

【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29年4月13日 (2017.4.13)

【公表番号】特表2016-512193(P2016-512193A)

【公表日】平成28年4月25日 (2016.4.25)

【年通号数】公開・登録公報2016-025

【出願番号】特願2015-561536(P2015-561536)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 K	31/198	(2006.01)
A 6 1 K	31/4406	(2006.01)
A 6 1 K	31/405	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/4166	(2006.01)
A 6 1 K	31/4035	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	31/4725	(2006.01)
A 6 1 K	31/192	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
A 6 1 K	31/195	(2006.01)
A 6 1 K	31/17	(2006.01)
A 6 1 K	31/341	(2006.01)
A 6 1 K	31/381	(2006.01)
A 6 1 K	31/41	(2006.01)
A 6 1 K	31/42	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 K	31/198	
A 6 1 K	31/4406	
A 6 1 K	31/405	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 K	31/4166	
A 6 1 K	31/4035	
A 6 1 K	31/55	
A 6 1 K	31/4725	
A 6 1 K	31/192	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 K	31/195	
A 6 1 K	31/17	

A 6 1 K 31/341  
 A 6 1 K 31/381  
 A 6 1 K 31/41  
 A 6 1 K 31/42

## 【手続補正書】

【提出日】平成29年3月6日(2017.3.6)

## 【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

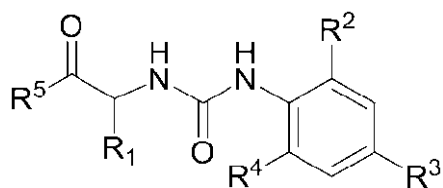
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

眼炎症性疾患を治療するための医薬組成物であって、式 I によって表される化合物又はその製薬的に許容される塩：



式 I

上式において、

$R^1$ は、*sec*-ブチル、 $C_{6-10}$ アリール、 $-CH_2-(C_{6-10})$ アリール、 $-CH_2-$ 複素環、 $C_{4-8}$ シクロアルキルまたは $C_{3-8}$ シクロアルケニルまたは複素環であり；

