

【公報種別】特許法第 17 条の 2 の規定による補正の掲載

【部門区分】第 3 部門第 2 区分

【発行日】平成30年11月8日 (2018.11.8)

【公表番号】特表2017-535525(P2017-535525A)

【公表日】平成29年11月30日 (2017.11.30)

【年通号数】公開・登録公報2017-046

【出願番号】特願2017-517316(P2017-517316)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

C 0 7 H 5/06 (2006.01)

C 0 7 H 15/08 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 213/80 (2006.01)

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

C 0 7 D 213/79 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/675 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 27/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

C 0 7 F 9/58 (2006.01)

C 0 7 F 9/6512 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/74 C S P

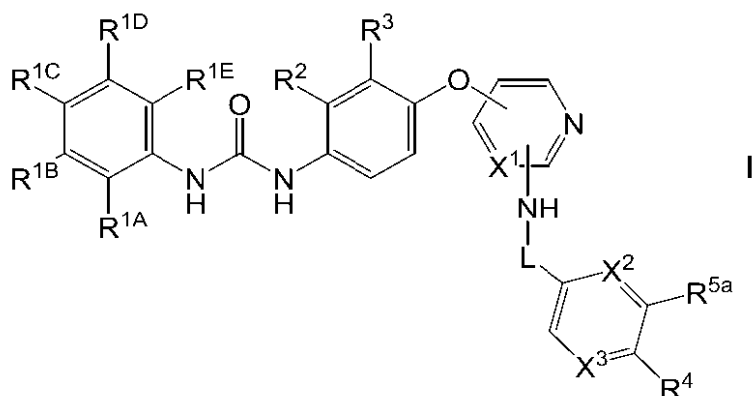
C 0 7 D 401/12

| | | |
|---------|---------|-------|
| C 0 7 D | 413/12 | |
| C 0 7 D | 239/47 | Z |
| C 0 7 H | 5/06 | |
| C 0 7 H | 15/08 | |
| C 0 7 D | 405/12 | |
| C 0 7 D | 213/80 | |
| C 0 7 D | 453/02 | |
| C 0 7 D | 213/79 | |
| A 6 1 K | 31/44 | |
| A 6 1 K | 31/5377 | |
| A 6 1 K | 31/541 | |
| A 6 1 K | 31/4545 | |
| A 6 1 K | 31/496 | |
| A 6 1 K | 31/551 | |
| A 6 1 K | 31/4439 | |
| A 6 1 K | 31/553 | |
| A 6 1 K | 31/506 | |
| A 6 1 K | 31/505 | |
| A 6 1 K | 31/706 | |
| A 6 1 K | 31/675 | |
| A 6 1 K | 31/444 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 29/00 | |
| A 6 1 P | 11/00 | |
| A 6 1 P | 11/06 | |
| A 6 1 P | 17/04 | |
| A 6 1 P | 17/06 | |
| A 6 1 P | 11/02 | |
| A 6 1 P | 27/14 | |
| A 6 1 P | 27/04 | |
| A 6 1 P | 27/06 | |
| A 6 1 P | 27/02 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 37/08 | |
| C 0 7 F | 9/58 | Z |
| C 0 7 F | 9/6512 | |

【手続補正書】**【提出日】**平成30年10月1日(2018.10.1)**【手続補正 1】****【補正対象書類名】**特許請求の範囲**【補正対象項目名】**全文**【補正方法】**変更**【補正の内容】****【特許請求の範囲】****【請求項 1】**

式 I の化合物：

【化 1】



式中：

R^{1A} は、

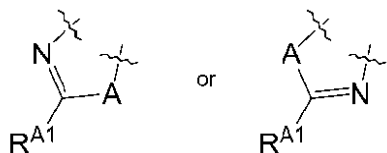
$C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、または $C_2 \sim 6$ アルキニルであり、これら $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、または $C_2 \sim 6$ アルキニルは $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、 $-OP(O)(OH)_2$ および $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、

またはH、ハロ、またはシアノであるか、

フェニルまたは Het^1 であり、これらフェニルまたは Het^1 は、 $C_1 \sim 2$ アルキルおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、

または R^{1A} と R^{1B} は結合して以下から選択される構造フラグメントとなり、

【化 2】



式中、波線はフェニル環との結合点であり；

Aは、O、SまたはN(R^{A2})であり；

R^{A1} は、H、 $C_1 \sim 4$ アルキルまたはヒドロキシであり；

R^{A2} は、Hまたは $C_1 \sim 4$ アルキルであり；

R^{1B} は、 $-NR^XS(O)_2R^{Y1}$ 、 $-C(O)NR^XR^Y$ 、H、ハロ、シアノ、 $-C_1 \sim 4$ アルキレン-CN、 $-C_1 \sim 4$ アルキレン-OH、 $-NR^XR^{X1}$ 、 $-C(O)OR^X$ 、 $-S(O)_2NR^XR^Y$ 、 $-NR^XC(O)R^Y$ 、 $-NR^{X2}S(O)_2NR^XR^Y$ 、 $-NR^XP(O)R^{Y1}R^{Y2}$ 、 $-NR^XC(O)OR^{Y1}$ またはハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 2$ アルキルおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい Het^1 であり；

R^X および R^{X1} は、独立して、H、またはハロ、ヒドロキシ、 $-OP(O)(OH)_2$ および $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルであるか、または R^X および R^{X1} は結合することで $-O-$ もしくは $-N(R^{X2})-$ がC2とC3の間に割り込んでいる $C_3 \sim 6n$ -アルキレンもしくは $C_4 \sim 5n$ -アルキレンであり、または R^{X1} はハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 2$ アルキルおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい Het^1 であり；

R^Y 、 R^{Y1} および R^{Y2} は、独立して、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 であり、これら $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 は、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、 $-OP(O)(OH)_2$ 、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)O-(C_1 \sim 4$ アルキル)および $-N(R^a)(R^b)$ から選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、および/またはこの Het^2 基は1つ以上のオキソ基で置換されており、

または R^Y は、H であり、

または R^X および R^Y は結合することで、 $-O-$ 、 $-S(O)_n-$ もしくは $-N(R^{X2})$ が C2 と C3 の間に割り込んでいる $C_3 \sim_6 n$ - アルキレンもしくは $C_4 \sim_5 n$ - アルキレンであり；

R^a および R^b は、独立して、H、メチルもしくは $-C(R^c)(R^d)-C_1 \sim_3$ アルキルであり、これら $-C(R^c)(R^d)-C_1 \sim_3$ アルキルの $C_1 \sim_3$ アルキル部分は 1 つ以上のヒドロキシ置換基で置換されていてもよく、

または R^a および R^b は結合することで、 $-O-$ 、 $-S(O)_m-$ もしくは $-N(R^{X2})$ が C2 と C3 の間に割り込んでいる $C_3 \sim_6 n$ - アルキレンもしくは $C_4 \sim_5 n$ - アルキレンであり；

R^c および R^d は、独立して、H またはメチルであり；

各 R^{X2} は、独立して、H または $C_1 \sim_4$ アルキルであり；

R^{1C} および R^{1E} は、独立して、H、ハロ、シアノまたはメチルであり；

但し、 R^{1A} 、 R^{1B} 、 R^{1C} および R^{1E} のうち少なくとも 1 つは H 以外であり；

R^{1D} は、トリメチルシリル、 $C_2 \sim_7$ アルキル、 $C_2 \sim_7$ アルケニル、 $C_2 \sim_7$ アルキニル、 $C_3 \sim_7$ シクロアルキル、フェニル、 $He t^1$ または $He t^2$ であり、これら $C_2 \sim_7$ アルキル、 $C_2 \sim_7$ アルケニル、 $C_2 \sim_7$ アルキニル、 $C_3 \sim_7$ シクロアルキル、フェニル、 $He t^1$ または $He t^2$ $C_2 \sim_7$ アルキル、 $C_2 \sim_7$ アルケニル、 $C_2 \sim_7$ アルキニル、 $C_3 \sim_7$ シクロアルキル、フェニル、 $He t^1$ または $He t^2$ は $C_1 \sim_2$ アルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、 $-OP(O)(OH)_2$ および $C_1 \sim_2$ アルコキシから選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよく；

R^2 および R^3 はそれらが結合している C 原子と結合することで、縮合フェニル環または縮合ピリジル環を形成し、これら 2 つの環は $C_1 \sim_3$ アルキル、 $C_1 \sim_3$ ハロアルキル、シアノおよびハロから選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよく；

または R^2 および R^3 のうちの 1 つは、H、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim_3$ アルキルもしくは $C_1 \sim_3$ ハロアルキルであり、他方は、独立して、ハロ、シアノ、 $C_1 \sim_3$ アルキルもしくは $C_1 \sim_3$ ハロアルキルであるか、

