

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété  
Intellectuelle  
Bureau international



(43) Date de la publication internationale  
9 avril 2009 (09.04.2009)

(10) Numéro de publication internationale  
**WO 2009/044009 A3**

(51) Classification internationale des brevets :  
*A61K 8/63* (2006.01) *A23L 1/30* (2006.01)  
*A61Q 19/08* (2006.01) *A61K 31/58* (2006.01)

(21) Numéro de la demande internationale :  
PCT/FR2008/001100

(22) Date de dépôt international :  
24 juillet 2008 (24.07.2008)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :  
0705427 25 juillet 2007 (25.07.2007) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :  
**TROPHOS** [FR/FR]; Parc Scientifique de Luminy,  
Luminy Biotech Entreprises, Case 931, F-13288  
Marseille Cedex 9 (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : **PRUSS, Rebecca** [FR/FR]; 7 Avenue Emile Bodin, F-13260 Cassis (FR). **DROUOT, Cyrille** [FR/FR]; 392 Clos Jean Aicard, F-83300 Draguignan (FR).

(74) Mandataire : **SANTARELLI**; Bureau de Marseille, 146 Rue Paradis, F-13294 Marseille (FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM,

AO, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BH, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DO, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, GT, HN, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LA, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LY, MA, MD, ME, MG, MK, MN, MW, MX, MY, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RS, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, ST, SV, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasienn (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, MT, NL, NO, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

- avec rapport de recherche internationale (Art. 21(3))
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues (règle 48.2.h))

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale :

5 novembre 2009

(54) Title : USE OF 4-AZACHOLEST-4-ENE N-OXIDE OR DERIVATIVES THEREOF AS ANTIOXIDANTS

(54) Titre : UTILISATION DU 4-AZACHOLEST-4-ÈNE N-OXIDE OU DE SES DÉRIVÉS COMME ANTIOXYDANTS

(57) Abstract : The invention relates to the use of 4-azacholest-4-ene N-oxide or of at least one of the derivatives thereof as antioxidants in the cosmetics and food fields, and as antioxidant preservatives that can be used, in particular, in cosmetic, food and pharmaceutical products.

(57) Abrégé : L'invention concerne l'utilisation du 4-azacholest-4-ène N-oxide ou d'au moins un de ses dérivés comme antioxydants dans les domaines cosmétiques et alimentaires, et comme conservateurs antioxydant utilisables notamment dans des produits cosmétiques, alimentaires, et pharmaceutiques.



WO 2009/044009 A3

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/FR2008/001100

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

INV. A61K8/63 A61Q19/08 A23L1/30 A61K31/58

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61K A61Q A61L

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE, WPI Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                                                                             | Relevant to claim No. |
|-----------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| P,X       | FR 2 907 783 A (TROPHOS SA [FR])<br>2 May 2008 (2008-05-02)<br>cited in the application<br>page 8, line 17 - page 9, line 10<br>page 11, line 23; examples<br>-----                                                            | 11                    |
| A         | US 5 527 807 A (BAKSHI RAMAN K [US] ET AL)<br>18 June 1996 (1996-06-18)<br>column 2, line 54 - column 3, line 48<br>examples<br>-----                                                                                          | 1-11                  |
| A         | BURBIEL J ET AL: "Azasteroids as<br>antifungals"<br>September 2003 (2003-09), STEROIDS,<br>BUTTERWORTH-HEINEMANN, STONEHAM, MA, US,<br>PAGE(S) 587-594 , XP004453284<br>ISSN: 0039-128X<br>the whole document<br>-----<br>-/-- | 1-11                  |

☒ Further documents are listed in the continuation of Box C.

☒ See patent family annex.

