



(12) Translation of
european patent specification

(11) NO/EP 2415763 B1

NORWAY

(19) NO
(51) Int Cl. A61K 31/506 (2006.01)
C07D 213/83 (2006.01) A61P 27/06 (2006.01)
A61K 31/44 (2006.01) C07D 401/12 (2006.01)
A61K 31/443 (2006.01) C07D 401/14 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01) C07D 405/14 (2006.01)
A61K 31/444 (2006.01) C07D 409/14 (2006.01)
A61K 31/501 (2006.01) C07D 417/12 (2006.01)
C07D 417/14 (2006.01)

Norwegian Industrial Property Office

(21) Translation Published 2016.04.11
(80) Date of The European Patent Office Publication of the Granted Patent 2016.01.27
(86) European Application Nr. 10758728.9
(86) European Filing Date 2010.03.30
(87) The European Application's Publication Date 2012.02.08
(30) Priority 2009.03.30, JP, 2009082725
(84) Designated Contracting States: AT BE BG CH CY CZ DE DK EE ES FI FR GB GR HR HU IE IS IT LI LT LU LV MC MK MT NL NO PL PT RO SE SI SK SM TR
(73) Proprietor Ube Industries, Ltd., 1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shi, Yamaguchi 755-8633, JP-Japan
(72) Inventor HAGIHARA, Masahiko, c/o Ube Industries, Ltd.1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shiYamaguchi 755-8633, JP-Japan
YONEDA, Kenji, c/o Ube Industries, Ltd.1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shiYamaguchi 755-8633, JP-Japan
OKANARI, Eiji, c/o Ube Industries, Ltd.1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shiYamaguchi 755-8633, JP-Japan
SHIGETOMI, Manabu, c/o Ube Industries, Ltd.1978-96, Oaza Kogushi, Ube-shiYamaguchi 755-8633, JP-Japan
(74) Agent or Attorney Bryn Aarflot AS, Postboks 449 Sentrum, 0104 OSLO, Norge

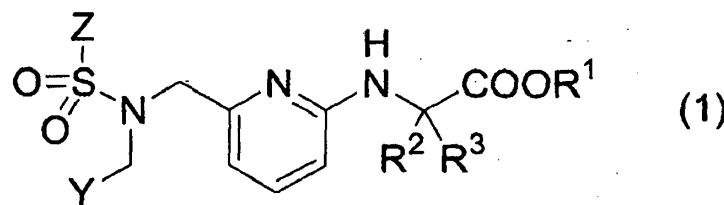
(54) Title **PHARMACEUTICAL COMPOSITION FOR TREATING OR PREVENTING GLAUCOMA**

(56) References Cited:
EP-A1- 2 264 009
WO-A1-2009/113600
JP-T- 2006 519 250
JP-T- 2008 503 490
CHRISTOPHER P. HOLMES, ET AL.: 'PTP1B inhibitors: Synthesis and evaluation of difluoro-methylenephosphonate bioisosteres on a sulfonamide scaffold' BIOORG.MED.CHEM.LETT. vol. 18, no. 8, 2008, pages 2719 - 2724, XP022606378

Enclosed is a translation of the patent claims in Norwegian. Please note that as per the Norwegian Patents Acts, section 66i the patent will receive protection in Norway only as far as there is agreement between the translation and the language of the application/patent granted at the EPO. In matters concerning the validity of the patent, language of the application/patent granted at the EPO will be used as the basis for the decision. The patent documents published by the EPO are available through Espacenet (<http://worldwide.espacenet.com>) or via the search engine on our website here: <https://search.patentstyret.no/>

P A T E N T K R A V

1. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse i behandling eller forebygging av
 5 glaukom som omfatter pyridylaminoeddiksyreforbindelse representert ved formelen
 (1):



