우 100mg/kg이며, 본 발명의 각 실시예에 의해 제조된 전구약물의 경우 레바미피드의 100mg/kg 해당량이었다.

<1343> 검체에서 투여 후 2시간이 경과한 후에 혈액을 채취하였는데, 혈청을 분리하여 영하 24℃에서 보관하였다.

<1344> 분리된 혈청에 대해서는 시간 경과에 따른 레바미피드 농도의 변이추세를 살펴보았다.

<1345>

<1346> 4. 검액 결과

<1347> 【표 2】

실시예	원액농도
레바미피드	128.69ng/mL
1, 2, 4, 6, 8, 24, 26, 30, 33, 34, 39, 61, 62, 67, 71, 74, 89, 117, 134, 137, 177, 178	100~500ng/mL
11, 13, 21, 31, 36, 40, 50, 78, 83, 86, 90, 94, 95, 110, 115, 130, 153, 157, 161, 168, 175	500~1,000 ng/mL
15, 19, 38, 48, 51, 55, 58, 82, 95, 103, 108, 120, 125, 154	1,000~2,000 ng/mL
14, 16, 44, 47, 99, 100, 102, 105, 106, 109, 121, 144, 151, 155	> 2,000 ng/mL

<1348>

<1349> 표 2의 실험결과를 살펴보면 레비미피드를 투여한 경우와 본 발명에 의한 레비미피드 전구체의 각 실시예를 투여한 경우의 혈액내 레바미피드 농도의 변이추세를 살펴보아도 레바미피드를 투여한 경우에는 2시간이 경과한 후의 혈청에 존재하는 레바미피드 농도가 본 발명의 각 실시예에 의해 제조된 레비미피드 전구체들의 2시간 경과한 후의 혈청에 존재하는 레바미피드 농도보다 현저히 낮아 본 발명의 각 실시예에 의해 제조된 레바미피드 전구체의 동물 체내로의 흡수율이 높음을 확

인할 수 있었다.

<1350> 본 발명의 각 실시예에 의해 제조된 레바미피드 전구체의 경우 실험동물의 체내에 대한 흡수율이 좋을 뿐만 아니라 전구약물인 레바미피드 전구체로부터 모약물인 레바미피드로 완전히 전환됨을 확인할 수 있었다.

<1351>

<1352>

실험예 2 : 랫트 전혈 가수분해 시험

<1353>

<1354>

1. 실험 방법

<1355>

냉동 보관한 랫트 혈액을 37℃ 항온수조에서 약 1시간 동안 해동시켜 균질화하였다.

<1356>

상기 각 실시예에서 얻은 각 화합물 10mg을 ACN 1mL에 녹여 스톡 용액(stock solution)을 제조하였다. 이때 필요에 따라 완충용액(Na_2HPO_4 0.58 g 및 KH_2PO_4 2 g)을 H_2O 1L에 녹인 후 750 mL를 ACN 250 mL와 혼합하여 제조함)을 첨가하였다. 상기 제조된 스톡용액 40 μL 을 혈액 2mL가 담긴 4mL 튜브에 첨가한 후 교반으로 균일화하고, 항온수조에 30 rpm으로 보관하였다.

<1357>

0, 2, 4, 6, 8, 10, 15, 30, 45, 60, 90 및 120분 마다 200 μL 의 샘플을 채취하여 ACN 400 μL 에 희석 후 1분간 교반하고, 1분간 원심분리한 다음, 상층액을 취해 HPLC로 분석하였다(단, 실시예 47의 화합물은 0, 1, 3, 5, 7, 10분마다 추출하여 분석함). 또한, 전구약물에서 모약물(레바미피드)으로의 변화 여부를 분석함과 동시에 반감기를 측정하였다.

<1358>

<1359>

2. 실험 결과

<1360>

상기 실험의 결과를 아래의 표 3 및 도 1에 나타내었다. 표 3은 전구약물의 레바미피드로의 전환 시간(반감기)을 측정한 결과이며, 도 1은 표 3의 결과를 도식화한 것으로서 실시예 47에 의해 제조된 프로드러그(prodrug)인 레바미피드 전구체에서 레바미피드(rebamipide)로의 전환비율을 면적대비로 도식한 것이다.

