



ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: 2019126648, 09.02.2018

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
14.02.2017 US 62/458,868

(43) Дата публикации заявки: 16.03.2021 Бюл. № 8

(85) Дата начала рассмотрения заявки РСТ на
национальной фазе: 16.09.2019

(86) Заявка РСТ:
IB 2018/000206 (09.02.2018)

(87) Публикация заявки РСТ:
WO 2018/150264 (23.08.2018)

Адрес для переписки:
129090, Москва, ул. Б. Спасская, 25, стр. 3, ООО
"Юридическая фирма Городисский и
Партнеры"

(71) Заявитель(и):
ИСОФОЛ МЕДИКАЛ АБ (SE)

(72) Автор(ы):
КАРЛССОН, Йеран, У. (SE),
ГУСТАВССОН, Бенгт (SE),
ОДИН, Элизабет (SE),
ВЕТТЕРГREN, Ивонн (SE),
ВЕДИН, Андерс (SE)

**(54) СПОСОБЫ УВЕЛИЧЕНИЯ УРОВНЯ 2-ДЕЗОКСИУРИДИНА (DURD) В ПЛАЗМЕ И
ИНГИБИРОВАНИЯ ТИМИДИЛАТСИНТАЗЫ**

(57) Формула изобретения

1. Способ увеличения концентрации dUrd в плазме человека, включающий а. этап внутривенного введения указанному субъекту-человеку фармацевтической композиции, содержащей 6R-МТГФ в дозе 5-1000 мг/м² в комбинации с терапевтически эффективным количеством по меньшей мере одного противоракового агента; где указанное введение вызывает повышенную концентрацию dUrd в плазме.
2. Способ по п.1, в котором концентрация dUrd в плазме у указанного человека увеличивается по сравнению с уровнями dUrd в плазме у человека после эквимолярного введения ЛВ.
3. Способ по п.1, в котором средние уровни dUrd в плазме у указанного человека выше, чем средние уровни в плазме, полученные у людей после эквимолярного введения ЛВ.
4. Способ по п.1, где фармацевтическую композицию вводят в виде болюса.
5. Способ по п.1, в котором указанный человек страдает от рака.
6. Способ по п.5, в котором указанный рак представляет собой рак ободочной и прямой кишки.
7. Способ по п.1, дополнительно включающий введение по меньшей мере одного дополнительного противоракового соединения.

A
2019126648A

R U
2 0 1 9 1 2 6 6 4 8 A

8. Способ по п.7, в котором указанное одно дополнительное противораковое соединение выбрано из группы, состоящей из оксалиплатина, иринотекана и бевацизумаба.

9. Способ ингибирования тимидилатсинтазы (TS) у человека, включающий

а. этап внутривенного введения указанному субъекту-человеку фармацевтической композиции, содержащей 6R-МТГФ в дозе 5-1000 мг/м² в комбинации с терапевтически эффективным количеством по меньшей мере одного противоракового агента;

где указанное введение вызывает усиленное ингибирование TS по сравнению с человеком, получившим эквимолярную дозу ЛВ.

10. Способ по п.9, где фармацевтическую композицию вводят в виде болюса.

11. Способ по п.9, в котором указанный человек страдает от рака.

12. Способ по п.11, в котором указанный рак представляет собой рак ободочной и прямой кишки.

13. Способ по п.9, в котором по меньшей мере один противораковый агент представляет собой 5-фторурацил (5-ФУ).

14. Способ по п.13, дополнительно включающий введение по меньшей мере одного дополнительного противоракового соединения.

15. Способ по п.14, в котором указанное одно дополнительное противораковое соединение выбирают из группы, состоящей из оксалиплатина, иринотекана и бевацизумаба.