

【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

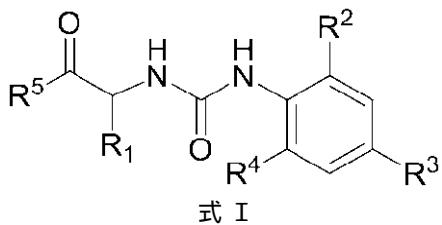
【補正方法】変更

【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：



上式において、

R¹は、sec-ブチル、C₆₋₁₀アリール、-CH₂- (C₆₋₁₀)アリール、-CH₂-複素環、C₄₋₈シクロアルキルまたはC₃₋₈シクロアルケニルまたは複素環であり；

R²は、ハロゲンまたはメチルであり；

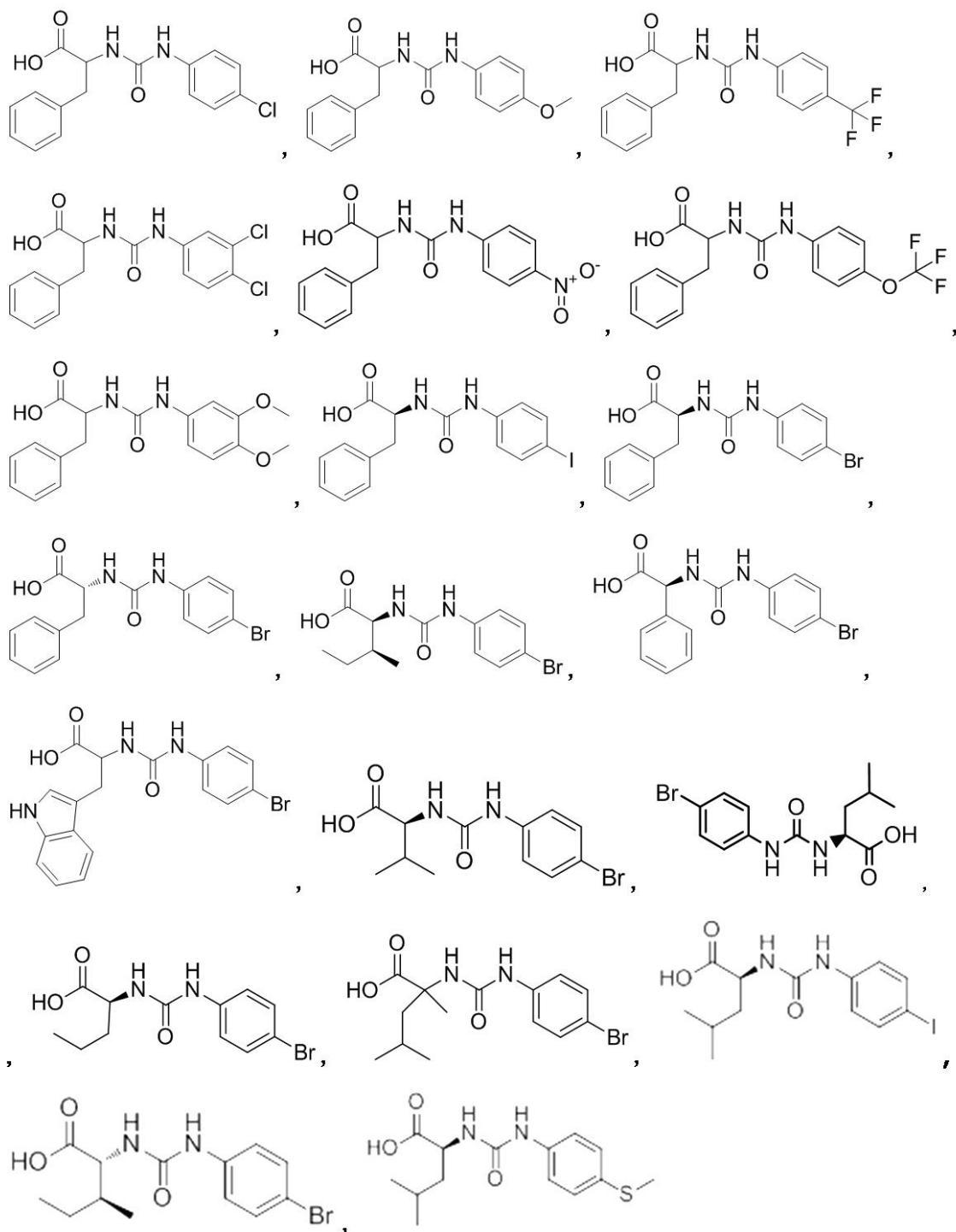
R³は、ハロゲンであり；

R⁴は、H、メチルまたはハロゲンであり；

R⁵は、OR⁶またはNH₂であり；および、

R⁶は、HまたはC₂₋₄アルキルである。

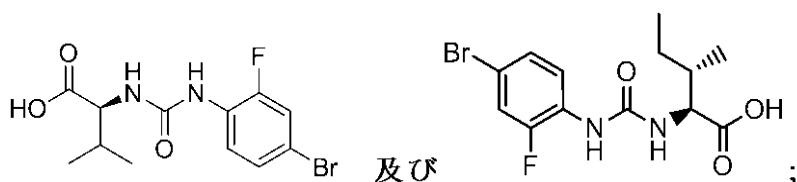
或いは、下記からなる群から選択される化合物又はその製薬的に許容される塩：



を含む、前記医薬組成物。

【請求項2】

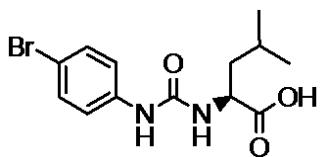
式 I の化合物は：



から選択される、請求項 1 記載の医薬組成物。

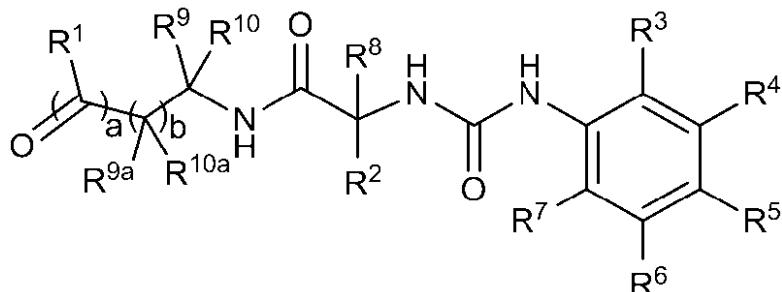
【請求項 3】

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；

R¹ は、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキル、置換されていてもよい C₃₋₈ 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 C₃₋₈ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリール、置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルケニル、-N R¹¹ R¹² または -O R¹³ であり；

R² は、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキルまたは置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールであり；

R³ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキル、ハロゲン、-COOR¹⁵、-OR¹³、-N R¹¹ R¹²、NO₂、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールまたは置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルケニルであり；

R⁴ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキル、ハロゲン、-COOR¹⁵、-OR¹³、-N R¹¹ R¹²、NO₂、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールまたは置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルケニルであり；

R⁵ は、ハロゲン、-CF₃ または -S(O)_nR¹⁴ であり；

n は、0、1 または 2 であり；

R⁶ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキル、ハロゲン、-COOR¹⁵、-OR¹³、-N R¹¹ R¹²、NO₂、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリール、または置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルケニルであり；

R⁷ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキル、ハロゲン、-COOR¹⁵、-OR¹³、-N R¹¹ R¹²、NO₂、置換されていてもよい複素環、置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルキル、置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリール、または置換されていてもよい C₃₋₈ シクロアルケニルであり；

R⁸ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキルまたは置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールであり；

R⁹ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキルまたは置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールであり；