<1361>

<1362>

도 1에 도식된 실험결과에 대한 그래프를 살펴보면, 프로드러그인 레바미피드 전구체의 경우 2.57분이 경과했을 때 레바미피드로 반이 전환되었음을 확인할 수 있었고, 투여한지 3분이 경과할 때부터 전환속도가 증가하여 약 10분이 경과했을 때에는 전체 양의 레바미피드 전구체가 레바미피드로 전환되었음을 확인할 수 있었다.

<1363>

<1364>

【표 3】

화합물	랫트 전혈 전환 시간($t_{1/2}$)
실시예 14	< 2분
실시예 16	< 2분
실시예 44	< 2분
실시예 47	2.57분
실시예 99	< 2분
실시예 100	< 2분
실시예 102	< 2분
실시예 105	< 2분
실시예 106	< 2분
실시예 109	< 2분
실시예 121	< 2분
실시예 144	< 2분
실시예 151	< 2분
실시예 155	< 2분

<1365>

<1366>

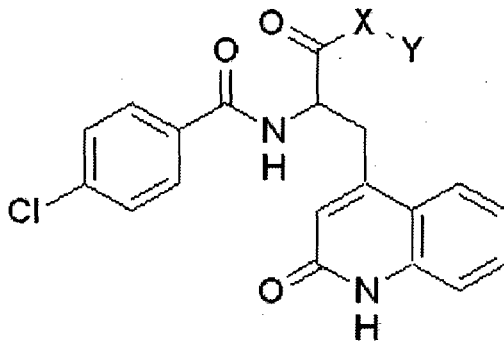
상기 표 3에 의하면 본 발명의 각 실시예에 의해 제조된 레바미피드 전구체의 경우 실시예 47의 경우 2.57분이 소요되었으나 그 외의 실시예들에 의해 제조된 레바미피드 전구체의 경우 모두 2분 이내의 시간에 반 이상의 양이 전구약물인 레바미피드 전구체에서 모 약물인 레바미피드로 전환되었음을 확인할 수 있었다. 일반적으로 통상 30분 이내의 반감기를 갖기에, 약물 흡수를 감안할 때 본원 발명의 레바미피드 전구체는 체내에서 레바미피드로의 전환이 잘 이루어져 약효를 발휘할 수 있음을 확인할 수 있었다.

【청구의 범위】

【청구항 1】

하기 화학식 I의 화합물, 이의 약제학적으로 허용가능한 염, 이성질체, 수화물 및 용매화물로부터 선택된 화합물:

[화학식 I]



상기 식에서,

X는 산소, 질소 또는 황 중 어느 하나이고;

Y는 C₁-C₆알킬, C₁-C₆할로알킬, (C₁-C₃알킬옥시)C₁-C₆알킬, (C₂-C₆알켄일옥시)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬카르보닐옥시)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (아릴설펜일)C₁-C₆알킬, (C₁-C₆알킬아미노)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₆알킬)(C₁-C₆알킬)아미노]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(아릴)아미노]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(아릴)C₁-C₃알킬]아미노C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)(헤테로아릴)아미노]C₁-C₆알킬, (아릴카르보닐아미노)C₁-C₆알킬, C₂-C₆알켄일, C₂-C₆알카인일, C₂-C₆옥소알킬, C₃-C₈사이클로알킬, (C₃-C₈사이클로알킬)C₁-C₆알킬, (C₃-C₈사이클로알켄일)C₁-C₆알킬, (C₃-C₈헤테로사이클로알킬)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(아릴)C₁-C₃알킬]C₃-C₈헤테로사이클로알킬C₁-C₆알킬, [(C₁-C₆알킬옥시카르보닐)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시카르보닐)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로사이클로알킬]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테로사이클로알켄일]C₁-C₆알킬, (아릴)C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시)아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴옥시)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬설펜일)아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬옥시카르보닐)아릴]C₁-C₆알킬, [(아릴옥시카르보닐)아릴]C₁-C₆알킬, (아릴)C₃-C₆알켄일, (헤테로아릴)C₁-C₆알킬, [(알킬옥시카르보닐)헤테로아릴]C₁-C₆알킬, [(C₁-C₃알킬)C₃-C₈헤테