または R^2 および R^3 は結合することで、 $C_3 \sim_5$ アルキレンもしくは $C_3 \sim_5$ アルケニレンを形成し、これら $C_3 \sim_5$ アルキレンもしくは $C_3 \sim_5$ アルケニレンは $C_1 \sim_3$ アルキル、 $C_1 \sim_3$ ハロアルキル、シアノおよびハロから選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよく；

X^1 は、N または CH であり；

L は、直接結合または $C_1 \sim_2$ アルキレンであり；

X^2 は、 CR^Z または N であり；

X^3 は、 CR^{5b} または N であり；

R^Z は、H、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim_3$ アルキルまたは $C_1 \sim_3$ アルコキシであり、これら $C_1 \sim_3$ アルキルまたは $C_1 \sim_3$ アルコキシは 1 つ以上のハロ原子で置換されていてもよく；

R^4 は、

$-Q^1-[C(R^{6c})(R^{6d})-(CH_2)_{0 \sim 1}CH_2-Z]_{1 \sim 12}-CH_2(CH_2)_{0 \sim 1}CH_2-R^{6a}$ 、

$C_1 \sim_5$ アルキレンがオキソおよび / または 1 つ以上の R^{6e} で置換されていてもよい - $Q^2-C(R^{6c})(R^{6d})-[C_1 \sim_5 \text{ アルキレン }]-R^{6a}$ 、

$C_1 \sim_4$ アルキレン基がオキソおよび / または 1 つ以上の R^{6e} で置換されていてもよく、 $He t^{x1}$ 基がハロ、ヒドロキシ、オキソ、 $C_3 \sim_6$ シクロアルキル、 $C_1 \sim_3$ アルコキシおよび $C_1 \sim_4$ アルキル部分が 1 つ以上の R^{6e} で置換されていてもよい - $[C(O)]_{0 \sim 1}-C_1 \sim_4$ アルキル) から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい、 $-Q^3-[C_1 \sim_4 \text{ アルキレン }]_{0 \sim 1}-He t^{x1}$ 、

$C_1 \sim_4$ アルキレン基がオキソおよび / または 1 つ以上の R^{6e} で置換されていてもよく、フェニル基が、 $C_1 \sim_4$ アルキル部分が 1 つ以上の R^{6e} で置換されていてもよい - $[C($

O)]_{0~1} - C_{1~4}アルキル)で置換されており、フェニル基がハロ、ヒドロキシ、オキソ、C_{3~6}シクロアルキルおよびC_{1~3}アルコキシから選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよい、- Q²² - [C_{1~4}アルキレン]_{0~1} - フェニル、

- S(O)_pR^{6b}、

- [C_{1~4}アルキレン]_{0~1} - CO₂H、

He t^{x2}基がハロ、ヒドロキシ、オキソ、C_{1~3}アルキルおよびC_{1~3}アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい、He t^{x2}、

- COR^{6b}、

- CH₂OH、

- CH₂OP(O)(OH)₂または

- Q⁴ - P(O)(OR⁹)(R⁷)

であり；

Zは、それぞれ独立して、O、C(O)N(R⁸)またはN(R⁸)C(O)であり；

R^{5a}およびR^{5b}は、独立して、C_{1~3}アルコキシもしくはC_{1~3}アルキルであり、これらC_{1~3}アルコキシもしくはC_{1~3}アルキルは1つ以上のハロ原子で置換されていてもよく、またはR^{5a}およびR^{5b}は、独立して、- N(R^e)(R^f)、C_{2~3}アルキニル、H、シアノ、- C(O)NH₂、ヒドロキシ、ハロもしくは- S(O)_{0~2} - C_{1~3}アルキルであり；

R^{6a}は、OR^{7a}、- S(O)_{0~2}R^{7aa}、N(R^{7b})R^{7c}もしくはCO₂Hであり；

R^{6b}は、C_{1~8}アルキル、C_{3~8}シクロアルキル、フェニル、He t¹もしくはHe t²であり、これらC_{1~8}アルキル、C_{3~8}シクロアルキル、フェニル、He t¹もしくはHe t²はハロ、ヒドロキシ、- OP(O)(OH)₂、C_{1~3}アルキル、C_{1~3}アルコキシ、C_{1~3}アルキレン - R^{6e}およびCO₂Hから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく；

またはR^{6b}は、C_{1~4}アルキレン - He t³であり、He t³基はハロ、ヒドロキシ、オキソ、C_{3~6}シクロアルキル、C_{1~3}アルコキシおよびC_{1~3}アルキル基が1つ以上のR^{6e}で置換されていてもよい - [C(O)]_{0~1} - C_{1~3}アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、

または、pが1もしくは2の場合、R^{6b}は代わりにOHであってもよく、

または、pが2の場合、R^{6b}は代わりに- N(R^{7b})R^{7c}もしくは- N(R^{7b}) - C(O) - R^{7c}であってもよく；

R^{6e}は、それぞれ独立して、ハロ、ヒドロキシ、- OP(O)(OH)₂、C_{1~3}アルコキシ、- N(R^g)(R^h)もしくは- CO₂Hであり；

R^{7a} ~ R^{7c}は、独立して、Hもしくは1つ以上のハロ原子もしくは- CO₂Hで置換されていてもよいC_{1~4}アルキルであり、

またはR^{7a}は、P(O)(OH)₂もしくはHe t³であり、He t³は、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、C_{3~6}シクロアルキル、C_{1~3}アルコキシおよびC_{1~3}アルキル基が1つ以上のR^{6e}で置換されていてもよい - [C(O)]_{0~1} - C_{1~3}アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、

またはR^{7b}および/またはR^{7c}は、- [C_aアルキレン] - [C_bアルキレン] - OR^{7d}であり、

またはR^{7b}およびR^{7c}はそれらが結合しているN原子を介して、1個のN原子(R^{7b}およびR^{7c}が結合している原子)を含み、O、SおよびNから選択される1つ以上のさらなるヘテロ原子を含んでもよく、ハロ、ヒドロキシ、オキソ、C_{1~4}アルキル、C_{1~4}アルコキシおよびC_{1~4}ヒドロキシアルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい、完全飽和、部分的不飽和もしくは完全芳香族である4員~7員複素環基を形成し；

aおよびbは、独立して、1、2および3から選択される整数であり、aとbの合計が2、3または4であり；

R^{7d}は、Hまたは1つ以上のハロ原子で置換されていてもよいC_{1~4}アルキルであり；

R^{7aa} は、 $-C(R^{7d})(R^{7e})-C_1\sim_3$ アルキレン- OH または1つ以上のハロ原子もしくは $-CO_2H$ で置換されていてもよい $C_1\sim_4$ アルキルであり；

Q^1 、 Q^2 、 Q^{22} および Q^3 は、独立して、 $-C(O)N(R^8)-$ 、 $-O-$ もしくは $-S(O)_2N(R^8)-$ であるか、または Q^1 、 Q^2 および Q^{22} は、独立して $S(O)_q$ であり；

Q^4 は、直接結合または $C_1\sim_3$ アルキレンであり；

n 、 m 、 p および q は、独立して、0、1または2であり；

R^{6c} 、 R^{6d} 、 R^e 、 R^f 、 R^g 、 R^h および R^8 は、独立して、 H またはメチルであるか、または R^{6c} および R^{6d} は、独立して、ヒドロキシメチルであり；

R^7 は、 H 、ヒドロキシ、 $C_1\sim_4$ アルキル、 $C_1\sim_4$ アルコキシ、 $C_3\sim_7$ シクロアルキル、またはフェニルであり、これら $C_1\sim_4$ アルキル、 $C_1\sim_4$ アルコキシ、 $C_3\sim_7$ シクロアルキル、またはフェニルはハロ、 OH 、 $C_1\sim_3$ アルキルおよび $C_1\sim_3$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく；

R^9 は、 H または $C_1\sim_4$ アルキルであり、この $C_1\sim_4$ アルキルは1つ以上のハロ原子またはフェニルで置換されていてもよく、このフェニル基はハロ、 OH 、 $C_1\sim_3$ アルキルおよび $C_1\sim_3$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく；

Het^{x1} および Het^{x2} は、独立して、 Het^{1a} または Het^3 であり；

Het^1 および Het^{1a} は、それぞれ独立して、 N 、 O および S から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む完全芳香族である5員もしくは6員複素環基であり；および