R¹⁰ は、水素、置換されていてもよい C₁₋₈ アルキルまたは置換されていてもよい C₆₋₁₀ アリールであり；

₀アリールであり；

_{R^{9a}}は、水素、置換されていてもよいC₁₋₈アルキルまたは置換されていてもよいC₆₋₁

₀アリールであり；

_{R^{10a}}は、水素、置換されていてもよいC₁₋₈アルキルまたは置換されていてもよいC₆₋₁

₁₀アリールであり；

_{R¹¹}は、水素または置換されていてもよいC₁₋₈アルキルであり；

_{R¹²}は、水素または置換されていてもよいC₁₋₈アルキルであり；

_{R¹³}は、水素または置換されていてもよいC₁₋₈アルキルであり；

_{R¹⁴}は、水素、C F₃または置換されていてもよいC₁₋₈アルキルであり；および、

_{R¹⁵}は、水素または置換されていてもよいC₁₋₈アルキルである。

【請求項 5】

前記化合物は：

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

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

(2 S , 3 S) - 2 - { [(4 - プロモ - 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 - { [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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；

{ [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモ - 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；

{ [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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；

{ [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - { [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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；

(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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；

{ [(2 S , 3 S) - 2 - { [(4 - プロモ - 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；

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

(2 S , 3 S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - プロモ - 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；

(2 S , 3 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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；

(2 S) - 2 - { [(4 - プロモ - 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；

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

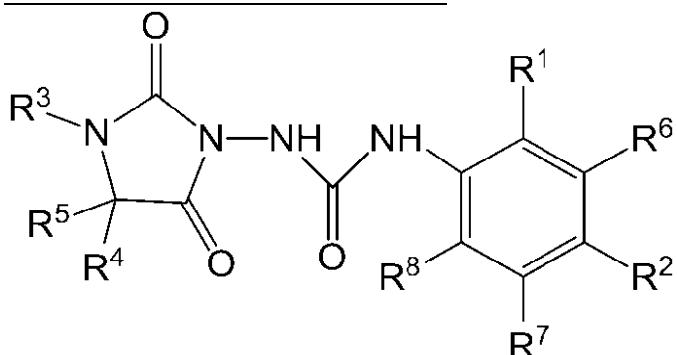
{ [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ } ペンタノイル] アミノ } 酢酸；

(2S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド；
(2S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - メチル - N - (2 - オキソプロピル) ペンタンアミド；
(2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} ペンタンアミド；
(2S) - N - (2 - アミノ - 2 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - プロモ - 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 - オキソエチル) - 2 - { [(4 - プロモ - 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 - プロモ - 2 - フルオロフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - メチル - N - (2 - オキソプロピル) ペンタンアミド；
(2S) - 2 - { [(2S) - 2 - { [(4 - プロモ - 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - オキソブタン - 2 - イル] - 2 - { [(4 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド；
(2S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - オキソペンタン - 2 - イル] - 2 - { [(4 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - 4 - メチルペンタンアミド；
(2S) - { [(2S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ} - N - [2 - (ジメチルアミノ) - 2 - オキソエチル] - 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；

{ [(2 S) - 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 ;
 (2 S) - 4 - メチル - N - (1 H - 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 - { [(2 S) - 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 ;
 { [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) カルバモイル] アミノ } - 3 - (1 H - インドール - 3 - イル) プロパノイル] アミノ } 酢酸 ;
 t e r t - ブチル { [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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
 { [(2 S) - 2 - { [(4 - プロモフェニル) 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 I 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：