$R^2$ は、ハロゲンまたはメチルであり；

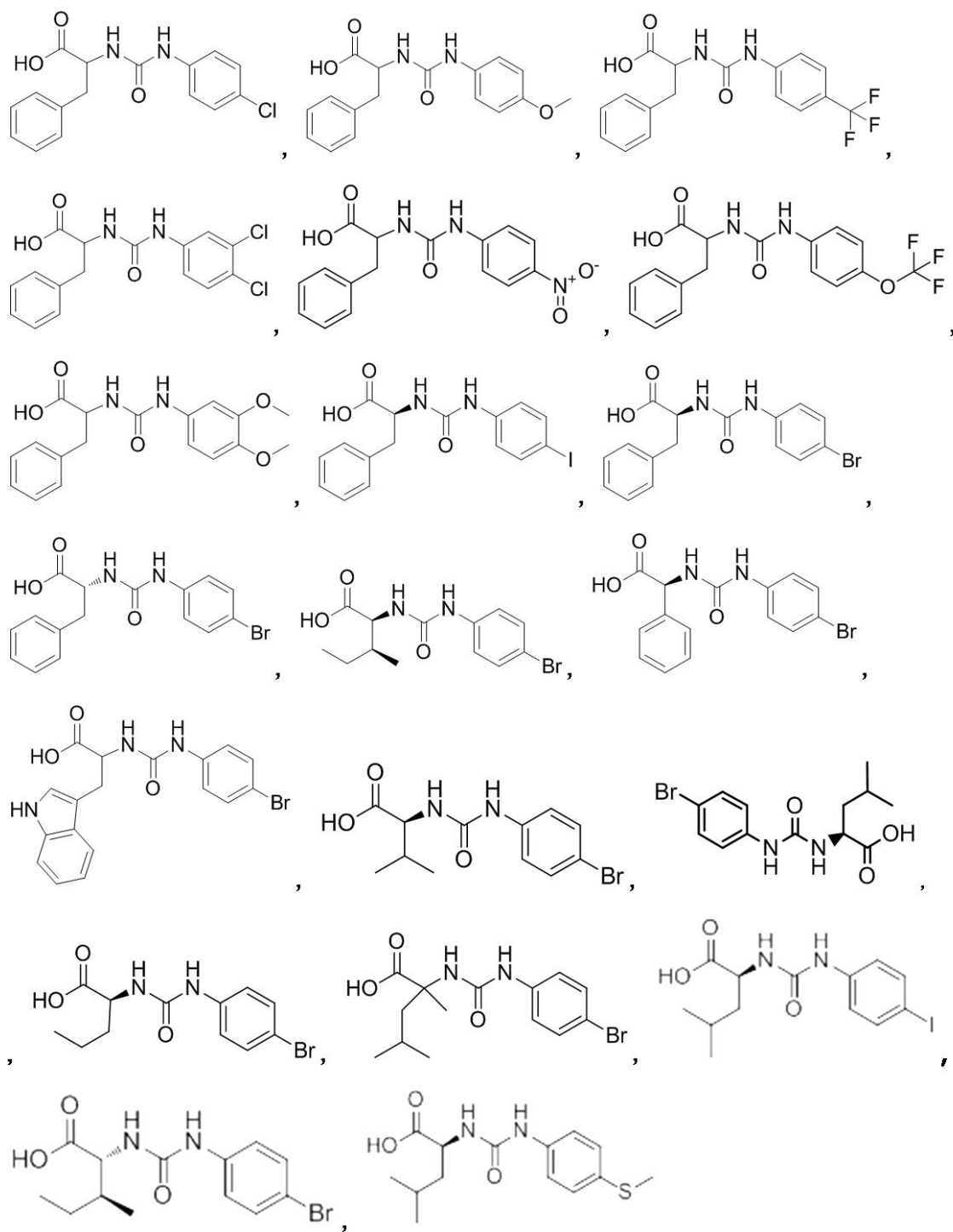
$R^3$ は、ハロゲンであり；

$R^4$ は、H、メチルまたはハロゲンであり；

$R^5$ は、 $OR^6$ または $NH_2$ であり；および、

$R^6$ は、Hまたは $C_{2-4}$ アルキルである、

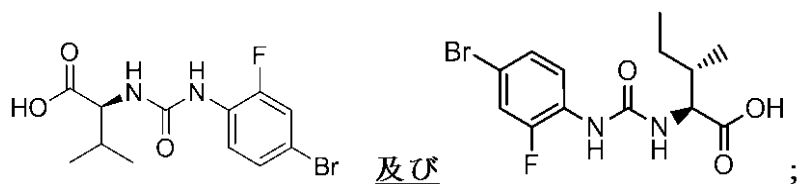
或いは、下記からなる群から選択される化合物又はその製薬的に許容される塩：



を含む、前記医薬組成物。

【請求項 2】

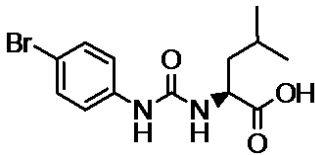
式 I の化合物は：



から選択される、請求項 1 記載の医薬組成物。

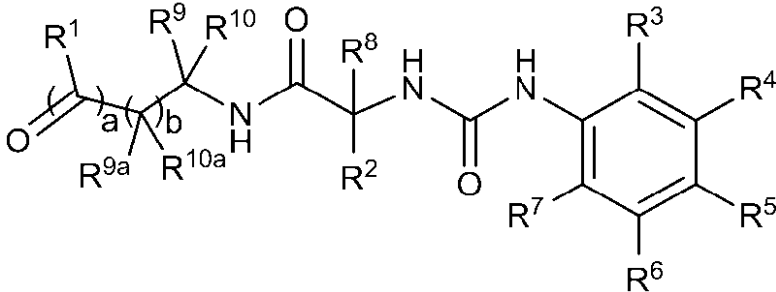
【請求項 3】

前記化合物は、下記化合物である、請求項 1 記載の医薬組成物。



## 【請求項 4】

式 I I によって表される化合物又はその製薬的に許容される塩を含む、眼炎症性疾患を治療するための医薬組成物：



式 I I

上式において、

a は 1 であり、b は 0 であり；又は

a は 0 であり、b は 1 であり；又は

a は 1 であり、b は 1 であり；

$R^1$  は、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキル、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリール、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルケニル、 $-N R^{11} R^{12}$  または  $-O R^{13}$  であり；

$R^2$  は、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリールであり；

$R^3$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキル、ハロゲン、 $-C O O R^{15}$ 、 $-O R^{13}$ 、 $-N R^{11} R^{12}$ 、 $N O_2$ 、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリールまたは置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルケニルであり；

