

ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА  
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

## (12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2015110979, 30.08.2013

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:  
30.08.2012 US 61/695016

(43) Дата публикации заявки: 20.10.2016 Бюл. № 29

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на  
национальной фазе: 30.03.2015(86) Заявка РСТ:  
JP 2013/073300 (30.08.2013)(87) Публикация заявки РСТ:  
WO /2014/034842 (06.03.2014)Адрес для переписки:  
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО  
"Юридическая фирма Городисский и Партнеры"(71) Заявитель(и):  
ТАЙСО ФАРМАСЬЮТИКАЛ КО., ЛТД.  
(JP)(72) Автор(ы):  
КОДЗИМА Наоки (JP),  
РОМАН Дж. Ричард (US),  
МИЯТА Нориоки (JP),  
ТАКАХАСИ Тейсюке (JP),  
ТОМОИКЕ Хидеки (JP),  
ТАКЕДА Такуя (JP)

A

## (54) КОМБИНАЦИИ ИНГИБИТОРОВ SGLT 2 И АНТИГИПЕРТЕНЗИВНЫХ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ

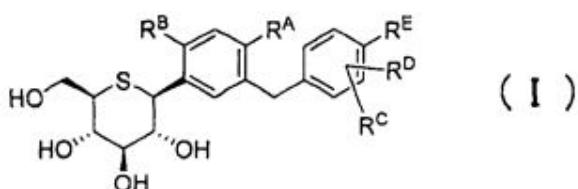
R U 2 0 1 5 1 1 0 9 7 9 A

## (57) Формула изобретения

1. Лекарственное средство для лечения заболевания, включающего в качестве фактора риска сердечно-сосудистых событий по меньшей мере гипертензию или сахарный диабет, которое характеризуется комбинацией ингибитора SGLT 2 и антигипертензивного лекарственного средства.

2. Лекарственное средство по п. 1, где ингибитор SGLT 2 представляет собой соединение 1-тио-D-глюцитола, представленное указанной ниже общей формулой (I), его фармацевтически приемлемую соль, или гидрат соединения или соли:

[Формула 1]



[в формуле (I)]

 $R^A$  представляет собой атом водорода,  $C_{1-6}$ -алкильную группу,  $-OR^F$  или атом галогена, $R^B$  представляет собой атом водорода, гидроксигруппу или  $-OR^F$ ,

$R^C$  и  $R^D$ , которые могут являться одинаковыми или различными, каждый представляет собой атом водорода, атом галогена,  $C_{1-8}$ алкильную группу или  $-OR^F$ ,

$R^E$  представляет собой (i) атом водорода, (ii) атом галогена, (iii) гидроксигруппу, (iv)  $C_{1-8}$ алкильную группу, необязательно замещенную атомом галогена, (v)  $-OR^F$  или (vi)  $-SR^F$ , где  $R^F$  представляет собой  $C_{1-6}$ алкильную группу, необязательно замещенную атомом галогена.]

3. Лекарственное средство по п. 2, где соединение 1-тио-D-глюцитола выбрано из группы, состоящей из:

- (1S)-1,5-ангидро-1-[3-(4-этоксибензил)-6-метокси-4-метилфенил]-1-тио-D-глюцитола,
- (1S)-1,5-ангидро-1-[4-хлор-3-(4-метилбензил)фенил]-1-тио-D-глюцитола,
- (1S)-1,5-ангидро-1-[4-хлор-3-(4-метилтиобензил)фенил]-1-тио-D-глюцитола и
- (1S)-1,5-ангидро-1-[4-хлор-3-(4-этилбензил)фенил]-1-тио-D-глюцитола.

4. Лекарственное средство по п. 2, где соединение 1-тио-D-глюцитола представляет собой (1S)-1,5-ангидро-1-[3-(4-этоксибензил)-6-метокси-4-метилфенил]-1-тио-D-глюцитол.

5. Лекарственное средство по п. 1, где антигипертензивное лекарственное средство представляет собой супрессор ренин-ангиотензин-альдостероновой системы.

6. Лекарственное средство по п. 5, где супрессор ренин-ангиотензин-альдостероновой системы представляет собой ингибитор ACE или блокатор рецептора ангиотензина II.

7. Лекарственное средство по п. 6, где ингибитор ACE представляет собой соединение, выбранное из группы, состоящей из алацеприла, беназеприла, каптоприла, церонаприла, цилазаприла, делаприла, эналаприла, эналаприлата, фозиноприла, имидаприла, лизиноприла, мовелтиприла, мօէксиприла, периндоприла, хинаприла, рамиприла, спирраприла, темокаприла и трандолаприла, или их фармацевтически приемлемую соль, или гидрат соединения или соль.

8. Лекарственное средство по п. 6, где блокатор рецептора ангиотензина II представляет собой соединение, выбранное из группы, состоящей из лозартана, кандесартана, ирбесартана, валсартана, телмисартана и эпросартана, или их фармацевтически приемлемую соль, или гидрат соединения или соль.

9. Лекарственное средство по п. 1, где заболевание представляет собой гипертензию.

10. Лекарственное средство по п. 1, где заболевание представляет собой сахарный диабет, заболевание, связанное с сахарным диабетом, или осложнение сахарного диабета.

11. Лекарственное средство по п. 1, где заболевание включает проявление сахарного диабета и гипертензии.

12. Лекарственное средство по п. 1, где заболевание представляет собой диабетическую нефропатию.

13. Лекарственное средство по п. 1, где заболевание дополнительно включает наблюдаемую сниженную функцию почек.

14. Лекарственное средство по любому из пп. 1-13 для лечения заболевания, включающего в качестве фактора риска сердечно-сосудистых событий по меньшей мере гипертензию или сахарный диабет, которое отличается тем, что ингибитор SGLT 2 и антигипертензивное лекарственное средство вводят пациенту одновременно или раздельно.

15. Лекарственное средство, которое содержит ингибитор SGLT 2 и которое используют в комбинации с антигипертензивным лекарственным средством, таким образом, усиливая гипотензивное действие антигипертензивного лекарственного средства.

16. Лекарственное средство, которое содержит ингибитор SGLT 2 и которое

используют в комбинации с антигипертензивным лекарственным средством, таким образом, усиливая эффект ингибитора SGLT 2, при лечении сахарного диабета, заболевания, связанного с сахарным диабетом, или осложнения сахарного диабета.

17. Лекарственное средство, которое содержит ингибитор SGLT 2 и которое используют в комбинации с антигипертензивным лекарственным средством, таким образом, усиливая эффект ингибитора SGLT 2, при лечении диабетической нефропатии.

18. Способ лечения заболевания, включающего в качестве фактора риска сердечно-сосудистых событий по меньшей мере гипертензию или сахарный диабет, который включает введение ингибитора SGLT 2 и антигипертензивного лекарственного средства одновременно или раздельно нуждающемуся в этом пациенту.