



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ,
ПАТЕНТАМ И ТОВАРНЫМ ЗНАКАМ

(12) **ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ**

(21), (22) Заявка: 2004136276/15, 16.06.2003

(30) Приоритет: 26.06.2002 GB 0214784.1

(43) Дата публикации заявки: 10.09.2005 Бюл. № 25

(85) Дата перевода заявки РСТ на национальную фазу: 26.01.2005

(86) Заявка РСТ:
IB 03/02657 (16.06.2003)(87) Публикация РСТ:
WO 2004/002461 (08.01.2004)Адрес для переписки:
191036, Санкт-Петербург, а/я 24, "НЕВИНПАТ",
пат.пов. А.В.Поликарпову(71) Заявитель(и):
Пфайзер Инк. (US)(72) Автор(ы):
ФОКС Дейвид Натан Абрахам (GB),
ХЬЮЗ Бернадетт (GB)(74) Патентный поверенный:
Поликарпов Александр Викторович(54) **КОМБИНАЦИЯ ИНГИБИТОРОВ ФДЭ5 С АНТАГОНИСТАМИ РЕЦЕПТОРОВ АНГИОТЕНЗИНА 11**

Формула изобретения

1. Применение комбинации ингибитора фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), специфичной в отношении циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), и антагониста рецепторов ангиотензина II для приготовления лекарства для паллиативного, куративного и профилактического лечения гипертензии, включая эссенциальную гипертензию, легочную гипертензию, вторичную гипертензию, изолированную систолическую гипертензию, гипертензию, ассоциированную с диабетом, гипертензию, ассоциированную с атеросклерозом, и реноваскулярную гипертензию, застойную сердечную недостаточность, стенокардию, удар, диабет и нарушенную толерантность к глюкозе.

2. Применение по п.1, где ингибитор ФДЭ5 имеет величину IC₅₀ менее 100 нМ.

3. Применение по п.1, где ингибитор ФДЭ5 имеет величину IC₅₀ менее 50 нМ.

4. Применение по п.1, где ингибитор ФДЭ5 выбирают из:

5-[2-этокси-5-(4-метил-1-пиперазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-7-она(силденафила);

(6R, 12aR)-2,3,6,7,12,12a-гексагидро-2-метил-6-(3,4-метилendioксифенил)пиразино [2',1':6,1]пиридо[3,4-b]индол-1,4-диона(тадалафила);

2-[2-этокси-5-(4-этилпиперазин-1-ил-1-сульфонил)фенил]-5-метил-7-пропил-3Н-имидазо [5,1-f][1,2,4]триазин-4-она(варденафила);

3-(1-метил-7-оксо-3-пропил-6,7-дигидро-1Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-5-ил)-N-(2-(1-метилпирролидин-2-ил)этил)-4-пропоксибензолсульфонамида;

5-[2-этокси-5-(4-этилпиперазин-1-илсульфонил)пиримидин-3-ил]-3-этил-2-[2-метоксиэтил]-2,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-7-она; и

5-(5-ацетил-2-бутокси-3-пиридинил)-3-этил-2-(1-этил-3-азетидинил)-2,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-7-она

и их фармацевтически приемлемых солей.

5. Применение по п.4, где ингибитор ФДЭ5 выбирают из 5-[2-этокси-5-(4-метил-1-пиперазинилсульфонил)фенил]-1-метил-3-н-пропил-1,6-дигидро-7Н-пиразоло[4,3-d]пиримидин-7-она(силденафила) и его фармацевтически приемлемых солей.

6. Применение по п.5, где ингибитор ФДЭ5 представляет собой силденафила цитрат.

7. Применение по п.1, где антагонист рецепторов ангиотензина II выбирают из кандесартана, эпросартана, ирбесартана, лосартана, олмесартана, олмесартана медоксомила, саралазина, телмисартана и валсартана и их фармацевтически приемлемых солей.

8. Применение по любому из пп.1-7, где комбинацию ингибитора ФДЭ5 и антагониста рецепторов ангиотензина II выбирают из следующего:

силденафила цитрат и кандесартан;

силденафила цитрат и эпросартан;

силденафила цитрат и ирбесартан;

силденафила цитрат и лосартан;

силденафила цитрат и олмесартан;

силденафила цитрат и олмесартана медоксомил;

силденафила цитрат и телмисартан;

силденафила цитрат и валсартан.

9. Применение по п.1, где лекарство предназначено для лечения гипертензии.

10. Фармацевтическая композиция, содержащая ингибитор фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), специфичной в отношении циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), и антагонист рецепторов ангиотензина II.

11. Фармацевтическая комбинация для одновременного, отдельного или последовательного введения для лечения гипертензии, содержащая ингибитор фосфодиэстеразы типа 5 (ФДЭ5), специфичной в отношении циклического гуанозинмонофосфата (цГМФ), и антагонист рецепторов ангиотензина II.

12. Набор для лечения гипертензии, включающий: а) первую фармацевтическую композицию, содержащую ингибитор ФДЭ5; б) вторую фармацевтическую композицию, содержащую антагонист рецепторов ангиотензина II; и в) контейнер для композиций.

13. Способ лечения гипертензии у пациента, включающий лечение указанного пациента одновременно, отдельно или последовательно эффективным количеством ингибитора ФДЭ5 и антагониста рецепторов ангиотензина II.