$R^4$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキル、ハロゲン、 $-C O O R^{15}$ 、 $-O R^{13}$ 、 $-N R^{11} R^{12}$ 、 $N O_2$ 、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリールまたは置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルケニルであり；

$R^5$  は、ハロゲン、 $-C F_3$  または  $-S(O)_n R^{14}$  であり；

n は、0、1 または 2 であり；

$R^6$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキル、ハロゲン、 $-C O O R^{15}$ 、 $-O R^{13}$ 、 $-N R^{11} R^{12}$ 、 $N O_2$ 、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリール、または置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルケニルであり；

$R^7$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキル、ハロゲン、 $-C O O R^{15}$ 、 $-O R^{13}$ 、 $-N R^{11} R^{12}$ 、 $N O_2$ 、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルキル、置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリール、または置換されていてもよい  $C_{3-8}$  シクロアルケニルであり；

$R^8$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリールであり；

$R^9$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-10}$  アリールであり；

$R^{10}$  は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-10}$

アリールであり；

$R^{9a}$ は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-1}$

アリールであり；

$R^{10a}$ は、水素、置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルまたは置換されていてもよい  $C_{6-}$

アリールであり；

$R^{11}$ は、水素または置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルであり；

$R^{12}$ は、水素または置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルであり；

$R^{13}$ は、水素または置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルであり；

$R^{14}$ は、水素、 $CF_3$ または置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルであり；および、

$R^{15}$ は、水素または置換されていてもよい  $C_{1-8}$  アルキルである。

# 【請求項 5】

前記化合物は：

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } ペンタノイル] アミノ } 酢酸；

{ [(2S, 3S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチルペンタノイル] アミノ } 酢酸；

(2S, 3S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチルペンタン酸；

2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 4 - メチルペンタノイル] アミノ } - 2 - メチルプロパン酸；

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - 4 - メチルペンタノイル] アミノ } 酢酸；

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 4 - メチルペンタノイル] アミノ } 酢酸；

2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - N - (2 - オキソアゼパン - 3 - イル) - 3 - フェニルプロパンアミド；

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - フェニルプロパノイル] アミノ } 酢酸；

3 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - フェニルプロパノイル] アミノ } プロパン酸；

(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 3 - フェニルプロパンアミド；

{ [(2S, 3S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチルペンタノイル] アミノ } 酢酸；

(2S, 3S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチルペンタンアミド；

(2S, 3S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチルペンタンアミド；

(2S, 3S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - メチル - N - (2 - オキソプロピル) ペンタンアミド；

(2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - N - (2 - オキソプロピル) - 3 - フェニルプロパンアミド；

(2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 3 - フェニルプロパンアミド；

メチル { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } ペンタノイル] アミノ } アセタート；

プロパン - 2 - イル { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ } ペンタノイル] アミノ } アセタート；

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } ペンタノイル] アミノ } 酢酸；

(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - (2 - ヒドロキシエチル) - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキシエチル) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチル - N - (2 - オキシプロピル)ペンタンアミド;  
 (2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキシエチル) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ}ペンタンアミド;  
 (2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキシエチル) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル)カルバモイル]アミノ}ペンタンアミド;  
 (2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキシエチル) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチル - N - (2 - オキシプロピル)ペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ}プロパン酸;  
 (2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ}プロパン酸;  
 (2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ} - 3 - メチルブタン酸;  
 (2S) - N - [(2S) - 1 - アミノ - 3 - メチル - 1 - オキシブタン - 2 - イル] - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - (2 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - (1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - (2, 3 - ジヒドロキシプロピル) - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - [(2R) - 1 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル] - 4 - メチルペンタンアミド;  
 tert - ブチル(2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ}ペンタノアート;  
 (2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ}ペンタン酸;  
 (2S) - N - [(2S) - 1 - アミノ - 1 - オキシペンタン - 2 - イル] - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチルペンタノイル]アミノ} (フェニル)エタン酸;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 4 - メチル - N - (1H - テトラゾール - 5 - イルメチル)ペンタンアミド;  
 [(2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 2, 4 - ジメチルペンタノイル)アミノ]酢酸;  
 [(2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - 2 - エチルブタノイル)アミノ]酢酸;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - [(3 - ヒドロキシ - 1, 2 - オキサゾール - 5 - イル)メチル] - 4 - メチルペンタンアミド;  
 (2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル)カルバモイル]アミノ} - N - [2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキシエチル] - 4 - メチルペンタンアミド;  
 { [(2S) - 4 - メチル - 2 - ( { [4 - (トリフルオロメチル)フェニル]カルバモイル}アミノ)ペンタノイル]アミノ}酢酸;