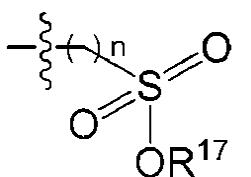
式 I I I

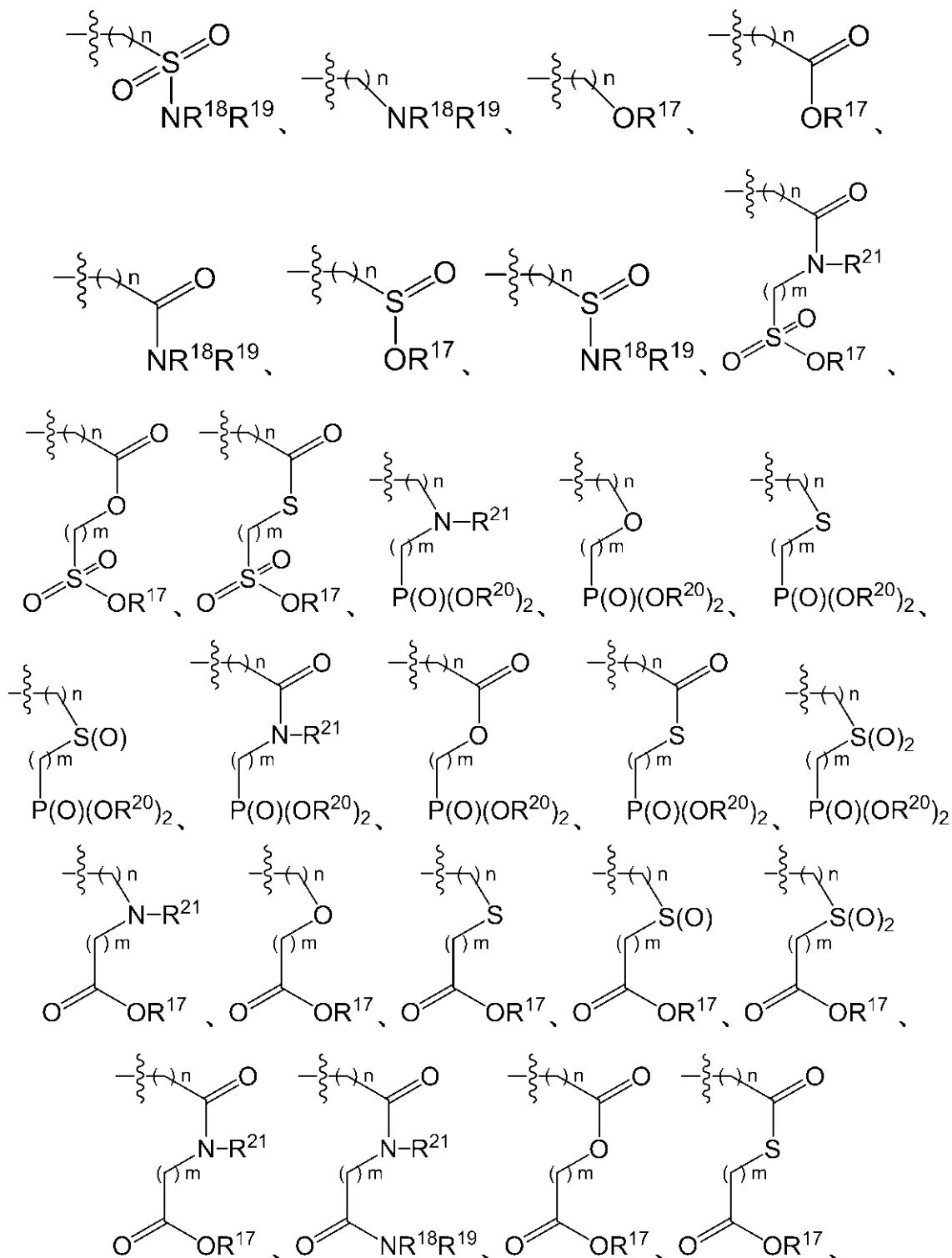
R¹は、ハロゲン、水素、置換されていてもよいC₁₋₈アルキル、OR⁹、C(O)R¹⁰、NO₂、NR¹³R¹⁴、CN、SR¹⁵またはSO₂R¹⁶であり；