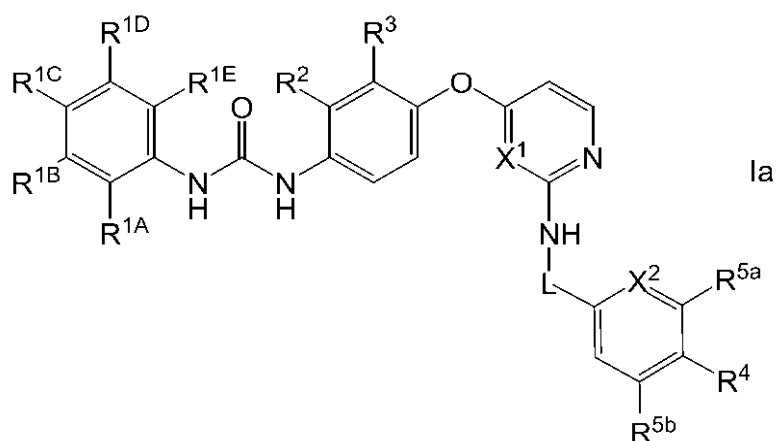
Het^2 および Het^3 は、それぞれ独立して、 N 、 O および S から選択される1つ以上のヘテロ原子を含む単環式複素環基または縮合複素環基もしくは架橋二環式複素環基である完全飽和または部分的不飽和である4員～9員複素環基である化合物；

またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体。

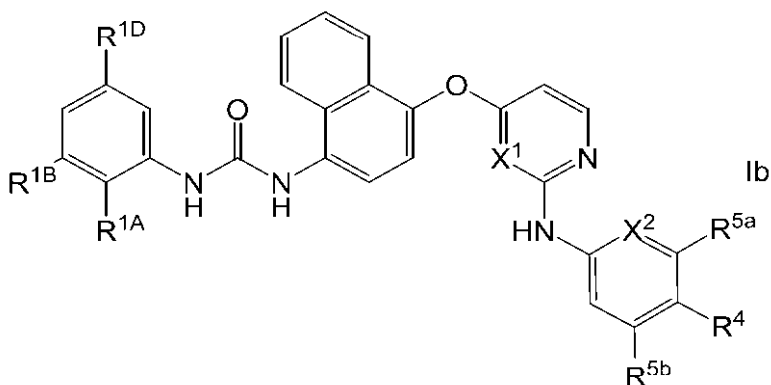
【請求項2】

式Ia、IbまたはIcの化合物；

【化3】



【化4】



またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体

(式中、 $R^{1A} \sim R^{1E}$ 、 $R^2 \sim R^4$ 、 R^{5a} 、 R^{5b} 、 L 、 X^1 および X^2 は請求項1に記載の通りである)

である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

(a) R^{1A} は、1つ以上のハロ置換基で置換されていてもよい $C_1 \sim 2$ アルコキシであるか、または R^{1A} は、Hである；

(b) R^{1B} は、 $-N(H)S(O)_2R^{Y1}$ 、 $-N(R^{XX})S(O)_2R^{Y1}$ 、 $-C(O)N(H)R^Y$ 、 $-C(O)N(R^{XX})R^Y$ 、 $-S(O)_2N(H)R^Y$ 、 $-N(H)C(O)R^Y$ 、 $-N(H)C(O)R^{YY}$ または $-N(H)S(O)_2NR^XR^Y$ である；

(c) R^X は、Hまたはメチルであり、

R^{XX} は、 $-CH_2CH_2-OP(O)(OH)_2$ もしくは $-CH_2CH_2-OH$ であり、

R^Y および R^{Y1} は、独立して、 $C_1 \sim 2$ アルキルであるか、 R^Y は、Hであり、

または R^X および R^Y は結合して、 $-O-$ もしくは $-N(R^{X2})-$ がC2とC3の間に割り込んでいてもよい $C_4 \sim 5n$ -アルキレンであり、

R^{YY} は、ヒドロキシもしくは $-OP(O)(OH)_2$ で置換されている $C_1 \sim 3$ アルキルおよび/または

R^{X2} は、Hもしくはメチルである；

(d) R^{1C} および R^{1E} が両方ともHである；

(e) R^{1D} は、トリメチルシリル、 $C_3 \sim 5$ アルキル、 $C_3 \sim 5$ アルキニルまたは Het^2 であり、これら $C_3 \sim 5$ アルキル、 $C_3 \sim 5$ アルキニルまたは Het^2 はシアノ、ヒドロキシもしくはメトキシで置換されていてもよく、および/または Het^2 基はメチルおよびハロから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい；

(f) R^2 および R^3 は、それらが結合しているC原子と結合することで、縮合フェニル環を形成するか、または R^2 および R^3 は両方ともクロロである；

(g) L は、直接結合であり、

X^2 は、 CR^Z および/または

R^Z は、Hである；

(h) R^4 は、

$-Q^1-[C(R^{6c})(R^{6d})-(CH_2)_{0 \sim 1}CH_2-Z]_{1 \sim 3}-CH_2CH_2-R^{6a}$

、 $C_1 \sim 4$ アルキレン基がオキソならびに/またはヒドロキシおよび $-N(R^g)(R^h)$ から選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい $-Q^2-C(R^{6c})(R^{6d})-[C_1 \sim 4$ アルキレン] $-R^{6a}$ 、

$C_1 \sim 4$ アルキレン基がオキソならびに/またはヒドロキシ、 $-N(R^g)(R^h)$ および $-CO_2H$ から選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよく、 Het^{x1} 基がハロ、ヒドロキシ、オキソ、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $C_1 \sim 3$ ヒドロキシアルキル、 $C_3 \sim 5$ シクロアルキルおよび $C_1 \sim 3$ アルキル部分がヒドロキシ、 $-N(R^g)(R^h)$ および $-CO_2H$ から選択される1つ以上の基で置換されていてもよい $-C(O)-C_1 \sim 3$ アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい $-Q^3-[C_1 \sim 4$ アルキレン] $_{0 \sim 1}-Het^{x1}$ 、

$-S(O)_{1 \sim 2}R^{6b}$ 、

メチルまたはヒドロキシで置換されていてもよい Het^{1a} 、

オキソで置換されていてもよい Het^3 、

CO_2H 、

$-COR^{6b}$ または

$-P(O)(OR^g)(R^7)$ であり、

Z は、それぞれ独立して、 $C(O)NH$ 、 $NHC(O)$ またはOであり、

R^{6a} は、 CO_2H 、 OR^{7a} または $N(R^{7b})R^{7c}$ であり、

R^{6b} は、

ヒドロキシ、 CO_2H 、ヒドロキシメチルおよび $-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}^g)(\text{R}^h)$ から選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい Het^2 、

$\text{C}_1\sim_3$ アルキル (例えば、メチル)、

または、 p が 1 の場合、 R^{6b} は代わりに OH であってもよく、

または、 p が 2 の場合、 R^{6b} は代わりに $-\text{NH}_2$ もしくは $-\text{N}(\text{H})-\text{C}(\text{O})-\text{C}_1\sim_2$ アルキルであってもよく、

R^{6c} および R^{6d} は、独立して、 H 、メチル、またはヒドロキシメチルであり、

R^7 は、 H 、ヒドロキシ、メチル、エチルまたはフェニルであり、

R^{7a} は、

ヒドロキシ、メチルおよびヒドロキシメチルから選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい Het^3 または

H 、メチル、もしくは $\text{P}(\text{O})(\text{OH})_2$ であり、

R^{7b} および R^{7c} は、独立して、 H もしくはメチルであるか、

または R^{7b} は、 H もしくはメチルであり、 R^{7c} は、 $-\text{[C}_1\sim_2\text{アルキレン]}-\text{CH}_2-\text{OR}^{7d}$ であるか、

または R^{7b} および R^{7c} はそれらが結合している N 原子を介して、1 個の N 原子 (R^{7b} および R^{7c} が結合している原子) を含み、 O 、 S および N から選択される 1 個のさらなるヘテロ原子を含んでもよく、ヒドロキシ、オキソ、メチルおよび $\text{C}_1\sim_2$ ヒドロキシアルキルから選択される 1 つ以上の置換基で置換されていてもよい、完全飽和もしくは部分的不飽和である 5 員～7 員複素環基を形成し、

R^{7d} は、 H もしくは $\text{C}_1\sim_2$ アルキルであり、

R^9 は、 H もしくはエチルであり、

Q^1 、 Q^2 および Q^3 は、独立して、 $\text{C}(\text{O})\text{NH}$ 、 $\text{S}(\text{O})_2$ 、 $\text{S}(\text{O})$ 、 $\text{S}(\text{O})_2\text{N}$ R^8 もしくは O であり、

R^8 は、 H もしくはメチルおよび / または

R^9 および R^h は、独立して、 H もしくはメチルである；

(i) R^{5a} および R^{5b} は、独立して、 H もしくは $\text{C}_1\sim_2$ アルコキシであるか、または R^{5a} は、 OH 、ハロ、 $\text{C}_1\sim_2$ アルキル、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、エチニルもしくはシアノである；および / または

(j) Het^{1a} は、 N 原子を含み、 N 、 O および S から選択される 1～3 個のさらなるヘテロ原子を含んでもよい完全芳香族の 5 員または 6 員複素環基、および / または