{ [(2S) - 4 - メチル - 2 - ( { [ 4 - (メチルスルファニル) フェニル] カルバモイル } アミノ ) ペンタノイル ] アミノ } 酢酸 ;

(2S) - 4 - メチル - N - ( 1H - テトラゾール - 5 - イルメチル ) - 2 - ( { [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル } アミノ ) ペンタンアミド ;

2 - メチル - 2 - { [(2S) - 4 - メチル - 2 - ( { [ 4 - (トリフルオロメチル) フェニル] カルバモイル } アミノ ) ペンタノイル ] アミノ } プロパン酸 ;

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル ] アミノ } - 4 - (メチルスルファニル) ブタノイル ] アミノ } 酢酸 ;

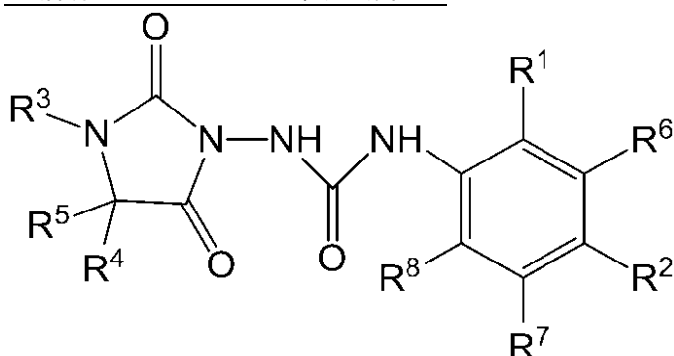
{ [ 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル ] アミノ } - 3 - ( 1H - インドール - 3 - イル ) プロパノイル ] アミノ } 酢酸 ;

tert - ブチル { [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル ] アミノ } - 4 - メチルペンタノイル ] (メチル) アミノ } アセタート ; および

{ [(2S) - 2 - { [(4 - ブロモフェニル) カルバモイル ] アミノ } - 4 - メチルペンタノイル ] (メチル) アミノ } 酢酸から選択される、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】

式IIIによって表される化合物又はその製薬的に許容される塩を含む、眼炎症性疾患を治療するための医薬組成物 :



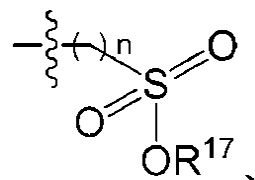
式III

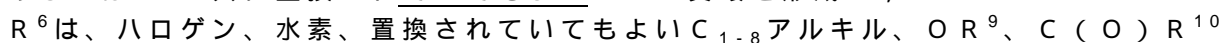
R<sup>1</sup>は、ハロゲン、水素、置換されていてもよいC<sub>1-8</sub>アルキル、OR<sup>9</sup>、C(O)R<sup>10</sup>、NO<sub>2</sub>、NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>、CN、SR<sup>15</sup>またはSO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>であり ;

R<sup>2</sup>は、ハロゲン、置換されていてもよいC<sub>1-8</sub>アルキル、CF<sub>3</sub>、OR<sup>9</sup>、C(O)R<sup>10</sup>、NO<sub>2</sub>、NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup>、CN、SR<sup>15</sup>またはSO<sub>2</sub>R<sup>16</sup>であり ;

R<sup>3</sup>は、水素、置換されていてもよいC<sub>1-8</sub>アルキル、置換されていてもよいC<sub>3-8</sub>シクロアルキル、置換されていてもよいC<sub>3-8</sub>シクロアルケニル、置換されていてもよいC<sub>6-10</sub>アリール、置換されていてもよい複素環、あるいはR<sup>5</sup>と共に置換されていてもよい10または11員の多環式環を形成し ;

