

(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
7 août 2003 (07.08.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2003/064458 A3

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C07K 14/685, A61K 7/42, 38/34, A61P 17/00

Anne-Marie [FR/FR]; Résidence Le Galoubet, 1, rue
Raymond Delmotte, F-31400 Toulouse (FR).

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2003/000300

(74) Mandataires : **MARTIN, Jean-Jacques.** etc.; Cabinet
Regimbeau, 20 rue de Chazelles, F-75847 Paris Cedex 17
(FR).

(22) Date de dépôt international :
31 janvier 2003 (31.01.2003)

(81) États désignés (national) : AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ,
BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ,
DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM,
HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK,
LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG,
SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,
VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02/01202 1 février 2002 (01.02.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : IN-
STITUT EUROPEEN DE BIOLOGIE CELLULAIRE
[FR/FR]; 18, avenue de l'Europe, F-31520 Ramonville-St-
Agne (FR).

(84) États désignés (régional) : brevet ARIPO (GH, GM, KE,
LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), brevet
eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet
européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,
FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SI, SK, TR),
brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(72) Inventeur; et

(75) Inventeur/Déposant (pour US seulement) : PINEL,

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: NOVEL PEPTIDE DERIVATIVES, PREPARATION AND THERAPEUTIC AND COSMETIC APPLICATION THEREOF

(54) Titre : DERIVES PEPTIDIQUES, LEUR PREPARATION ET LEUR APPLICATION THERAPEUTIQUE ET COSMETIQUE



Control α -MSH Peptide 1

(57) Abstract: The invention relates to peptides of formula (1) R-V¹-Ala²-His³-X⁴-Y⁵-Trp⁵-NH₂ wherein R represents a hydrogen atom or a protective group which can be chosen from among a benzoyl group, a tosyl group, a benzene sulfonyl group, a benzyloxycarbonyl group or a pyridinepropionyl group; V represents a natural amino acid or not chosen from among norleucine, norvaline and 2-N-Me-norleucine, X represents a natural amino acid or not having an aromatic character chosen from among phenylalanine, 1-naphtylalanine, 2-naphtylalanine, phenylglycine, benzothienylalanine, 4,4'-biphenylalanine, 3,3-diphenylalanine, homophenylalanine, indanylglycine, 4-methylphenylalanine, thienylalanine, p-nitrophenylalanine, halogenophenylalanine of configuration L or D; Y represents a natural amino acid of configuration L, having a basic character chosen from among arginine, lysine or ornithine, the enantiomers or diastereoisomers, and the mixtures thereof, including racemic mixtures. The invention also relates to a method for the preparation and application thereof in the field of therapeutics or cosmetics.

(57) Abrégé : L'invention concerne des Peptide répondant à la formule (1) R-V¹-Ala²-His³-X⁴-Y⁵-Trp⁵-NH₂ (1) dans laquelle R représente un atome d'hydrogène ou un groupe protecteur pouvant être choisi parmi un groupe acétyle, un groupe benzoyle, un groupe tosyl, un groupe benzène sulfonyle, un groupe benzyloxycarbonyle ou un groupe pyridinepropionyle; V représente un acide aminé naturel ou non choisi parmi la norleucine, la norvaline et la 2-N-Me-norleucine, X représente un acide aminé naturel ou non à caractère aromatique choisi parmi phénylalanine, 1-naphtylalanine, 2-naphtylalanine, phénylglycine, benzothiénylalanine, 4,4'-biphénylalanine, 3,3-diphénylalanine, homophénylalanine, indanylglycine, 4-méthylphénylalanine, thiénylalanine, p-nitrophénylalanine, halogénophénylalanine de configuration L ou D; Y représente un acide aminé naturel de configuration L, à caractère basique choisi parmi arginine, lysine ou ornithine, leurs énantiomères ou diastéréoisomères, ainsi que leurs mélanges, y compris les mélanges racémiques. Procédé de préparation et application en thérapeutique et en cosmétique.

WO 2003/064458 A3



Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

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

25 mars 2004

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/FR 03/00300

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 C07K14/685 A61K7/42 A61K38/34 A61P17/00

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)
IPC 7 C07K A61K

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, CHEM ABS Data, WPI Data

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 01 90140 A (QUADRANT HEALTHCARE UK LTD ;ADAN ROGER ANTONIUS HENRICUS (NL); KRU) 29 November 2001 (2001-11-29) claims; examples ---	1,5,6
A	WO 99 54358 A (QUADRANT HOLDINGS CAMBRIDGE ;GISPEN WILLEM HENDRIK (NL); ADAN ROGE) 28 October 1999 (1999-10-28) claims; examples ---	1,5,6
A	FR 2 753 707 A (RECH DE PATHOLOGIE APPLIQUEE S) 27 March 1998 (1998-03-27) claims; examples -----	1,5,6

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in 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.
- *&* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

Date of mailing of the international search report

1 October 2003

22/10/2003

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fuhr, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No. ...
PCT/FR 03/00300

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 0190140	A	29-11-2001	AU	5860101 A		03-12-2001
			WO	0190140 A1		29-11-2001
WO 9954358	A	28-10-1999	AU	3615599 A		08-11-1999
			WO	9954358 A1		28-10-1999
FR 2753707	A	27-03-1998	FR	2753707 A1		27-03-1998
			AU	4388397 A		14-04-1998
			WO	9812212 A1		26-03-1998

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No

PCT/FR 03/00300

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE

CIB 7 C07K14/685 A61K7/42 A61K38/34 A61P17/00

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)

CIB 7 C07K A61K

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 réalisable, termes de recherche utilisés)

EPO-Internal, CHEM ABS Data, 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
A	WO 01 90140 A (QUADRANT HEALTHCARE UK LTD ;ADAN ROGER ANTONIUS HENRICUS (NL); KRU) 29 novembre 2001 (2001-11-29) revendications; exemples ---	1,5,6
A	WO 99 54358 A (QUADRANT HOLDINGS CAMBRIDGE ;GISPEN WILLEM HENDRIK (NL); ADAN ROGE) 28 octobre 1999 (1999-10-28) revendications; exemples ---	1,5,6
A	FR 2 753 707 A (RECH DE PATHOLOGIE APPLIQUEE S) 27 mars 1998 (1998-03-27) revendications; exemples -----	1,5,6

 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

1 octobre 2003

Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale

22/10/2003

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, Tx. 31 651 epo nl,
 Fax: (+31-70) 340-3016

Fonctionnaire autorisé

Fuhr, C

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No.
PCT/FR 03/00300

Document brevet cité au rapport de recherche		Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)		Date de publication
WO 0190140	A	29-11-2001	AU	5860101 A	03-12-2001
			WO	0190140 A1	29-11-2001
WO 9954358	A	28-10-1999	AU	3615599 A	08-11-1999
			WO	9954358 A1	28-10-1999
FR 2753707	A	27-03-1998	FR	2753707 A1	27-03-1998
			AU	4388397 A	14-04-1998
			WO	9812212 A1	26-03-1998