Het^2 および Het^3 は、それぞれ独立して、単環式複素環基であるかもしくは架橋二環式複素環基であり、 N 、 O および S から選択される 1 個もしくは 2 個のヘテロ原子を含む、完全飽和もしくは部分的不飽和である 5 員～8 員複素環基である、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

(a) R^{1A} は、 H またはメトキシであり、

R^{1B} は、 $-\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH})\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{N}[\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2]\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{H})-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{OH}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{OP}(\text{O})(\text{OH})_2$ 、 $-\text{N}(\text{H})\text{S}(\text{O})_2\text{CH}_3$ または $-\text{C}(\text{O})\text{NH}_2$ であり、

R^{1D} は、 C_4 アルキルであり、

X^1 は、 CH または N であり、

X^2 は、 CR^Z であり、

R^Z は、 H であり、

R^4 は、

$-\text{Q}^1-[\text{C}(\text{H})(\text{R}^{6c})-\text{CH}_2-\text{Z}]_1\sim_3\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{R}^{6a}$ 、

$-\text{C}(\text{O})\text{NH}-[\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{O}]-[\text{CH}_2(\text{CH}_2)_{0\sim 1}\text{CH}_2-\text{O}]_{0\sim 1}$

$-\text{CH}_2\text{CH}_2-\text{R}^{6a}$ 、

$\text{C}_1\sim_3$ アルキレン基がオキソおよび / または 1 つ以上のヒドロキシ基で置換されてい

てもよい - $Q^2 - C(R^{6c})(R^{6d}) - [C_1 \sim 4 \text{ アルキレン}] - R^{6a}$ 、

H e t³基がハロ、ヒドロキシ、オキソ、 $C_1 \sim 3$ アルキル、メトキシ、 $C_3 \sim 4$ シクロアルキル、 $C_1 \sim 2$ ヒドロキシアルキルおよび $C_1 \sim 3$ アルキル部分がヒドロキシ、- N (R^g) (R^h) もしくは CO_2H で置換されている - C (O) - $C_1 \sim 3$ アルキルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい $Q^3 - [C_1 \sim 4 \text{ アルキレン}]_0 \sim 1 - H e t^3$ 、

$C_1 \sim 4$ アルキレン基が CO_2H で置換されていてもよい - C (O) N H - $C_1 \sim 4$ アルキレン - H e t^{1a}、

- S (O)₁ ~ ₂ C H₃、

- S (O) O H、

- S (O)₂ N H₂、

- S (O)₂ N H - C (O) - $C_1 \sim 2$ アルキル、

H e t^{1a}、

オキソで置換されていてもよいH e t³、

CO_2H 、

H e t³基が、ヒドロキシ、 CO_2H 、ヒドロキシメチルおよび - C H₂ C H₂ - N (R^g) (R^h) から選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい - C (O) - H e t³、

- P (O) (O - C H₂ C H₃) (R⁷) または

- P (O) (O H) (R⁷) であり、

R^{5a}およびR^{5b}は、独立して、Hもしくはメトキシであるか、またはR^{5a}は、メチル、ヒドロキシ、エチニル、シアノ、ハロもしくは - N (C H₃)₂であり、

R^{6a}は、O R^{7a}またはN (R^{7b}) R^{7c}であり、

R^{6c}はH、メチルもしくはヒドロキシメチルであり、R^{6d}はHであるか、またはR^{6c}およびR^{6d}は両方ともヒドロキシメチルであり、

R⁷は、メチルであり、

R^{7a}は、

ヒドロキシおよびヒドロキシメチルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよいH e t³であるか、または

H、メチル、またはP (O) (O H)₂であり、

R^{7b}およびR^{7c}は、独立して、Hもしくはメチルであるか、

またはR^{7b}は、Hもしくはメチルであり、R^{7c}は、- C H₂ C H₂ - O R^{7d}であるか、

またはR^{7b}およびR^{7c}はそれらが結合しているN原子を介して、1個のN原子 (R^{7b}およびR^{7c}が結合している原子) を含み、O、SおよびNから選択される1個のさらなるヘテロ原子を含んでもよく、フルオロ、ヒドロキシ、オキソおよびメチルから選択される1つ以上の置換基で置換されていてもよい完全飽和である5員~7員複素環基を形成し、

R^{7d}は、Hまたはメチルであり、

Q¹、Q²およびQ³は、独立して、C (O) N H、S (O)₂、S (O)、S (O)₂ N R⁸もしくはOであり、

R⁸は、メチル、および/または

H e t³は、完全飽和であり、N、OおよびSから選択される1個または2個のヘテロ原子を含む5員~7員複素環基、

および/または

(b) R^{5a}およびR^{5b}は両方ともHであり、

R^{5a}およびR^{5b}は両方ともメトキシであるか、または

R^{5a}はシアノもしくはメトキシであり、R^{5b}はHである、

請求項1~請求項3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ安息香酸；

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチル
スルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2
- イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - カルバモイル - 2 - メ
トキシフェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミ
ノ) - 2 - メトキシ安息香酸 ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - カルバモイル - 2 - メ
トキシフェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミ
ノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2
- イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシ
エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - カルバモイル - 2 - メ
トキシフェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミ
ノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシ) エチル) ベ
ンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2
- イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (1 - オキシドチオモルホリノ) エチル)
ベンズアミド ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - シアノ - 4 - [2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エ
トキシ] エトキシ] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - シアノ - 4 - (2 - モルホリノエトキシ) アニリノ] -
4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - シアノ - 4 - (3 - モルホリノプロボキシ) アニリノ]
- 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - [2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ)
エトキシ] エチルスルフィニル] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル]
尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - [2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ)
エトキシ] エチルスルホニル] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿
素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニ
ル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - [メチル (3 - モルホリノプロピル) ス
ルファモイル] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (1 - メチル - 4 - ピペリジル) エチル] ベンズ
アミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - エチニル - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル

〕アミノ〕 - N - [2 - [2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エトキシ] エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (3 - モルホリノプロピル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - [(2 S , 6 R) - 2 , 6 - ジメチルモルホリン - 4 - イル] エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - (2 , 2 - ジメチルモルホリン - 4 - イル) エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - モルホリノ - 2 - オキソ - エチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (4 - メチル - 1 , 4 - ジアゼパン - 1 - イル) エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 R) - 2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシ] - 1 - メチル - エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 S) - 2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エトキシ] - 1 - メチル - エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] ピリミジン - 2 - イル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (1 - メチル - 4 - ピペリジル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - (3 , 3 - ジメチルモルホリン - 4 - イル) エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - チオモルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - (4 - ヒドロキシ - 1 - ピペリジル) エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - メチル - 2 - モルホリノ - プロピル) ベンズアミド ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - [メチル (2 - モルホリノエチル) スルファモイル] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (1 - ピペリジル) エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - ピロリジン - 1 - イルエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 , 4 - チアジナン - 4 - イル) エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

5 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] ペンタン酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 S) - 1 - メチル - 2 - モルホリノ - エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - ピペラジン - 1 - イルエチル) ベンズアミド ;

3 - [2 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エトキシ] エトキシ] プロパン酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (4 - モルホリノブチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - [4 - (2 - ヒドロキシエチル) ピペラジン - 1 - イル] エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) プロピル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル]

] アミノ] - 2 - メトキシ - N - メチル - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - N - [2 - [2 - ヒドロキシエチル (メチル) アミノ] エチル] - 2 - メト
 キシ - ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - [2 - メトキシエチル (メチル) アミノ] エチル
] - ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - メチル - N - (3 - モルホリノプロピル) ベンズアミド
 ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [3 - (1 - オキソ - 1 , 4 - チアジナン - 4 - イル)
 プロピル] ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - N - [3 - (1 , 1 - ジオキソ - 1 , 4 - チアジナン - 4 - イル) プロピル
] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (1 , 4 - オキサゼパン - 4 - イル) エチル] ベ
 ンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [3 - (1 , 4 - オキサゼパン - 4 - イル) プロピル]
 ベンズアミド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 - メチル - 4 - ピペリジル) メチル] ベンズアミ
 ド ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - N - [2 - (4 , 4 - ジフルオロ - 1 - ピペリジル) エチル] - 2 - メトキ
 シ - ベンズアミド ;
 リン酸二水素 2 - [2 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル -
 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシフェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナ
 フチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシベンゾイル] アミノ] エトキ
 シ] エトキシ] エチル ;
 4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - (ジメチルアミノ) 安息香酸 ;
 4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
 ルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフトレン - 1 - イル) オキシ) ピリミジン -
 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) エ

チル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチル
スルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリミジン -
2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - (3 - モルホリノプロピル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチル
スルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリミジン - 2
- イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - (3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)プロ
ピル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリミジン -
2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)エ
チル)ベンズアミド;

2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 -
(メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジ
ン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)酢酸;