로아릴] C_1 - C_6 알킬, [(C_3 - C_8 사이클로알킬)헤테로아릴] C_1 - C_6 알킬, [(아릴)헤테로아릴] C_1 - C_6 알킬, [(C_1 - C_3 알킬)헤테로아릴] C_1 - C_6 알킬, [(아릴) C_1 - C_3 알킬]헤테로아릴 C_1 - C_6 알킬, (C_1 - C_6 알킬옥시카르보닐) C_1 - C_6 알킬, [(C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬) C_1 - C_6 알킬옥시카르보닐] C_1 - C_6 알킬, (C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬카르보닐) C_1 - C_6 알킬, [(C_1 - C_3 알킬) C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬카르보닐] C_1 - C_6 알킬, [(C_1 - C_3 알킬) C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬카르보닐] C_1 - C_6 알킬, [(C_3 - C_8 사이클로알킬)옥시카르보닐옥시] C_1 - C_6 알킬, [(C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬)옥시카르보닐옥시] C_1 - C_6 알킬, (유레이도) C_1 - C_6 알킬, (아릴유레이도) C_1 - C_6 알킬, [(아릴)(C_1 - C_3 알킬유레이도) C_1 - C_6 알킬, (C_1 - C_6 알킬아미노카르보닐) C_1 - C_6 알킬, [(C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬)아미노카르보닐] C_1 - C_6 알킬, [(C_1 - C_3 알킬) C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬]아미노카르보닐 C_1 - C_6 알킬, [(C_1 - C_3 알킬)(C_1 - C_3 알킬옥시)아미노카르보닐] C_1 - C_6 알킬 또는 (옥소 C_3 - C_8 헤테로사이클로알킬) C_1 - C_6 알킬이고,

이 때, 상기 C_1 - C_6 알킬, C_2 - C_6 알켄일, C_2 - C_6 알카인일, C_2 - C_6 옥소알킬, C_3 - C_8 사이클로알킬, C_3 - C_8 사이클로알켄일, C_3 - C_8 헤테로사이클로알켄일, 아릴 또는 헤테로아릴은 C_1 - C_3 알킬, 플루오로, 클로로, 브로모, 하이드록시기, 옥소, 니트로기 및 시아노기로 이루어진 군으로서 선택된 하나 이상의 치환기로 치환될 수 있다.

【청구항 2】

제1항에 있어서, 하기의 군으로부터 선택되는 화합물:

- 1) 메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 2) 에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 3) 3-메틸부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 4) 헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 5) 2-브로모에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- 6) 2-하이드록시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 7) 메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 8) 2-메톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 9) 2-비닐옥시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 10) 2-아세톡시에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 11) 2-메틸설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 12) 2-페닐설파닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 13) 2-메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 14) 2-다이메틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 15) 2-다이메틸아미노-1-메틸-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 16) 2-다이에틸아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 17) 2-다이아이소프로필아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 18) 3-다이메틸아미노프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 19) 2-(메틸 페닐 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 20) 2-(벤질 에틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 21) 2-(벤조옥사졸-2-일 메틸 아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

22) 2-벤조일아미노에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

23) 알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

24) 부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

25) 3-메틸부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

26) 프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트

27) 2-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

28) 2-옥소부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

29) 사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

30) 사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

31) 사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

32) 사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

33) 사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

34) 사이클로펜트-3-엔일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

35) 옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

36) 3-메틸옥세탄-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

37) 2-(1-메틸피롤리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- 38) 2-피롤리딘-1-일-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 39) 테트라하이드로퓨란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 40) [1,3]다이옥솔란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 41) 2-[1,3]-다이옥소란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 42) 1-메틸피페리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 43) 1-메틸피페리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 44) 2-피페리딘-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 45) 테트라하이드로피란-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 46) 2-[1,3]다이옥산-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 47) 2-모폴린-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 48) 3-모폴린-4-일프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 49) 4-모폴린-4-일부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 50) 6-모폴린-4-일헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 51) (4-메틸피페라진-1-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 52) 2-(4-벤질피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 53) 4-[4-(3-클로로페닐)피페라진-1-일]부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