R²は、ハロゲン、置換されていてもよいC₁₋₈アルキル、CF₃、OR⁹、C(O)R¹⁰、NO₂、NR¹³R¹⁴、CN、SR¹⁵またはSO₂R¹⁶であり；

R³は、水素、置換されていてもよいC₁₋₈アルキル、置換されていてもよいC₃₋₈シクロアルキル、置換されていてもよいC₃₋₈シクロアルケニル、置換されていてもよいC₆₋₁₀アリール、置換されていてもよい複素環、あるいはR⁵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；

R⁴は、水素、置換されていてもよいC₁₋₈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 C_{3-8} シクロアルケニル、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複素環、あるいは R^5 と共にスピロ単環または多環で、炭素環または複素環の、飽和または不飽和の置換されていてもよい 5 ~ 10 員環を形成し；

R^5 は、水素、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 C_{3-8} シクロアルケニル、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複素環、あるいは R^4 と共にスピロ単環または多環で、炭素環または複素環の、飽和または不飽和の置換されていてもよい 5 ~ 10 員環を形成し、あるいは R^3 と共に置換されていてもよい 5 ~ 6 員環を形成し；

R^6 は、ハロゲン、水素、置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 OR^9 、 $C(O)R^{10}$

、 NO_2 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 CN 、 SR^{15} または SO_2R^{16} であり；
 R^7 は、 ハロゲン、 水素、 置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 OR^9 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ ；
、 NO_2 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 CN 、 SR^{15} または SO_2R^{16} であり；
 R^8 は、 ハロゲン、 水素、 置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 OR^9 、 $\text{C}(\text{O})\text{R}^{10}$ ；
、 NO_2 、 $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$ 、 CN 、 SR^{15} または SO_2R^{16} であり；
 R^9 は、 水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}$ アルキル) または置換されていてもよい C_{1-8} アルキル ；
 R^{10} は、 水素、 置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 $\text{O}(\text{C}_{1-8}$ アルキル)、 $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ または OH ；
 R^{11} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 R^{12} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 R^{13} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 R^{14} は、 水素、 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_{1-8} アルキル、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}$ アルキル)、 または $\text{SO}_2(\text{C}_{1-8}$ アルキル) ；
 R^{15} は、 水素、 置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 または $\text{O}(\text{C}_{1-8}$ アルキル) ；
 R^{16} は、 OH 、 $\text{O}(\text{C}_{1-8}$ アルキル)、 $(\text{C}_{1-8}$ アルキル) または $\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ ；
 R^{17} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 R^{18} は、 水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}$ 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_{1-8} アルキル ；
 R^{19} は、 水素、 $\text{C}(\text{O})(\text{C}_{1-8}$ 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_{1-8} アルキル ；
 R^{20} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 R^{21} は、 水素、 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_{1-8} アルキル ；
 n は、 1、 2、 3、 4 または 5 ；
 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 - ブロモフェニル) - 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 - 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 - ブロモ - 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 - ブロモフェニル) - 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 - ブロモフェニル) - 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 - ブロモ - 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 - ブロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - 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 - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモ - 2 - イル) 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 - [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 - プロモ - 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 - プロモ - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモ - 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 - プロモ - 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 - プロモ - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモ - 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 - プロモフェニル) 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 - プロモ - 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) - 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 - プロモ - 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) アミノ] カルボニル } アミノ) - 3 - メチルペンタン酸 ;
 (2 S) - ({ [(4 - プロモフェニル) アミノ] カルボニル } アミノ) (フェニル) 酢酸 ;
 2 - ({ [(4 - プロモフェニル) 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 - プロモフェニル) アミノ] カルボニル } アミノ) - 3 - メチルブタン酸 ;
 (2 S) - 2 - ({ [(4 - プロモ - 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 - ジプ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、急性多発性小板状色素上皮症、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。