4 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 -
(メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリ
ジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)ブタン酸;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2
- イル)アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (2 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル
)エチル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2
- イル)アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル
)プロピル)ベンズアミド;

(S) - 2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキ
シ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキ
シ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) - 3 - (1 H - イミダ
ゾール - 4 - イル)プロパン酸;

(S) - 1 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキ
シ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキ
シ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンゾイル)ピロリジン - 2 - カルボ
ン酸;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリミジン -
2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ安息香酸;

3 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 -
(メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリ
ジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)プロパン酸;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリミジン -
2 - イル)アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イ
ル)エチル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2
- イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - メチル - N - (2 - (1 - メチルピペリジン - 4
- イル)エチル)ベンゼンスルホンアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2

- イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - メチル - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル) ベンゼンスルホンアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリミジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - (ジメチルアミノ) 安息香酸 ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (5 - (ジメチルアミノ) ペンチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (4 - エチルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (4 - イソプロピルピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (4 - ヒドロキシ - 1 - メチルピペリジン - 4 - イル) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - メチル - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (2 , 2 , 4 - トリメチルピペラジン - 1 - イル) エチル) ベンズアミド ;

(5) - 2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) - 3 - ヒドロキシプロパン酸 ;

N - ((4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリミジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシフェニル) スルホニル) プロピオンアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (1 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) プロパン - 2 - イル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (3 - (t e r t - ブチル) - 5 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ

) - 2 - メトキシ - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (3 - (t e r t - ブチル) - 5 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) プロピル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - (ジメチルアミノ) - N - (2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - ((3 R , 4 R , 5 S , 6 R) - 2 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 3 - イル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (3 - (t e r t - ブチル) - 5 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (1 - メチルピペラジン - 4 - イル) エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - (ジメチルアミノ) - N - (2 - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エトキシ) エチル) ベンズアミド ;

(S) - 2 - アミノ - 6 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) - ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) ヘキサ酸 ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (2 - (2 - ((3 R , 4 S , 5 R , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) オキシ) エトキシ) エトキシ) エチル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - ((2 S , 3 R , 4 R , 5 R) - 2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタヒドロキシヘキシル) ベンズアミド ;

6 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) ヘキサ酸 ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリミジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エトキシ) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (1 - メチルピペラジン - 4 - イル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシ - N - ((1 - メチルピペラジン - 4 - イル) メ

チル)ベンズアミド;

3 - (3 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)プロボキシ)プロパン酸;

リン酸二水素 2 - (2 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)エトキシ)エチル;

4 - ((2 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)エチル)アミノ) - 4 - オキソブタン酸;

3 - (3 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)プロパンアミド)プロパン酸;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - (3 - オキソ - 3 - ((2R, 3R, 4R, 5S) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 2 - (ヒドロキシメチル)ピペリジン - 1 - イル)プロピル)ベンズアミド;

N - (5 - (tert - ブチル) - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((4 - (4 - (2 - (ジメチルアミノ)エチル)ピペラジン - 1 - カルボニル) - 3, 5 - ジメトキシフェニル)アミノ)ピリジン - 4 - イル)オキシ)ナフタレン - 1 - イル)ウレイド) - 2 - メトキシフェニル)メタンスルホンアミド;

N - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - ((3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル)プロピル)スルホニル)フェニル)アミノ)ピリジン - 4 - イル)オキシ)ナフタレン - 1 - イル)ウレイド)フェニル)メタンスルホンアミド;

N - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - ((2R, 3R, 4R, 5S) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシ - 2 - (ヒドロキシメチル)ピペリジン - 1 - カルボニル)フェニル)アミノ)ピリジン - 4 - イル)オキシ)ナフタレン - 1 - イル)ウレイド)フェニル)メタンスルホンアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - N - (2 - (4 - (2 - (ジメチルアミノ)アセチル)ピペラジン - 1 - イル)エチル) - 2 - メトキシベンズアミド;

4 - (4 - (2 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)エチル)ピペラジン - 1 - イル) - 4 - オキソブタン酸;

(S) - 2 - アミノ - 5 - (4 - (2 - (4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) - フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド)エチル)ピペラジン - 1 - イル) - 5 - オキソペンタン酸;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - N - (1, 3 - ジヒドロキシ - 2 - (ヒドロキシメチル)プロパン - 2 - イル) - 2 - メトキシベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (3 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ビス (ヒドロキシメチル) プロピル) - 2 , 6 - ジメトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (((2 S , 3 R , 4 R , 5 S , 6 R) - 3 , 4 , 5 - トリヒドロキシ - 6 - (ヒドロキシメチル) テトラヒドロ - 2 H - ピラン - 2 - イル) メチル) ベンズアミド ;

リン酸二水素 2 - ((5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - ((2 - (1 - オキシドチオモルホリノ) - エチル) カルバモイル) フェニル) アミノ) ピリジン - 4 - イル) オキシ) ナフタレン - 1 - イル) ウレイド) フェニル) アミノ) - 2 - オキシエチル ;

(R) - 4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (1 - メチルピロリジン - 3 - イル) ベンズアミド ;

(R) - 4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (3 - ヒドロキシピロリジン - 1 - イル) エチル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - クロロ - 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - エチル - 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - (ジフルオロメトキシ) 安息香酸 ;

6 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 4 - メトキシ - ピリジン - 3 - カルボン酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - ヒドロキシ - 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - フルオロ - 安息香酸 ;

(2 S) - 2 - アミノ - 3 - [4 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] フェニル] - プロパン酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 R) - 1 - メチル - 2 - モルホリノ - エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - ヒドロキシ - N - (2 - モルホリノエチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - [2 - (2 - メトキシエトキシ) エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - N - [2 - (4 - フルオロ - 1 - ピペリジル) エチル] - 2 - メトキシ - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - キヌクリジン - 4 - イル - ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (キヌクリジン - 4 - イルメチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - (2 - キヌクリジン - 4 - イルエチル) ベンズアミド ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - 3 - [4 - [[2 - (3 - メトキシ - 4 - メチルスルホニル - アニリノ) - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - 3 - [4 - [[2 - (3 - メトキシ - 4 - メチルスルフィニル - アニリノ) - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

1 - [5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - 3 - [4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - (2 - モルホリノエチルスルホニル) アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] 尿素 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [3 - (1 - メチル - 4 - ピペリジル) プロピル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [2 - (4 - ピペリジル) エチル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 , 6 - ジメトキシ - N - (4 - モルホリノブチル) ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 R) - 1 - メチル - 3 - モルホリノ - プロピル] ベンズアミド ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - N - [(1 S) - 1 - メチル - 3 - モルホリノ - プロピル] ベンズアミド ;

リン酸二水素 2 - [5 - t e r t - ブチル - 2 - メトキシ - 3 - [[4 - [[2 - [3 - メトキシ - 4 - [2 - (1 - オキソ - 1 , 4 - チアジナン - 4 - イル) エチルカルバモイル] アニリノ] - 4 - ピリジル] オキシ] - 1 - ナフチル] カルバモイルアミノ] - N - メチルスルホニル - アニリノ] エチル ;

[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジ

ル]アミノ]-2-メトキシ-フェニル]ホスフィン酸；

[4-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2-メトキシ-フェニル]ホスホン酸；

[4-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2,6-ジメトキシ-フェニル]-メチル-ホスフィン酸；

4-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2-メトキシ-ベンゼンスルフィン酸；

4-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2-(トリフルオロメトキシ)安息香酸；

6-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2-メトキシ-ピリジン-3-カルボン酸；

4-[[4-[[4-[[5-tert-ブチル-3-(メタンスルホンアミド)-2-メトキシ-フェニル]カルバモイルアミノ]-1-ナフチル]オキシ]-2-ピリジ
ル]アミノ]-2,6-ジメチル-安息香酸；

N-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(3-(4-(2-(3-メトキシ-4-(3-モルホリノプロピル)スルホニル)フェニル)-アミノ)ピリジ
ン-4-イル)オキシ)ナフタレン-1-イル)ウレイド)フェニル)メタンスルホンア
ミド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-2-(ジメチルアミノ)-N-(2-モルホリノエチル)ベンズアミ
ド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-2,6-ジメトキシ-N-(2-(4-メチルピペラジン-1-イル
)エチル)ベンズアミド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-2,6-ジメトキシ-N-(3-モルホリノプロピル)ベンズアミ
ド；

N-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(3-(4-(2-(3-
メトキシ-4-(2H-テトラゾール-5-イル)フェニル)アミノ)ピリジン-4-イ
ル)オキシ)ナフタレン-1-イル)ウレイド)フェニル)メタンスルホンアミド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-2-メトキシ-N-メチル-N-(3-(4-メチルピペラジン-1
-イル)プロピル)ベンゼンスルホンアミド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-N-(2-(4-シクロプロピルピペラジン-1-イル)エチル)-
2-メトキシベンズアミド；