\* Special categories of cited documents :

\*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

\*E\* earlier document but published on or after the international filing date

\*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

\*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

\*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

\*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

\*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

\*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

\*Z\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

3 septembre 2009

Date of mailing of the international search report

14/09/2009

Name and mailing address of the ISA/

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Ruckebusch, Virginie

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No

PCT/FR2008/001100

C(Continuation). DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category* | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                                                                                                                                                                         | Relevant to claim No. |
|-----------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| A         | US 5 922 335 A (PTCHELINTSEV DMITRI [US])<br>13 July 1999 (1999-07-13)<br>the whole document                                                                                                                                                                                                                               | 1-11                  |
| A         | EP 1 295 600 A (KADE PHARMA FAB GMBH [DE])<br>26 March 2003 (2003-03-26)<br>page 4, paragraph 29 - page 7, paragraph 40                                                                                                                                                                                                    | 1-11                  |
| A         | KRSTIC ET AL: "Synthesis of some<br>steroidal oximes, lactams, thiolactams and<br>their antitumor activities"<br>STEROIDS, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, NEW<br>YORK, NY, US,<br>vol. 72, no. 5,<br>21 April 2007 (2007-04-21), pages 406-414,<br>XP022041669<br>ISSN: 0039-128X<br>the whole document                      | 1-11                  |
| A         | PRADHAN ET AL: "Unusual Reactions of<br>Steroidal and Non-Steroidal 1,5-Dioximes.<br>Stereochemistry and Mechanism of Formation<br>of N-Hydroxy-Piperidine Analogues"<br>1989, HETEROCYCLES, ELSEVIER SCIENCE<br>PUBLISHERS B.V. AMSTERDAM, NL, PAGE(S)<br>813-839 , XP009083854<br>ISSN: 0385-5414<br>page 835 - page 836 | 1-11                  |

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International application No

PCT/FR2008/001100

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|-------------------------------------------|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| FR 2907783                                | A | 02-05-2008          | WO 2008056059 A2           | 15-05-2008          |
| US 5527807                                | A | 18-06-1996          | AT 158300 T                | 15-10-1997          |
|                                           |   |                     | AU 3869793 A               | 25-11-1993          |
|                                           |   |                     | BG 99177 A                 | 28-07-1995          |
|                                           |   |                     | CA 2096576 A1              | 21-11-1993          |
|                                           |   |                     | CN 1085562 A               | 20-04-1994          |
|                                           |   |                     | CZ 9402838 A3              | 13-09-1995          |
|                                           |   |                     | DE 69313921 D1             | 23-10-1997          |
|                                           |   |                     | DE 69313921 T2             | 09-04-1998          |
|                                           |   |                     | EP 0572165 A1              | 01-12-1993          |
|                                           |   |                     | FI 945442 A                | 18-11-1994          |
|                                           |   |                     | HU 71484 A2                | 28-11-1995          |
|                                           |   |                     | JP 7206759 A               | 08-08-1995          |
|                                           |   |                     | JP 2090261 C               | 02-09-1996          |
|                                           |   |                     | JP 6056881 A               | 01-03-1994          |
|                                           |   |                     | JP 7119232 B               | 20-12-1995          |
|                                           |   |                     | MX 9302931 A1              | 28-02-1994          |
|                                           |   |                     | NO 944406 A                | 19-01-1995          |
|                                           |   |                     | SI 9300270 A               | 31-12-1993          |
|                                           |   |                     | SK 137994 A3               | 12-04-1995          |
|                                           |   |                     | WO 9323419 A1              | 25-11-1993          |
|                                           |   |                     | ZA 9303496 A               | 22-12-1993          |
| US 5922335                                | A | 13-07-1999          | CA 2244535 A1              | 30-01-2000          |
| EP 1295600                                | A | 26-03-2003          | AT 322270 T                | 15-04-2006          |
|                                           |   |                     | CA 2422974 A1              | 21-09-2004          |
|                                           |   |                     | DE 10146541 A1             | 17-04-2003          |
|                                           |   |                     | DK 1295600 T3              | 31-07-2006          |
|                                           |   |                     | ES 2261570 T3              | 16-11-2006          |
|                                           |   |                     | HK 1053603 A1              | 15-09-2006          |
|                                           |   |                     | PT 1295600 E               | 31-08-2006          |
|                                           |   |                     | US 2003109507 A1           | 12-06-2003          |