54) (4-*tert*-부틸옥시카르보닐피페라진-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

55) 2-아제판-1-일에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

56) 2-(2-옥소피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

57) (2-옥소옥사졸리딘-5-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

58) 4-모폴린-4-일-시스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

59) 4-모폴린-4-일-트랜스-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

60) 5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

61) 벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

62) 펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

63) 2-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

64) 3-메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

65) 3,4-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

66) 3,5-다이메틸벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

67) 3-플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

68) 2,5-다이플루오로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

69) 3-시아노벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

70) 3-니트로벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

71) 4-메톡시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

72) 3-페녹시벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

73) 4-메틸설파닐벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

74) (4-메틸옥시카르보닐)벤질 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트];

75) (3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

76) 나프탈렌-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

77) 안트라센-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

78) 2-피롤-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

79) (2-에톡시카르보닐)퓨란-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

80) 2-티오펜-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

81) 2-티오펜-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

82) 2-이미다졸-1-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

83) 5-사이클로프로필-2-메틸-2H-피라졸-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

84) 3,5-다이메틸아이속사졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

85) 2-(5-메틸-4-페닐옥사졸-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

86) 2-메틸티아졸-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

87) 2-(4-메틸티아졸-5-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

88) 피리딘-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

89) 피리딘-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

90) 피리딘-4-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

91) 2-(피리딘-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

92) 퀴놀린-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

93) 퀴놀린-3-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

94) 2-(1-메틸-1H-인돌-3-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

95) 벤조티아졸-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

96) 2,3-다이하이드로벤조[1,4]다이옥신-2-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

97) 카바졸-9-일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

98) 메틸카바모일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

99) 2-(4-메틸피페라진-1-일)-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

100) 1-(4-메틸피페라진-1-카르보닐)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

101) 2-모폴린-4-일-2-옥소에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;

- 102) (메톡시메틸카바모일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 103) 2-에톡시카르보닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 104) 2-에톡시카르보닐에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 105) 2-모폴린-4-일-에톡시카르보닐메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 106) 2-모폴린-4-일에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐옥시]부티레이트;
- 107) 2-(1,3-다이옥소-1,3-다이하이드로아이소인돌-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 108) 사이클로헥실옥시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 109) 2-모르폴린-4-일-에톡시카르보닐옥시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 110) 2-유레이도에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 111) 2-(3-페닐-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 112) 2-(3-벤질-유레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 113) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피온산;
- 114) S-메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 115) S-에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 116) S-프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 117) S-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- 118) S-(3-메틸부틸)2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 119) S-헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 120) S-(2-다이에틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 121) S-(2-다이에틸아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 122) S-(2-다이아이소프로필아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 123) S-(2-다이에틸아미노)프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 124) S-(2-벤조일아미노)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트 옥살레이트;
- 125) S-메톡시메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 126) S-(2-벤조일옥시)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 127) S-(2-메틸설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 128) S-(2-페닐설파닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 129) S-(2-벤젠설포닐)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트;
- 130) S-(2-옥소부틸) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 131) S-(2-우레이도)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 132) N,N-다이에틸 S-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)]티오키바메이트;
- 133) S-알릴 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

- 134) S-부트-2-엔일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 135) S-프로프-2-인일 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 136) S-사이클로펜틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 137) S-사이클로헥실 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 138) S-사이클로프로필메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 139) S-사이클로부틸메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 140) S-사이클로헥실메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 141) S-(사이클로펜트-3-엔일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 142) S-옥시란일메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 143) S-(테트라하이드로퓨란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 144) S-(2-피롤리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 145) S-[2-(1-메틸피롤리딘-2-일)]에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 146) S-([1,3]다이옥솔란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 147) S-(2-[1,3]다이옥솔란-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 148) S-(2-피페리딘-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;
- 149) S-(1-메틸피페리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

150) S-4-[4-(4-클로로페닐)피페라진-1-일]-부틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

151) S-(2-모폴린-4-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

152) S-(테트라하이드로피란-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

153) S-(2-[1,3]-다이옥산-2-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

154) S-(2-아제판-1-일)에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

155) S-(5-메틸-2-옥소-[1,3]다이옥솔-4-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