4-(4-(4-(3-(5-(tert-ブチル)-2-メトキシ-3-(メチ
ルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン-1-イル)オキシ)ピリジン-2
-イル)アミノ)-2-メトキシ-N-(2-(ピペリジン-4-イル)エチル)ベンズ
アミド；

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリミジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンゼンスルホンアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - ヒドロキシ - N - (3 - モルホリノプロピル) ベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (3 - (t e r t - ブチル) - 5 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ安息香酸 ;

N - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - (2 - オキソピリジン - 1 (2 H) - イル) フェニル) アミノ) - ピリジン - 4 - イル) オキシ) ナフタレン - 1 - イル) ウレイド) フェニル) メタンスルホンアミド ;

5 - (t e r t - ブチル) - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - ((2 - (1 - オキシドチオモルホリノ) エチル) カルバモイル) フェニル) アミノ) ピリジン - 4 - イル) オキシ) ナフタレン - 1 - イル) ウレイド) ベンズアミド ;

4 - (2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) エチル) モルホリン 4 - オキシド ;

7 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) ヘブタン酸 ;

リン酸二水素 2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシベンズアミド) エチル ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エトキシ) エチル) - 2 , 6 - ジメトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (4 - (2 - ヒドロキシエチル) ピペラジン - 1 - イル) エチル) - 2 , 6 - ジメトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (3 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ビス (ヒドロキシメチル) プロピル) - 2 - メトキシベンズアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - N - (2 - (ジメチルアミノ) エチル) - 2 , 6 - ジメトキシベンズアミド ;

N - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((4 - ((2 - (2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エトキシ) エチル) スルホニル) - 3 - メトキシフェニル) アミノ) ピリジン - 4 - イル) オキシ) ナフタレン - 1 - イル) ウレイド) - 2 - メトキシフェニル) - メタンスルホンアミド ;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - (2 - ヒドロキシアセトアミド) - 2 - メトキシフェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (1 - オキシドチオモルホリノ) エ

チル)ベンズアミド;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - ((2 S , 3 S , 4 R) - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロキシベンチル)ベンズアミド;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ フェニル) (メチル)ホスフィン酸エチル;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシフェニル) (メチル)ホスフィン酸;

(5 - (t e r t - ブチル) - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((4 - ((3 - ヒドロキシ - 2 , 2 - ビス(ヒドロキシメチル)プロピル)スルホニル) - 3 - メトキシフェニル)アミノ)ピリジン - 4 - イル)オキシ)ナフタレン - 1 - イル)ウレイド) - 2 - メトキシフェニル) - メタンスルホンアミド;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシフェニル]カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル]オキシ] - 2 - ピリジル]アミノ] - 2 , 6 - ジメトキシ安息香酸;

リン酸二水素 2 - (2 - (2 - (4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 , 6 - ジメトキシベンズアミド)エトキシ)エトキシ)エチル;

4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 3 - (N - (2 - ヒドロキシエチル)メチルスルホンアミド) - 2 - メトキシフェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシ - N - (2 - (1 - オキシドチオモルホリノ)エチル)ベンズアミド;

5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (3 - (4 - ((2 - ((3 - メトキシ - 4 - ((2 - (1 - オキシドチオモルホリノ)エチル) - カルバモイル)フェニル)アミノ)ピリジン - 4 - イル)オキシ)ナフタレン - 1 - イル)ウレイド)安息香酸;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシフェニル)ホスホン酸ジエチル;

[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル]カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル]オキシ] - 2 - ピリジル]アミノ] - 2 - メトキシ - フェニル] - エトキシ - ホスフィン酸;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシフェニル) (エチル)ホスフィン酸エチル;

[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル]カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル]オキシ] - 2 - ピリジル]アミノ] - 2 - メトキシ - フェニル] - エチル - ホスフィン酸;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド)フェニル)ウレイド) - ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシフェニル) (フェニル)ホスフィン酸エチル;

[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル]カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル]オキシ] - 2 - ピリジル]アミノ] - 2 - メトキシ - フェニル] - フェニル - ホスフィン酸;

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (t e r t - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (N - メチルメチルスルホンアミド)フェニル) - ウレイド)ナフタレン - 1 - イル)オキシ)ピリジン - 2 - イル)アミノ) - 2 - メトキシフェニル) (メチル)ホスフィン酸エチ

(4 - ((4 - ((4 - (3 - (3 - (t e r t - ブチル) - 5 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシフェニル) (メチル) ホスフィン酸エチル ;

(2 S) - 6 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタン
ルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキ
シ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] - 2 - (ジメチル
アミノ) ヘキサン酸 ;

(2 R) - 2 - アミノ - 5 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t
- ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルア
ミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル
] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 5 - オキソ - ペンタン酸 ;

(2 S) - 2 - アミノ - 4 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t
- ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルア
ミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル
] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 4 - オキソ - ブタン酸 ;

(2 R) - 2 - アミノ - 4 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t
- ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルア
ミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル
] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 4 - オキソ - ブタン酸 ;

5 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 3 - メトキシ - ピリジン - 2 - カルボン酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メチルスルファニル - 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メチルスルフィニル - 安息香酸 ;

4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2
- メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル
] アミノ] - 2 - メチルスルホニル - 安息香酸 ;

2 - [4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド
- 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピ
リジル] アミノ] - 2 - メトキシ - フェニル] 酢酸 ;

2 - [4 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホ
ンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ]
- 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] ブトキシ] 酢酸 ;

2 - [4 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホ
ンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ]
- 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] ブチルアミノ] 酢酸 ;

3 - [3 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホ
ンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ]
- 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] プロピルアミノ] プロ
パン酸 ;

4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチル - 3 - (メタンスルホ
ンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ]
- 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチルアミノ] ブタン
酸 ;

(2 S) - 2 - アミノ - 3 - [4 - [[[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブ
チル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ
] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] ア
ミノ] メチル] - フェニル] プロパン酸 ;

(2 R) - 2 - アミノ - 3 - [4 - [[[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブ
チル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ
] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] ア
ミノ] メチル] - フェニル] プロパン酸 ;

(2 R) - 2 - アミノ - 3 - [4 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - t e r t - ブチ

ル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] フェニル] - プロパン酸 ;

(4S) - 4 - アミノ - 5 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 5 - オキソ - ペンタン酸 ;

(3S) - 3 - アミノ - 4 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 4 - オキソ - ブタン酸 ;

(2S) - 2 - アミノ - 6 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 6 - オキソ - ヘキサン酸 ;

(2R) - 2 - アミノ - 6 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] - カルバモイルアミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 6 - オキソ - ヘキサン酸 ;

(2S) - 5 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイル - アミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (メチルアミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸 ; および

(2S) - 5 - [4 - [2 - [[4 - [[4 - [[4 - [[5 - tert - ブチル - 3 - (メタンスルホンアミド) - 2 - メトキシ - フェニル] カルバモイル - アミノ] - 1 - ナフチル] オキシ] - 2 - ピリジル] アミノ] - 2 - メトキシ - ベンゾイル] アミノ] エチル] ピペラジン - 1 - イル] - 2 - (ジメチルアミノ) - 5 - オキソ - ペンタン酸、を含むリストから選択される、

請求項 1 ~ 請求項 4 のいずれか一項に記載の化合物、その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物または同位体誘導体。

【請求項 6】

但し、前記化合物が、4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ安息香酸、その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物または同位体誘導体でない、請求項 1 ~ 請求項 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

薬学的に許容可能なアジュバント、希釈剤または担体と混合した、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、その薬学的に許容可能な塩、溶媒和物または同位体誘導体を含む医薬製剤。

【請求項 8】

(A) 請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体、および

(B) 別の治療薬、
含んでなる組合せ製剤であって、

成分 (A) および (B) はそれぞれ、薬学的に許容可能なアジュバント、希釈剤または担体と混合して調製されるす、前記組合せ製剤。

【請求項 9】

医薬分野での使用のための請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬

学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体。

【請求項 10】

炎症性疾患の治療または予防に用いる、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体、または請求項 7 に記載の医薬製剤、または請求項 8 に記載の組合せ製剤。

【請求項 11】

前記炎症性疾患が嚢胞性線維症、肺高血圧症、肺サルコイドーシス、特発性肺線維症、COPD（慢性気管支炎および肺気腫を含む）、喘息、小児喘息、アトピー性皮膚炎、アレルギー性皮膚炎、接触性皮膚炎または乾癬、アレルギー性鼻炎、鼻炎、副鼻腔炎、結膜炎、アレルギー性結膜炎、乾性角結膜炎（ドライアイまたは眼球乾燥症）、緑内障、糖尿病性網膜症、黄斑浮腫（糖尿病性黄斑浮腫を含む）、網膜中心静脈閉塞症（CRVO）、萎縮型および/または滲出型加齢黄斑変性（AMD）、白内障術後炎症、ぶどう膜炎（後部、前部および汎ぶどう膜炎を含む）、角膜移植および角膜縁移植片拒絶、グルテン過敏性腸症（セリアック病）、好酸球性食道炎、腸移植片対宿主病、クローン病および潰瘍性大腸炎から成るリストから選択される、請求項 10 に記載の使用のための化合物、製剤または組合せ製剤。

