



**ФЕДЕРАЛЬНАЯ СЛУЖБА
ПО ИНТЕЛЛЕКТУАЛЬНОЙ СОБСТВЕННОСТИ**

(12) ЗАЯВКА НА ИЗОБРЕТЕНИЕ

(21)(22) Заявка: **2011122542/15, 06.06.2011**

Приоритет(ы):

(30) Конвенционный приоритет:
09.06.2003 US 60/477,796

(62) Номер и дата подачи первоначальной заявки,
из которой данная заявка выделена:
2006100030 10.01.2006

(43) Дата публикации заявки: **20.12.2012** Бюл. № **35**

Адрес для переписки:

**101000, Москва, Центр, а/я 732, "Агентство
ТРИА РОБИТ", Г.М.Вашиной**

(71) Заявитель(и):

ВАКСАЛ Самуэль (US)

(72) Автор(ы):

ВАКСАЛ Самуэль (US)

**(54) СПОСОБ ИНГИБИРОВАНИЯ РЕЦЕПТОРНЫХ ТИРОЗИНКИНАЗ С ПОМОЩЬЮ
ВНЕКЛЕТОЧНОГО АНТАГОНИСТА И ВНУТРИКЛЕТОЧНОГО АНТАГОНИСТА**

(57) Формула изобретения

1. Способ ингибирования рецепторной тирозинкиназы в организме пациента-млекопитающего, включающий введение в организм этого пациента-млекопитающего внеклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы.

2. Способ по п.1, применяемый для терапии опухолевого роста или ангиогенеза у пациента-млекопитающего.

3. Способ по п.1 или 2, в котором рецепторная тирозинкиназа является рецептором эпидермального фактора роста (EGFR).

4. Способ по п.3, в котором внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является ЦЕТУКСИМАБ, АВХ-EGF, EMD 72000, h-R3 или Y10.

5. Способ по п.3, в котором внутриклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является соединение ZD1839 или соединение OSI-774.

6. Способ по п.1 или 2, в котором рецепторная тирозинкиназа является рецептором HER2.

7. Способ по п.6, в котором внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является ТРАСТУЗУМАБ.

8. Способ по п.1 или 2, в котором рецепторная тирозинкиназа является рецептором васкулярно-эндотелиального фактора роста (VEGFR).

9. Способ по п.8, в котором внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является БЕВАЦИЗУМАБ.

10. Способ по п.1 или 2, в котором внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы обладает способностью ингибирования Ras-протеина или является Ras-

Raf-модулятором.

11. Способ по п.1 или 2, при котором внеклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы вводят одновременно.

12. Способ по п.1 или 2, при котором внеклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы вводят последовательно.

13. Способ по п.1 или 2, при котором внеклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы вводят отдельно.

14. Способ по п.1 или 2, дополнительно включающий введение антинеопластического агента.

15. Способ по п.1 или 2, при котором опухоль является первичной опухолью.

16. Способ по п.1 или 2, при котором опухоль является метастатической опухолью.

17. Способ по п.1 или 2, при котором опухоль является рефракторной опухолью.

18. Фармацевтическая композиция, содержащая внеклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы.

19. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой рецепторная тирозинкиназа является рецептором эпидермального фактора роста (EGFR).

20. Фармацевтическая композиция по п.19, в которой внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является ЦЕТУКСИМАБ, АВХ-EGF, EMD 72000, h-R3 или Y10.

21. Фармацевтическая композиция по любому из пп.19 или 20, в которой внутриклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является ZD1839 или OSI-774.

22. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой рецепторная тирозинкиназа является рецептором HER2.

23. Фармацевтическая композиция по п.22, в которой внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является ТРАСТУЗУМАБ.

24. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой рецепторная тирозинкиназа является рецептором васкулярно-эндотелиального фактора роста (VEGFR).

25. Фармацевтическая композиция по п.24, в которой внеклеточным антагонистом рецепторной тирозинкиназы является БЕВАЦИЗУМАБ.

26. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой внутриклеточный антагонист рецепторной тирозинкиназы обладает способностью ингибирования Ras-протеина или является Ras-Raf-модулятором.

27. Фармацевтическая композиция по п.18, дополнительно содержащая антинеопластический агент.

28. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой обеспечено отдельное введение внеклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы.

29. Фармацевтическая композиция по п.18, в которой обеспечено совместное введение внеклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы и внутриклеточного антагониста рецепторной тирозинкиназы.