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale n°  
PCT/FR2008/001100

**A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE**  
INV. A61K8/63 A61Q19/08 A23L1/30 A61K31/58

Selon la classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois selon la classification nationale et la CIB

**B. DOMAINES SUR LESQUELS LA RECHERCHE A PORTE**

Documentation minimale consultée (système de classification suivi des symboles de classement)  
A61K A61Q A61L

Documentation consultée autre que la documentation minimale dans la mesure où ces documents relèvent des domaines sur lesquels a porté la recherche

Base de données électronique consultée au cours de la recherche internationale (nom de la base de données, et si cela est réalisable, termes de recherche utilisés)  
EPO-Internal, BEILSTEIN Data, CHEM ABS Data, BIOSIS, EMBASE, WPI Data

**C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS**

| Catégorie* | Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents                                                                                                                                    | no. des revendications visées |
|------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|
| P,X        | FR 2 907 783 A (TROPHOS SA [FR])<br>2 mai 2008 (2008-05-02)<br>cité dans la demande<br>page 8, ligne 17 - page 9, ligne 10<br>page 11, ligne 23; exemples<br>-----                                                                | 11                            |
| A          | US 5 527 807 A (BAKSHI RAMAN K [US] ET AL)<br>18 juin 1996 (1996-06-18)<br>colonne 2, ligne 54 - colonne 3, ligne 48<br>exemples<br>-----                                                                                         | 1-11                          |
| A          | BURBIEL J ET AL: "Azasteroids as<br>antifungals"<br>septembre 2003 (2003-09), STEROIDS,<br>BUTTERWORTH-HEINEMANN, STONEHAM, MA, US,<br>PAGE(S) 587-594 , XP004453284<br>ISSN: 0039-128X<br>le document en entier<br>-----<br>-/-- | 1-11                          |

☒ Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents

☒ Les documents de familles de brevets sont indiqués en annexe

\* Catégories spéciales de documents cités:

- \*A\* document définissant l'état général de la technique, non considéré comme particulièrement pertinent
- \*E\* document antérieur, mais publié à la date de dépôt international ou après cette date
- \*L\* document pouvant jeter un doute sur une revendication de priorité ou cité pour déterminer la date de publication d'une autre citation ou pour une raison spéciale (telle qu'indiquée)
- \*O\* document se référant à une divulgation orale, à un usage, à une exposition ou tous autres moyens
- \*P\* document publié avant la date de dépôt international, mais postérieurement à la date de priorité revendiquée

- \*T\* document ultérieur publié après la date de dépôt international ou la date de priorité et n'appartenant pas à l'état de la technique pertinent, mais cité pour comprendre le principe ou la théorie constituant la base de l'invention
- \*X\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément
- \*Y\* document particulièrement pertinent; l'invention revendiquée ne peut être considérée comme impliquant une activité inventive lorsque le document est associé à un ou plusieurs autres documents de même nature, cette combinaison étant évidente pour une personne du métier
- \*&\* document qui fait partie de la même famille de brevets

Date à laquelle la recherche internationale a été effectivement achevée

3 septembre 2009

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

14/09/2009

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale  
Office Européen des Brevets, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Ruckebusch, Virginie