【請求項 12】

前記炎症性疾患が糖尿病性網膜症、黄斑浮腫、ぶどう膜炎、乾性角結膜炎（ドライアイまたは眼球乾燥症）、クローン病または潰瘍性大腸炎である、請求項 10 または請求項 11 に記載の使用のための化合物、製剤または組合せ製剤。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物、もしくはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物もしくは同位体誘導体、または

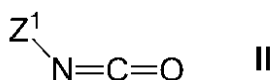
請求項 7 に記載の医薬製剤または請求項 8 に記載の組合せ製剤の効果量を対象に投与することを含む、請求項 10 ~ 12 のいずれか一項に記載の炎症性疾患の治療方法もしくは予防方法。

【請求項 14】

請求項 1 に定義した式 I の化合物の製造方法であって、前記方法が；

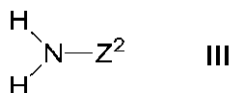
(a) 式 I I の化合物と

【化 5】



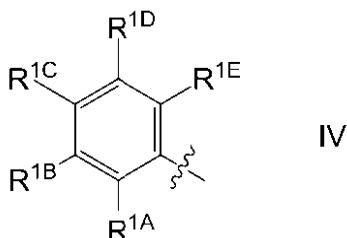
式 I I I の化合物との反応であって、

【化 6】



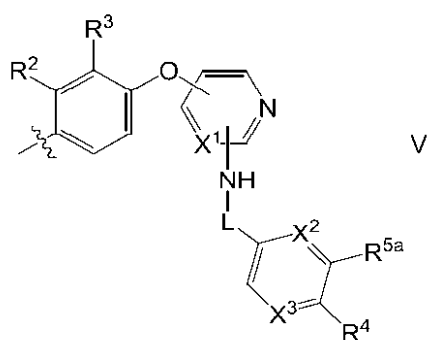
ここで Z^1 および Z^2 のうち 1 つは式 I V の構造フラグメントであり、

【化 7】



Z¹およびZ²のうち他方は式Vの構造フラグメントである

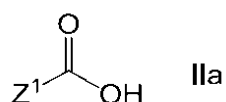
【化8】



(式中、R^{1A} ~ R^{1E}、R² ~ R⁴、R^{5a}、LおよびX¹ ~ X³は、請求項1 ~ 6のいずれか一項に記載の通りである)；

(b) 式IIaの化合物と

【化9】

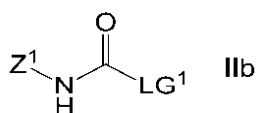


(式中、Z¹は上記定義通りである)

適切なアジド形成剤との反応であって、この反応後、中間体アシルアジド(式Z¹-C(O)-N₃)を分離せずに熱転位反応させることで反応系中で得た式IIの化合物を、次いで、上記式IIIの化合物とを反応させる；

(c) 式IIbの化合物と

【化10】

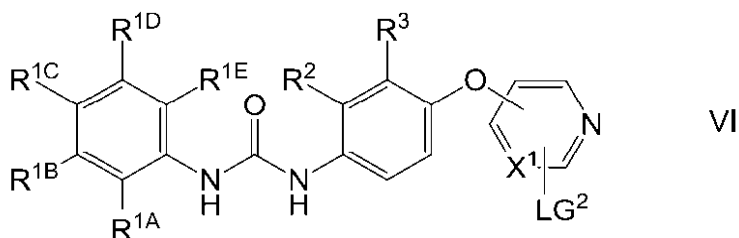


(式中、LG¹は脱離基であり、Z¹は上記定義の通りである)

上記定義の式IIIの化合物との反応；

(d) 式VIの化合物と

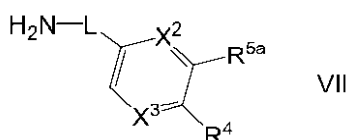
【化11】



(式中、LG²は脱離基であり、R^{1A} ~ R^{1E}、R²、R³およびX¹は請求項1 ~ 6のいずれか一項で定義した通りである)

式VIIの化合物

【化12】



(式中、 R^4 、 R^{5a} 、 L 、 X^2 および X^3 は、請求項1～6のいずれか一項で定義した通りである)

との反応；

(e) R^4 が、

- $S(O)_{1\sim 2} - [C(R^{6c})(R^{6d}) - (CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - Z]_{1\sim 12} - CH_2(CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - R^{6a}$ 、

- $S(O)_{1\sim 2} - C(R^{6c})(R^{6d}) - [C_{1\sim 5}\text{アルキレン}] - R^{6a}$ 、

- $S(O)_{1\sim 2}R^{6b}$ 、

(式中、 $C_{1\sim 5}$ アルキレン基は請求項1に記載の通り置換されていてもよい)

である式Iの化合物のための、

式Iに対応する化合物であって R^4 がそれぞれ、

- $S - [C(R^{6c})(R^{6d}) - (CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - Z]_{1\sim 12} - CH_2(CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - R^{6a}$ 、

- $S - C(R^{6c})(R^{6d}) - [C_{1\sim 5}\text{アルキレン}] - R^{6a}$ 、

- $S - R^{6b}$ 、

(式中、 $C_{1\sim 5}$ アルキレン基は請求項1に記載の通り置換されていてもよく、 $R^{6a} \sim R^{6d}$ は請求項1～6のいずれか一項で定義した通りである)

である化合物の、酸化；

(f) R^4 が、

- $Q^{1a} - NR^8 - [C(R^{6c})(R^{6d}) - (CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - Z]_{1\sim 12} - CH_2(CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - R^{6a}$ 、

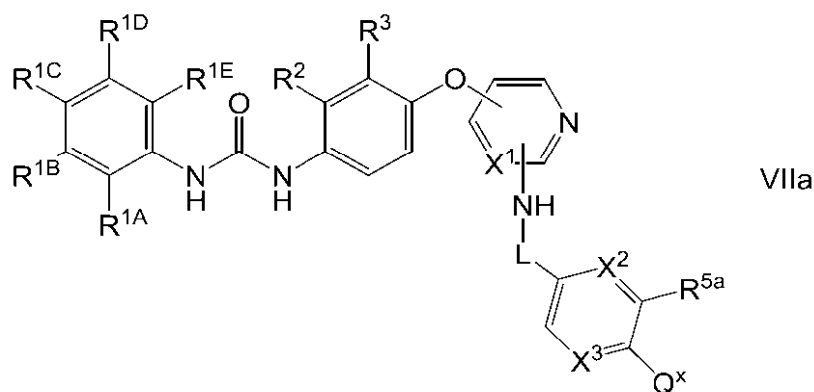
- $Q^{2a}NR^8 - C(R^{6c})(R^{6d}) - [C_{1\sim 5}\text{アルキレン}] - R^{6a}$ または

- $Q^{3a} - NR^8 - [C_{1\sim 4}\text{アルキレン}]_{0\sim 1} - Het^3$ 、

(式中、 $C_{1\sim 5}$ アルキレン基および Het^3 基は請求項1に定義した通り置換されていてもよく、 Q^{1a} 、 Q^{2a} および Q^{3a} は $C(O)$ もしくは $S(O)_2$ である)

である、式Iの化合物のための、式VIIaの化合物と、

【化13】



VIIa

(式中、 Q^x は $-[C_{1\sim 4}\text{アルキレン}]_{0\sim 1} - C(O)OR^{4'}$ もしくは $-S(O)_2 - LG^2$ であり、 $R^{4'}$ はHもしくは $C_{1\sim 4}$ アルキル基であり、 $R^{1A} \sim R^{1E}$ 、 R^2 、 R^3 、 R^{5a} 、 L および $X^1 \sim X^3$ は請求項1～6のいずれか一項で定義した通りであり、 LG^2 は上記の通りである)

式VIIb、VIIcまたはVIIdの化合物との反応

$HNR^8 - [C(R^{6c})(R^{6d}) - (CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - Z]_{1\sim 12} - CH_2(CH_2)_{0\sim 1}CH_2 - R^{6a1}$ VIIb