156) S-벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

157) S-펜에틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

158) S-(2-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

159) S-(3-메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

160) S-(3,4-다이메틸벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

161) S-(4-플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

162) S-(2,5-다이플루오로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

163) S-(3-클로로벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

164) S-(3,5-다이브로모벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

165) S-(3-시아노벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

166) S-(4-시아노벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

167) S-(3-메톡시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

168) S-(4-메톡시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

169) S-(3-페녹시벤질) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

170) S-(3-메톡시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

171) S-(3-페닐옥시카르보닐)벤질 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

172) S-[2-(4-메틸티아졸-5일)에틸] 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

173) S-(피리딘-2-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

174) S-(피리딘-3-일)메틸 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

175) S-(3-페닐알릴) 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

176) S-에톡시-3-옥소프로필 2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)티오프로피오네이트;

177) 에틸 [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세테이트;

178) [2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]아세트산;

179) 에틸 4-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]부티레이트;

180) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-4-메틸 펜타노에이트;

181) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오닐아미노]-3-페닐 프로피오네이트;

- 182) 에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트]; 3-(1H-인돌-3-일)프로피오네이트;
- 183) 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트]; 3-(1H-인돌-3-일)프로피오네이트;
- 184) 다이에틸 2-[2-(4-클로로벤조일아미노)-3-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)프로피오네이트]; 3-(1H-인돌-3-일)프로피오네이트;
- 185) 4-클로로-N-[1-[2-(3H-이미다졸-4-일)에틸카바모일]-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드;
- 186) 4-클로로-N-[2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)-1-(2-피롤리딘-1-일)에틸카바모일]에틸]벤즈아마이드; 및
- 187) 4-클로로-N-[1-(2-모놀린-4-일-에틸카바모일)-2-(2-옥소-1,2-다이하이드로퀴놀린-4-일)에틸]벤즈아마이드.

【청구항 3】

제1항 또는 제2항에 있어서, 상기 염은 약학적으로 허용 가능한 유리산(free acid)에 의하여 형성된 산 부가염인 것을 특징으로 하는 화합물.

【청구항 4】

제3항에 있어서, 상기 유리산은 유기산 또는 무기산인 것을 특징으로 하는 화합물.

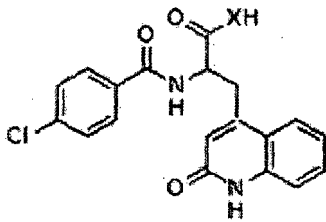
【청구항 5】

제4항에 있어서, 상기 유기산은 구연산, 초산, 젖산, 주석산, 말레인산, 푸마르산, 포름산, 프로피온산, 옥살산, 트리클로로아세트산, 벤조산, 클로로산, 메탄설폰산, 클리클산, 석신산, 4-클로로벤조일아미노산, 캄페르산, 아스파르트산, 말리클산, 말론산, 말산 및 벤조설폰산으로 이루어진 군으로부터 선택되며, 상기 무기산은 염산, 브롬산, 황산 및 인산으로 이루어진 군으로부터 선택되는 것을 특징으로 하는 화합물.

【청구항 6】

하기 화학식 II의 화합물을 하기 화학식 III의 화합물과 반응시키는 단계를 포함하는, 제1항의 화학식 I의 화합물을 제조하는 방법:

[화학식 II]



[화학식 III]

Y-Z

상기 식에서,

X 및 Y는 제1항에 정의된 바와 같으며, Z는 하이드록시, 아미노, 아민, 할로젠 또는 이탈기(Leaving group)이다.

【청구항 7】

제6항에 있어서, 상기 Z가 하이드록시기, $-NH_2$, Cl, Br, 알킬설포닐 또는 아릴설포닐인 것을 특징으로 하는, 방법.

【청구항 8】

제1항 또는 제2항의 화합물을 유효성분으로 포함하는, 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염, 고지혈증, 고중성지방증, 당뇨, 과민성대장증후군 또는 비만의 예방 또는 치료용 약제학적 조성물.

【청구항 9】

제1항 또는 제2항의 화합물을 이를 필요로 하는 대상에 투여하는 것을 포함하는, 대상에서의 위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염, 고지혈증, 고중성지방증, 당뇨, 과민성대장증후군 또는 비만의 예방 또는 치료방법.

【청구항 10】

위궤양, 급성 위염, 만성 위염, 안구 건조 증후군, 암, 골관절염, 류마티스 관절염, 고지혈증, 고중성지방증, 당뇨, 과민성대장증후군 또는 비만의 예방 또는 치료를 위한 제1항 또는 제2항의 화합물의 용도.