R<sup>4</sup>は、水素、置換されていてもよいC<sub>1-8</sub>アルキル、







- 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{SR}^{15}$ または $\text{SO}_2\text{R}^{16}$ であり；  
 $\text{R}^7$ は、ハロゲン、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキル、 $\text{OR}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$
- 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{SR}^{15}$ または $\text{SO}_2\text{R}^{16}$ であり；  
 $\text{R}^8$ は、ハロゲン、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキル、 $\text{OR}^9$ 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$
- 、 $\text{NO}_2$ 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 $\text{CN}$ 、 $\text{SR}^{15}$ または $\text{SO}_2\text{R}^{16}$ であり；  
 $\text{R}^9$ は、水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{10}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキル、 $\text{O}(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ 、 $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ または $\text{OH}$ であり；  
 $\text{R}^{11}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{12}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{13}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{14}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキル、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ 、または $\text{SO}_2(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ であり；  
 $\text{R}^{15}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキル、または $\text{O}(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ であり；  
 $\text{R}^{16}$ は、 $\text{OH}$ 、 $\text{O}(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ 、 $(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ または $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ であり；  
 $\text{R}^{17}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{18}$ は、水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ 、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{19}$ は、水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}\text{アルキル})$ 、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{20}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $\text{R}^{21}$ は、水素、置換されていてもよい $\text{C}_{6-10}$ アリール、または置換されていてもよい $\text{C}_{1-8}$ アルキルであり；  
 $n$ は、1、2、3、4または5であり；  
 $m$ は、1、2、3、4または5である。

【請求項7】

前記化合物は：

- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - [4 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (2 - フェニルエチル)イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - [4 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル)イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - (4, 4 - ジエチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) 尿素；
- 1 - (4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - (4, 4 - ジエチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) 尿素；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - (2, 4 - ジオキソ - 1, 3 - ジアザスピロ[4.5]デカ-3-イル) 尿素；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - [4 - メチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (2 - フェニルエチル)イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素；
- 1 - (4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - [4 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル)イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素；
- 1 - (4 - プロモフェニル) - 3 - [2, 5 - ジオキソ - 4, 4 - ジ(プロパン - 2 - イル)イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素；

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - (4, 4 - ジシクロプロピル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル) 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - [4 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル) イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素;

1 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - [4 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (2 - フェニルエチル) イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (フラン - 2 - イル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (4 - フルオロフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (3 - フルオロフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - メチル - 2, 5 - ジオキソ - 4 - [2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル] イミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - {4 - [2 - (4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - メチル - 4 - [2 - (5 - メチルフラン - 2 - イル) エチル] - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - {4 - [2 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (3 - フルオロ - 4 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - {4 - [2 - (2 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) - 3 - {4 - [2 - (3 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (3 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - {4 - [2 - (2 - ヒドロキシフェニル) エチル] - 4 - メチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル} 尿素;

1 - (4 - ブロモフェニル) - 3 - [4 - (ヒドロキシメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル) イミダゾリジン - 1 - イル] 尿素;

2 - [1 - {[(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル) イミダゾリジン - 4 - イル] - N - (2 - ヒドロキシエチル) アセトアミド;

メチル 2 - [2 - (1 - {[(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - エチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 4 - イル) エチル] ベンゾアート;

2 - [1 - {[(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル) イミダゾリジン - 4 - イル] - N - (1, 3 - ジヒドロキシプロパン - 2 - イル) アセトアミド;

2 - [2 - (1 - {[(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - エチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 4 - イル) エチル] 安息香酸;

2 - [2 - (1 - {[(4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - エチル - 2, 5 - ジオキソイミダゾリジン - 4 - イル) エチル] 安息香酸;

3 - ({[1 - {[(4 - ブロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 2, 5 - ジオキソ - 4 - (プロパン - 2 - イル) イミダゾリジン - 4 - イル] アセチル} アミノ) プロパン酸;

2 - [ 1 - { [ ( 4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル ) カルバモイル ] アミノ } - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( プロパン - 2 - イル ) イミダゾリジン - 4 - イル ] - N - ( 2 - ヒドロキシエチル ) アセトアミド ;

2 - { 2 - [ 1 - { [ ( 4 - ブロモフェニル ) カルバモイル ] アミノ } - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( プロパン - 2 - イル ) イミダゾリジン - 4 - イル ] エチル } 安息香酸 ;

ジエチル [ 2 - ( { [ 1 - { [ ( 4 - ブロモフェニル ) カルバモイル ] アミノ } - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( プロパン - 2 - イル ) イミダゾリジン - 4 - イル ] アセチル } アミノ ) エチル ] ホスホナート ;