10 hvor R¹, R² og R³ hver uavhengig representerer et hydrogenatom eller en C₁-C₆ alkylgruppe, Y representerer en bicyklisk heteroaromatisk ring-gruppe eller gruppe -Q¹-Q² som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₆ alkylgruppe, halogen C₁-C₆ alkylgruppe, C₁-C₆ alkoksylgruppe, halogen C₁-C₆ alkoksylgruppe og C₁-C₆ alkyltiogruppe,
 15 hvor Q¹ representerer en arylengruppe eller en 5- til 6-leddet heteroarylengruppe, Q² representerer en aromatisk gruppe eller en heterocyklistisk gruppe med en 5- til 6-leddet ring som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, hydroksylgruppe, C₁-C₆ alkylgruppe, halogen C₁-C₆ alkylgruppe, C₁-C₆ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₆ alkoksylgruppe,
 20 Z representerer en aromatisk gruppe eller en heteroaromatisk gruppe med en 5- til 6-leddet ring som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₆ alkylgruppe, halogen C₁-C₆ alkylgruppe, C₁-C₆ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₆ alkoksylgruppe,
 eller et farmasøytisk akseptabelt salt derav som en effektiv bestanddel,
 25 og hvor løsningen blir dryppet inn i øyet.

2. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvor R² og R³ hver uavhengig representerer et hydrogenatom eller en C₁-C₄ alkylgruppe.

30 3. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1 eller 2, hvor Y representerer en bicyklisk heteroaromatisk ring-gruppe eller en gruppe -Q¹-Q² som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₄ alkylgruppe, halogen C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe,

halogen C₁-C₄ alkoksylgruppe og C₁-C₄ alkyltiogruppe,
hvor Q¹ representerer en arylengruppe eller en 5- til 6-leddet heteroarylengruppe, Q²
representerer en aromatisk gruppe eller en heterocyklistisk gruppe med en 5- til 6-
leddet ring som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra
gruppensom omfatter et halogenatom, hydroksylgruppe, C₁-C₄ alkylgruppe, halogen
C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₄ alkoksylgruppe.

4. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene
1 til 3, hvor Z representerer en aromatisk gruppe eller en fullstendig umettet 5- til 6-
leddet heteroaromatisk ring-gruppe som hver kan være substituert med en eller flere
grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₄ alkylgruppe, halogen
C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₄ alkoksylgruppe.

5. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene
1 til 4, hvor Y representerer en benzofurylgruppe, benzotienylgruppe,
benzoksazolylgruppe eller benzotiazolylgruppe eller gruppe -Q¹-Q² som hver kan være
substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom,
C₁-C₄ alkylgruppe, halogen C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe, halogen C₁-C₄
alkoksylgruppe og C₁-C₄ alkyltiogruppe,
hvor Q¹ representerer en fenylengruppe, tienylengruppe, pyridazinylengruppe eller
pyrimidinylengruppe, Q² representerer en fenylgruppe, tienylgruppe, pyrazolylgruppe,
oksazolylgruppe, tiazolylgruppe, 1,2,4-triazolylgruppe, pyridylgruppe,
pyridazinylgruppe, pyrimidinylgruppe, 4,5-dihydrotiazolylgruppe, pyrrolidinylgruppe
eller piperidinylgruppe som kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra
gruppen som omfatter et halogenatom, hydroksylgruppe, C₁-C₄ alkylgruppe, halogen
C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₄ alkoksylgruppe.

6. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 5, hvor Y representerer
en benzofurylgruppe, benzotienylgruppe, benzoksazolylgruppe eller
benzotiazolylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt
fra gruppen som omfatter et fluoratom, kloratom, bromatom, methylgruppe,
etylgruppe, propylgruppe, isopropylgruppe, tert-butylgruppe, trifluormetylgruppe,
difluormetylgruppe, triklorometylgruppe, diklorometylgruppe, 2,2,2-trifluoretylgruppe,
2,2,2-trikloretylgruppe, metoksygruppe, etoksygruppe, propoksygruppe,
isopropoksygruppe, tert-butoksygruppe, trifluorometoksygruppe,
difluorometoksygruppe, triklorometoksygruppe, diklorometoksygruppe, metyliogruppe,

etyltiogruppe, propyltiogruppe, isopropyltiogruppe og tert-butyltiogruppe.

7. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 5, hvori Y er en gruppe - Q¹-Q² hvori Q¹ representerer en fenylengruppe, tienylengruppe, pyridazinylengruppe eller pyrimidinylengruppe, Q² representerer en fenylengruppe, tienylgruppe, pyrazolylgruppe, oksazolylgruppe, tiazolylgruppe, 1,2,4-triazolylgruppe, pyridylgruppe, pyridazinylgruppe, pyrimidinylgruppe, 4,5-dihydrotiazolylgruppe, pyrrolidinylgruppe eller piperidinylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et fluoratom, kloratom, bromatom, hydroksylgruppe, methylgruppe, etylgruppe, propylgruppe, isopropylgruppe, tert-butylgruppe, trifluormetylgruppe, difluormetylgruppe, triklorometylgruppe, dikklorometylgruppe, 2,2,2-trifluoretylgruppe, 2,2,2-trikloretylgruppe, metoksygruppe, etoksygruppe, propoksygruppe, isopropoksygruppe, tert-butoksygruppe, trifluormetoksygruppe, difluormetoksygruppe, triklorometoksygruppe og dikklorometoksygruppe.

8. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 7, hvori Z representerer en fenylengruppe, tienylgruppe, imidazolylgruppe, tiazolylgruppe, pyridylgruppe eller pyrimidinylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₄ alkylgruppe, halogen C₁-C₄ alkylgruppe, C₁-C₄ alkoksylgruppe og halogen C₁-C₄ alkoksylgruppe.

9. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 8, hvori Z representerer en fenylengruppe, tienylgruppe, imidazolylgruppe, tiazolylgruppe, pyridylgruppe eller pyrimidinylgruppe, som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et fluoratom, kloratom, bromatom, methylgruppe, etylgruppe, propylgruppe, isopropylgruppe, tert-butylgruppe, trifluormetylgruppe, difluormetylgruppe, triklorometylgruppe, dikklorometylgruppe, 2,2,2-trifluoretylgruppe, 2,2,2-trikloretylgruppe, metoksygruppe, etoksygruppe, propoksygruppe, isopropoksygruppe, tert-butoksygruppe, trifluormetoksygruppe, difluormetoksygruppe, triklorometoksygruppe og dikklorometoksygruppe.

10. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 9, hvori R² og R³ hver uavhengig representerer et hydrogenatom eller en methylgruppe.

11. Medisinsk oftalmisk løsning ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5 og 8 til 10, hvor Y representerer en benzofurylgruppe eller benzotienylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom og en C₁-C₄ alkoksylgruppe.

5

12. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5 og 8 til 10, hvor Y representerer en gruppe -Q¹-Q² hvor Q¹ representerer en fenylenlengruppe eller pyridazinylengruppe, Q² representerer en fenylenlengruppe, pyrazolylgruppe, tiazolylgruppe, 1,2,4-triazolylgruppe, pyridylgruppe, 10 pyridazinylgruppe, pyrimidinylgruppe eller 4,5-dihydrotiazolylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom, C₁-C₄ alkylgruppe og halogen C₁-C₄ alkylgruppe.

13. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge hvilket som helst av kravene 1 til 5 og 8 til 10, hvor Z representerer en fenylenlengruppe eller pyridylgruppe som hver kan være substituert med en eller flere grupper valgt fra gruppen som omfatter et halogenatom og en C₁-C₄ alkoksylgruppe.

14. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvor R¹ representerer et hydrogenatom, metylgruppe, etylgruppe, propylgruppe, isopropylgruppe, butylgruppe, isobutylgruppe, sek-butylgruppe, tert-butylgruppe, pentylgruppe eller heksylgruppe,

R² og R³ representerer hver uavhengig et hydrogenatom eller metylgruppe, Y representerer en benzofuran-2-ylgruppe, 6-fluorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-klorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-metoksybenzofuran-2-ylgruppe, benzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 5,6-difluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-klor-benzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-klor-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-metylbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 5-fluor-6-metylbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-etylbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-etyl-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-trifluormetylbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 5-fluor-6-trifluormetylbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-metoksybenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 5-fluor-6-metoksybenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-difluormetoksybenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-difluormetoksy-5-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-metyltiobenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 5-fluor-6-metyltiobenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, bifenyl-4-ylgruppe, 2'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 2',4'-difluorbifenyl-4-ylgruppe, 3',4'-difluorbifenyl-4-ylgruppe, 2'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klor-2'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klor-3'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-hydroksybifenyl-4-