$HNR^8 - C(R^{6c})(R^{6d}) - [C_{1\sim 5}\text{アルキレン}] - R^{6a1}$ または VIIc

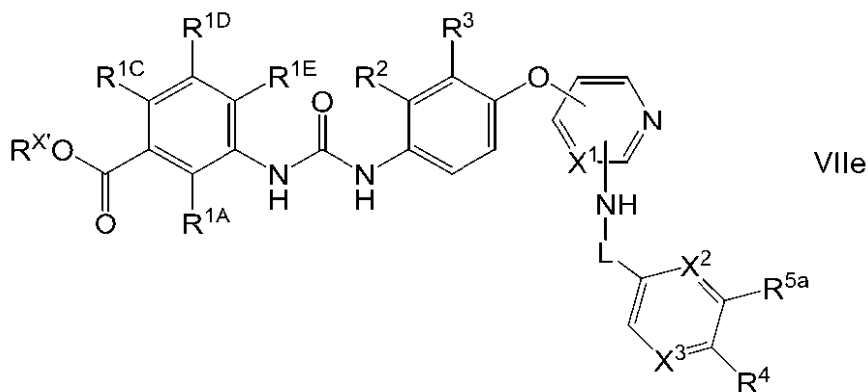
$HNR^8 - [C_{1\sim 4}\text{アルキレン}]_{0\sim 1} - Het^3$ VIId

(式中、 $C_{1\sim 5}$ アルキレン基および Het^3 基は請求項1に記載の通り置換されていてもよく、 R^{6a1} は、 CO_2H が保護された形態で存在すること以外は R^{6a} と同じ定義であり、 R^{6a} 、 R^{6c} 、 R^{6d} 、 R^8 および Het^3 は請求項1～6のいずれか一項で定義した通りであ

る) ;

(g) R^4 が $-S(O)_2-N(R^{7b})R^{7c}$ である式 I の化合物のための、 Q^x が $-S(O)_2-LG^2$ である上記定義の式 VII a の化合物と R^{7b} および R^{7c} が請求項 1 で定義した通りである式 $HN(R^{7b})R^{7c}$ の化合物との反応 ;

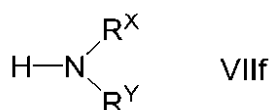
(h) R^1 が $-C(O)NR^XR^Y$ である式 I の化合物のための、式 VII e の化合物
【化 1 4】



(式中、 R^{1A} 、 R^{1C} 、 R^{1D} 、 R^{1E} 、 $R^2 \sim R^4$ 、 R^{5a} 、 L および $X^1 \sim X^3$ は請求項 1 ~ 6 のいずれか一項で定義した通りであり、 R^X は H もしくは $C_1 \sim 4$ アルキルである)

と式 VII f の化合物

【化 1 5】



(式中、 R^X および R^Y は、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項で定義した通りである)
の反応 ;

(i) R^{1A} は、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、または $C_2 \sim 6$ アルキニルであり、これら $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、または $C_2 \sim 6$ アルキニルは $-OP(O)(OH)_2$ で置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される 1 つ以上の置換基でさらに置換されていることもよく、

R^X および / または R^{X1} は、 $-OP(O)(OH)_2$ で置換されている $C_1 \sim 6$ アルキルであり、ハロ、ヒドロキシおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される 1 つ以上の置換基でさらに置換されていることもよく、

R^Y 、 R^{Y1} および / または R^{Y2} は、独立して、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 であり、これら $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 は、 $-OP(O)(OH)_2$ で置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)O-(C_1 \sim 4$ アルキル) および $-N(R^a)(R^b)$ から選択される 1 つ以上の置換基でさらに置換されていることもよく、 Het^2 基は 1 つ以上のオキソ基でさらに置換されていることもよく ;

R^{1D} は、 $C_2 \sim 7$ アルキル、 $C_2 \sim 7$ アルケニル、 $C_2 \sim 7$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 または Het^2 であり、これら $C_2 \sim 7$ アルキル、 $C_2 \sim 7$ アルケニル、 $C_2 \sim 7$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 または Het^2 は $-OP(O)(OH)_2$ で置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される 1 つ以上の置換基でさらに置換されていることもよく ;

R^4 は、 $-CH_2OP(O)(OH)_2$ であり、

R^{6b} は、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 もしくは Het^2 であり、これら $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 もしくは H

$e t^2$ は、 $-OP(O)(OH)_2$ で置換されており、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $-C_1 \sim 3$ アルキレン- R^{6e} および CO_2H から選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよく；

R^{6e} は、 $-OP(O)(OH)_2$ であるか、または

R^{7a} は、 $P(O)(OH)_2$ である、

式Iの化合物のための、

それぞれ式Iのに対応する化合物であって、

R^{1A} は、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニルであり、これら $C_1 \sim 6$ アルコキシ、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_2 \sim 6$ アルケニル、 $C_2 \sim 6$ アルキニルはヒドロキシで置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、および $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよく、

R^X および/または R^{X1} は、ヒドロキシで置換されており、ハロ、ヒドロキシおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^Y 、 R^{Y1} および/または R^{Y2} は、独立して、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 であり、これら $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 Het^1 または Het^2 は、ヒドロキシで置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 2$ アルコキシ、 $C(O)OH$ 、 $C(O)O-(C_1 \sim 4$ アルキル)および $-N(R^a)(R^b)$ から選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよく、 Het^2 基は1つ以上のオキソ基でさらに置換されていてもよく；

R^{1D} は、 $C_2 \sim 7$ アルキル、 $C_2 \sim 7$ アルケニル、 $C_2 \sim 7$ アルキニル、 $C_3 \sim 7$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 または Het^2 であり、これらはヒドロキシで置換されており、 $C_1 \sim 2$ アルキル、ハロ、シアノ、ヒドロキシおよび $C_1 \sim 2$ アルコキシから選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよく；

R^4 は、 $-CH_2OH$ であり、

R^{6b} は、 $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 もしくは Het^2 であり、これら $C_1 \sim 8$ アルキル、 $C_3 \sim 8$ シクロアルキル、フェニル、 Het^1 もしくは Het^2 は、ヒドロキシで置換されており、ハロ、ヒドロキシ、 $C_1 \sim 3$ アルキル、 $C_1 \sim 3$ アルコキシ、 $-C_1 \sim 3$ アルキレン- R^{6e} および CO_2H から選択される1つ以上の置換基でさらに置換されていてもよく；

R^{6e} は、ヒドロキシであり、または

R^{7a} は、Hである、

前記化合物上のヒドロキシ基と、ジ-tert-ブチルもしくはジベンジル-ジ($C_1 \sim 4$ アルキル)ホスホラミダイトとを反応であって、次いで、酸化剤と反応させ、tert-ブチルもしくはベンジル保護基を除去する；または

(j) O原子もしくはN原子上に保護基を有する、式Iの化合物の保護誘導体の脱保護反応、

を含む、前記方法。

【請求項15】

(a) Z^2 が請求項14で定義された式Vの構造フラグメントである、請求項14に記載の前記式IIIの化合物、もしくは請求項14に記載の前記式IIIの化合物の塩もしくは保護誘導体；

(式中、 R^{5a} および R^{5b} のうち1つは、独立して、ハロ、メチル、エチル、 $-N(CH_3)_2$ 、ヒドロキシ、ジフルオロメトキシまたはトリフルオロメトキシであり、 R^{5a} および R^{5b} のうち他方は、独立して、H、メチルまたはメトキシであり、

前記保護誘導体は、

(i) 式IIIの NH_2 基のH原子が以下のものに置換されている化合物が挙げられる：

$R'-C(O)-(R'$ はH、 $C_1 \sim 8$ アルキル、フェニルまたはベンジルであり、これらフェニルまたはベンジルは必要に応じてハロ、ヒドロキシ、メチルおよびメトキシから選

択される 1 つ以上の基で置換されていてもよい)、または

$R'' - C(O) - (R'' \text{ は } tert\text{-ブチル、フェニル、ベンジルまたはフルオレニルであり、これらフェニル、ベンジルまたはフルオレニルは必要に応じてハロ、ヒドロキシ、メチルおよびメトキシから選択される 1 つ以上の基で置換されていてもよい}) ; \text{および}$
/ または

(ii) R^4 が $-CO_2H$ である式 III の化合物において、 $-CO_2H$ 部分が $C_1 \sim 8$ アルキルエステルとして保護されている ;)

または

(b) Q^x が $-[C_1 \sim 4 \text{ アルキレン}]_0 \sim 1 - C(O)O - C_1 \sim 4 \text{ アルキル}$ 、またである、請求項 14 に記載の式 VII a の化合物、もしくは請求項 14 に記載の前記式 VII a の化合物の塩 ; である化合物。

【請求項 16】

化合物が、4 - ((4 - ((4 - (3 - (5 - (tert - ブチル) - 2 - メトキシ - 3 - (メチルスルホンアミド) フェニル) ウレイド) ナフタレン - 1 - イル) オキシ) ピリジン - 2 - イル) アミノ) - 2 - メトキシ安息香酸メチルである、請求項 15 に記載の式 VII a の化合物、もしくはその塩。