エチル 3 - { [ ( 4 - ブロモフェニル ) カルバモイル ] アミノ } - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカン - 8 - カルボキシラート ;

1 - ( 4 - ブロモフェニル ) - 3 - { 4 - [ 2 - ( 2 - フルオロフェニル ) エチル ] - 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル } 尿素 ; および

3 - ( { [ 1 - { [ ( 4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル ) カルバモイル ] アミノ } - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( プロパン - 2 - イル ) イミダゾリジン - 4 - イル ] アセチル } アミノ ) プロパン酸から選択される、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

下記から選択される化合物又はその製薬的に許容される塩を含む、眼炎症性疾患を治療するための医薬組成物：

2 - ( { [ ( 4 - クロロフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - メトキシフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

( 2 S ) - 3 - フェニル - 2 - [ ( { [ 4 - ( トリフルオロメチル ) フェニル ] アミノ } カルボニル ) アミノ ] プロパン酸 ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 3 , 4 - ジクロロフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - ニトロフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

3 - フェニル - 2 - [ ( { [ 4 - ( トリフルオロメトキシ ) フェニル ] アミノ } カルボニル ) アミノ ] プロパン酸 ;

2 - ( { [ ( 3 , 4 - ジメトキシフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

メチル 2 - ( { [ ( 4 - ヨードフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパノアート ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

( 2 R ) - 2 - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸 ;

3 - フェニル - 2 - { [ ( ピリジン - 3 - イルアミノ ) カルボニル ] アミノ } プロパン酸 ;

( 2 S , 3 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - メチルペンタン酸 ;

( 2 S ) - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) ( フェニル ) 酢酸 ;

2 - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - ( 1 H - インドール - 3 - イル ) プロパン酸 ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - ブロモフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - メチルブタン酸 ;

( 2 S ) - 2 - ( { [ ( 4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニル ) アミノ ] カルボニル } アミノ ) - 3 - メチルブタン酸 ;

1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 , 5 ] デカン - 3 - イル ) 尿素 ;  
 1 - ( 4 - クロロフェニル ) - 3 - ( 4 - エチル - 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) 尿素 ;  
 1 - [ 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( 2 - フェニルエチル ) イミダゾリジン - 1 - イル ] - 3 - フェニル尿素 ;  
 1 - ( 8 - メチル - 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 , 5 ] デカン - 3 - イル ) - 3 - ( p - トリル ) 尿素 ;  
 1 - ( 2 - フルオロフェニル ) - 3 - [ 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( 2 - フェニルエチル ) イミダゾリジン - 1 - イル ] 尿素 ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 4 , 4 - ジメチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 4 , 4 - ジエチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 . 5 ] デカ - 3 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 2 , 5 - ジオキソ - 4 , 4 - ジブロピルイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 4 - エチル - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - フェニルイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 4 - シクロプロピル - 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 . 4 ] ノナ - 3 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 4 - エチル - 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( 4 , 4 - ジエチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) アセトアミド ;  
 2 - ( 4 , 4 - ジエチル - 2 , 5 - ジオキソイミダゾリジン - 1 - イル ) - N - ( 4 - フルオロフェニル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - [ 4 - メチル - 2 , 5 - ジオキソ - 4 - ( 2 - フェニルエチル ) イミダゾリジン - 1 - イル ] アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 - ジオキソ - 1 , 3 - ジアザスピロ [ 4 . 6 ] ウンデカ - 3 - イル ) アセトアミド ;  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 1 , 3 , 3 a , 4 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 , 3 - ジオキソ - 4 , 7 - メタノ - 2 H - イソインドール - 2 - アセトアミド ; および  
 N - ( 4 - プロモフェニル ) - 1 , 3 , 3 a , 4 , 7 , 7 a - ヘキサヒドロ - 1 , 3 - ジオキソ - 2 H - イソインドール - 2 - アセトアミド。

【請求項 9】

前記眼炎症性疾患は、ブドウ膜炎、ドライアイ、角膜炎、アレルギー性眼疾患、感染性角膜炎、疱疹性角膜炎、角膜脈管形成、リンパ脈管新生、網膜炎、脈絡膜炎、急性多発性小斑状色素上皮症、ベーチェット病、術後角膜創傷治癒、萎縮型と滲出型加齢性黄斑変性症 ( A R M D ) から選択される、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。