ylgruppe, 3'-methylbifenyl-4-ylgruppe, 3'-ethylbifenyl-4-ylgruppe, 3'-trifluormethylbifenyl-4-ylgruppe, 3'-metoksybifenyl-4-ylgruppe, 3'-difluormetoksybifenyl-4-ylgruppe, 4-(tiofen-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiofen-3-yl)fenylgruppe, 4-(pyrazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-fluortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-klortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-klortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-metyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dimetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-trifluormetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-fluortiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-klortiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-5-yl)fenylgruppe, 4-(1,2,4-triazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(pyridin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-3-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-hydroksypyrimidin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-5-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dihydrotiazol-2-yl)fenylgruppe, 6-fenylpyridazin-3-ylgruppe, 6-(tiazol-2-yl)pyridazin-3-ylgruppe eller 6-(tiazol-4-yl)pyridazin-3-ylgruppe og

15 Z representerer en fenylgruppe, 2-fluorfenylgruppe, 3-fluorfenylgruppe, 4-fluorfenylgruppe, 3,4-difluorfenylgruppe, 3,5-difluorfenylgruppe, 3,4,5-trifluorfenylgruppe, 2-klorfenylgruppe, 3-klorfenylgruppe, 4-klorfenylgruppe, 2,6-diklorfenylgruppe, 4-klor-3-fluorfenylgruppe, 4-klor-3,5-difluorfenylgruppe, 4-bromfenylgruppe, 4-metylfenylgruppe, 3-fluor-4-metylfenylgruppe, 4-etylfenylgruppe, 4-etyl-3-fluorfenylgruppe, 4-propylfenylgruppe, 4-isopropylfenylgruppe, 4-tert-butylfenylgruppe, 4-trifluormetylfenylgruppe, 3-fluor-4-trifluormetylfenylgruppe, 4-difluormetylfenylgruppe, 4-triklormetylfenylgruppe, 4-diklormetylfenylgruppe, 4-(2,2,2-trifluoretyl)fenylgruppe, 4-(2,2,2-trikloretyl)fenylgruppe, 4-metoksyfenylgruppe, 3-fluor-4-metoksyfenylgruppe, 4-etoksyfenylgruppe, 4-propoksyfenylgruppe, 4-isopropoksyfenylgruppe, 4-tert-butoksyfenylgruppe, 4-trifluormetoksyfenylgruppe, 4-difluormetoksyfenylgruppe, 4-difluormetoksy-3-fluorfenylgruppe, 4-triklormetoksyfenylgruppe, 4-diklormetoksyfenylgruppe, tiofen-2-ylgruppe, tiofen-3-ylgruppe, 5-klor-tiofen-2-ylgruppe, 1-metyl-1H-imidazol-4-ylgruppe, tiazol-2-ylgruppe, pyridin-2-ylgruppe, 5-fluorpyridin-2-ylgruppe, 5-klorpyridin-2-ylgruppe, 5-metylpyridin-2-ylgruppe, 5-etylpyridin-2-ylgruppe, 5-trifluormetylpyridin-2-ylgruppe, 5-metoksyppyridin-2-ylgruppe, 5-difluormetoksyppyridin-2-ylgruppe, pyridin-3-ylgruppe, 6-fluorpyridin-3-ylgruppe, 6-klorpyridin-3-ylgruppe, 6-metylpyridin-3-ylgruppe, 6-etylpyridin-3-ylgruppe, 6-trifluormetylpyridin-3-ylgruppe, 6-metoksyppyridin-3-ylgruppe, 6-difluormetoksyppyridin-3-ylgruppe, pyridin-4-ylgruppe eller pyrimidin-2-ylgruppe.

15. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvori R¹ representerer et hydrogenatom, methylgruppe, etylgruppe, propylgruppe, isopropylgruppe, tert-butylgruppe eller heksylgruppe,

R² og R³ representerer hver uavhengig et hydrogenatom eller methylgruppe,

5 Y representerer en benzofuran-2-ylgruppe, 6-fluorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-

klorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-metoksybenzofuran-2-ylgruppe, benzo[b]tiofen-2-

ylgruppe, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-klorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-

metoksy-benzo[b]tiofen-2-ylgruppe, bifenyl-4-ylgruppe, 2'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-

fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 2'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-

10 klorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-metylifenyl-4-ylgruppe, 3'-

trifluormetylbenyl-4-ylgruppe, 4-(tiofen-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiofen-3-yl)fenylgruppe;

4-(pyrazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-4-

yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-fluortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-

25 klor-tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-klor-tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-metyl-tiazol-2-

yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dimetyl-tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-trifluormetyl-tiazol-2-

yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-fluortiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-

klor-tiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-5-yl)fenylgruppe, 4-(1,2,4-triazol-1-

yl)fenylgruppe, 4-(pyridin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-3-yl)fenylgruppe, 4-

30 (pyridazin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-4-

yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-5-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dihydrotiazol-2-yl)fenylgruppe

eller 6-fenylpyridazin-3-ylgruppe, og

Z representerer en fenylgruppe, 2-fluorfenylgruppe, 3-fluorfenylgruppe, 4-

fluorfenylgruppe, 3,4-difluorfenylgruppe, 3,5-difluorfenylgruppe, 2-klorfenylgruppe, 3-

klorfenylgruppe, 4-klorfenylgruppe, 2,6-diklorfenylgruppe, 4-klor-3-fluorfenylgruppe,

4-metylfenylgruppe, 3-fluor-4-metylfenylgruppe, 4-etylfenylgruppe, 4-etyl-3-

fluorfenylgruppe, 4-trifluormetylfenylgruppe, 3-fluor-4-trifluormetylfenylgruppe, 4-

35 metoksyfenylgruppe, 3-fluor-4-metoksyfenylgruppe, 4-difluormetoksyfenylgruppe, 4-

difluormetoksy-3-fluorfenylgruppe, tiofen-2-ylgruppe, tiofen-3-ylgruppe, pyridin-2-

ylgruppe, 5-fluorpyridin-2-ylgruppe, 5-klorpyridin-2-ylgruppe, 5-metoksy-pyridin-2-

30 ylgruppe, pyridin-3-ylgruppe, 6-fluorpyridin-3-ylgruppe, 6-klorpyridin-3-ylgruppe, 6-

metoksy-pyridin-3-ylgruppe eller pyridin-4-ylgruppe.

16. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvori R¹ representerer et hydrogenatom, methylgruppe, etylgruppe, isopropylgruppe eller heksylgruppe,

R² og R³ hver representerer et hydrogenatom,

Y representerer en benzofuran-2-ylgruppe, 6-fluorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-

klorbenzofuran-2-ylgruppe, 6-metoksybenzofuran-2-ylgruppe, benzo[b]tiofen-2-

ylgruppe, 6-fluorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-klorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-metoksybenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, bifenyl-4-ylgruppe, 2'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 2'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 3'-metylifenyl-4-ylgruppe, 3'-trifluormetylifenyl-4-ylgruppe, 4-(tiofen-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiofen-3-yl)fenylgruppe, 4-(pyrazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(oksazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-fluortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-klortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-klortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-metyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dimetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-trifluormetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-fluortiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(2-klortiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-5-yl)fenylgruppe, 4-(1,2,4-triazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(pyridin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-3-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-5-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dihydrotiazol-2-yl)fenylgruppe eller 6-fenylpyridazin-3-ylgruppe, og Z representerer en fenylgruppe, 2-fluorfenylgruppe, 3-fluorfenylgruppe, 4-fluorfenylgruppe, 2-klorfenylgruppe, 3-klorfenylgruppe, 4-klorfenylgruppe, 2,6-diklorfenylgruppe, 4-metoksyfenylgruppe, pyridin-2-ylgruppe eller pyridin-3-ylgruppe.