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale n°

PCT/FR2008/001100

## C(suite). DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

| Catégorie* | Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents                                                                                                                                                                                                                                      | no. des revendications visées |
|------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------|
| A          | US 5 922 335 A (PTCHELINTSEV DMITRI [US])<br>13 juillet 1999 (1999-07-13)<br>le document en entier<br>-----                                                                                                                                                                                                                         | 1-11                          |
| A          | EP 1 295 600 A (KADE PHARMA FAB GMBH [DE])<br>26 mars 2003 (2003-03-26)<br>page 4, alinéa 29 - page 7, alinéa 40<br>-----                                                                                                                                                                                                           | 1-11                          |
| A          | KRSTIC ET AL: "Synthesis of some<br>steroidal oximes, lactams, thiolactams and<br>their antitumor activities"<br>STEROIDS, ELSEVIER SCIENCE PUBLISHERS, NEW<br>YORK, NY, US,<br>vol. 72, no. 5,<br>21 avril 2007 (2007-04-21), pages 406-414,<br>XP022041669<br>ISSN: 0039-128X<br>le document en entier<br>-----                   | 1-11                          |
| A          | PRADHAN ET AL: "Unusual Reactions of<br>Steroidal and Non-Steroidal 1,5-Dioximes.<br>Stereochemistry and Mechanism of Formation<br>of N-Hydroxy-Piperidine Analogues"<br>1989, HETEROCYCLES, ELSEVIER SCIENCE<br>PUBLISHERS B.V. AMSTERDAM, NL, PAGE(S)<br>813-839 , XP009083854<br>ISSN: 0385-5414<br>page 835 - page 836<br>----- | 1-11                          |

# RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Renseignements relatifs aux membres de familles de brevets

Demande Internationale n°

PCT/FR2008/001100

| Document brevet cité<br>au rapport de recherche |   | Date de<br>publication | Membre(s) de la<br>famille de brevet(s) | Date de<br>publication |
|-------------------------------------------------|---|------------------------|-----------------------------------------|------------------------|
| FR 2907783                                      | A | 02-05-2008             | WO 2008056059 A2                        | 15-05-2008             |
| US 5527807                                      | A | 18-06-1996             | AT 158300 T                             | 15-10-1997             |
|                                                 |   |                        | AU 3869793 A                            | 25-11-1993             |
|                                                 |   |                        | BG 99177 A                              | 28-07-1995             |
|                                                 |   |                        | CA 2096576 A1                           | 21-11-1993             |
|                                                 |   |                        | CN 1085562 A                            | 20-04-1994             |
|                                                 |   |                        | CZ 9402838 A3                           | 13-09-1995             |
|                                                 |   |                        | DE 69313921 D1                          | 23-10-1997             |
|                                                 |   |                        | DE 69313921 T2                          | 09-04-1998             |
|                                                 |   |                        | EP 0572165 A1                           | 01-12-1993             |
|                                                 |   |                        | FI 945442 A                             | 18-11-1994             |
|                                                 |   |                        | HU 71484 A2                             | 28-11-1995             |
|                                                 |   |                        | JP 7206759 A                            | 08-08-1995             |
|                                                 |   |                        | JP 2090261 C                            | 02-09-1996             |
|                                                 |   |                        | JP 6056881 A                            | 01-03-1994             |
|                                                 |   |                        | JP 7119232 B                            | 20-12-1995             |
|                                                 |   |                        | MX 9302931 A1                           | 28-02-1994             |
|                                                 |   |                        | NO 944406 A                             | 19-01-1995             |
|                                                 |   |                        | SI 9300270 A                            | 31-12-1993             |
|                                                 |   |                        | SK 137994 A3                            | 12-04-1995             |
|                                                 |   |                        | WO 9323419 A1                           | 25-11-1993             |
|                                                 |   |                        | ZA 9303496 A                            | 22-12-1993             |
| US 5922335                                      | A | 13-07-1999             | CA 2244535 A1                           | 30-01-2000             |
| EP 1295600                                      | A | 26-03-2003             | AT 322270 T                             | 15-04-2006             |
|                                                 |   |                        | CA 2422974 A1                           | 21-09-2004             |
|                                                 |   |                        | DE 10146541 A1                          | 17-04-2003             |
|                                                 |   |                        | DK 1295600 T3                           | 31-07-2006             |
|                                                 |   |                        | ES 2261570 T3                           | 16-11-2006             |
|                                                 |   |                        | HK 1053603 A1                           | 15-09-2006             |
|                                                 |   |                        | PT 1295600 E                            | 31-08-2006             |
|                                                 |   |                        | US 2003109507 A1                        | 12-06-2003             |