20 17. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvori R¹ representerer et hydrogenatom, methylgruppe, etylgruppe, isopropylgruppe eller heksylgruppe, R² og R³ representerer hver et hydrogenatom, Y representerer en benzofuran-2-ylgruppe, benzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-klorbenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, 6-metoksybenzo[b]tiofen-2-ylgruppe, bifenyl-4-ylgruppe, 4'-fluorbifenyl-4-ylgruppe, 4'-klorbifenyl-4-ylgruppe, 4-(pyrazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-klortiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(5-metyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dimetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(4-trifluormetyltaiazol-2-yl)fenylgruppe, 4-(tiazol-4-yl)fenylgruppe, 4-(1,2,4-triazol-1-yl)fenylgruppe, 4-(pyridin-2-yl)fenylgruppe, 4-(pyridazin-4-yl)fenylgruppe, 4-(pyrimidin-2-yl)fenylgruppe, 4-(4,5-dihydrotiazol-2-yl)fenylgruppe eller 6-fenylpyridazin-3-ylgruppe, og Z representerer en fenylgruppe, 2-fluorfenylgruppe, 3-fluorfenylgruppe, 4-fluorfenylgruppe, 2-klorfenylgruppe, 3-klorfenylgruppe, 4-klorfenylgruppe, 2,6-diklorfenylgruppe, 4-metoksyfenylgruppe, pyridin-2-ylgruppe eller pyridin-3-ylgruppe.

35

18. Medisinsk oftalmisk løsning for anvendelse ifølge krav 1, hvori pyridylaminoeddiksyreforbindelsen er:

{6-[(benzofuran-2-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

{6-[(benzo[b]tiofen-2-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

5 {6-[(6-klorbenzo[b]tiofen-2-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

{6-[(6-metoksybenzo[b]tiofen-2-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

10 {6-[(bifenyl-4-ylmethyl)(pyridin-2-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

{6-[(bifenyl-4-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

{6-[(4'-fluorbifenyl-4-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

15 {6-[(4'-klorbifenyl-4-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl]pyridin-2-ylamino}eddiksyre,

(6-{(4-fluorbenzensulfonyl)[4-(pyrazol-1-yl)benzyl]aminomethyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

20 (6-{[4-(pyrazol-1-yl)benzyl](pyridin-2-ylsulfonyl)aminomethyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{[4-(pyrazol-1-yl)benzyl](pyridin-3-ylsulfonyl)aminomethyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

isopropyl (6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminomethyl}pyridin-2-ylamino)acetat,

25 etyl (6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminomethyl}pyridin-2-ylamino)acetat,

(6-{(4-fluorbenzensulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminomethyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

30 (6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminomethyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{(pyridin-3-ylsulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(4-trifluormetyl)tiazol-2-yl)benzyl]aminometyl}-pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

5 (6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(tiazol-4-yl)benzyl]aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{[4-(pyridin-2-yl)benzyl](pyridin-3-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

10 (6-{[4-(pyridazin-4-yl)benzyl](pyridin-3-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(pyrimidin-2-yl)benzyl]aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

(6-{[4-(4,5-dihydrotiazol-2-yl)benzyl](4-fluorbenzensulfonyl)-aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

15 {6-[(6-fenylpyridazin-3-ylmethyl)(pyridin-3-ylsulfonyl)aminometyl]pyridin-2-yl-amino}eddiksyre,

heksyl (6-{(pyridin-2-ylsulfonyl)[4-(tiazol-2-yl)benzyl]aminometyl}pyridin-2-yl-amino)acetat,

20 (6-{[4-(5-klortiazol-2-yl)benzyl](pyridin-2-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-yl-amino)eddiksyre,

(6-{[4-(5-metyltiazol-2-yl)benzyl](pyridin-2-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-yl-amino)eddiksyre,

(6-{[4-(4,5-dimetyltiazol-2-yl)benzyl](pyridin-2-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

25 (6-{(pyridin-3-ylsulfonyl)[4-(1,2,4-triazol-1-yl)benzyl]aminometyl}pyridin-2-ylamino)eddiksyre,

etyl (6-{[4-(pyrazol-1-yl)benzyl](pyridin-3-ylsulfonyl)aminometyl}pyridin-2-ylamino) acetat, eller

30 isopropyl (6-{[4-(pyrazol-1-yl)benzyl](pyridin-3-ylsulfonyl)aminometyl}-pyridin-2-ylamino) acetat.