PCT ORGANISATION MONDIALE DE LA PROPRIETE INTELLECTUELLE
Bureau international

DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIEE EN VERTU DU TRAITE DE COOPERATION EN MATIERE DE BREVETS (PCT)

(51) Classification internationale des brevets 6 :	A3	(11) Numéro de publication internationale:	WO 99/15147
A61K 31/70, 7/48		(43) Date de publication internationale:	1er avril 1999 (01.04.99)

(21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR98/02028

(22) Date de dépôt international: 22 septembre 1998 (22.09.98)

(30) Données relatives à la priorité:
97/11766 22 septembre 1997 (22.09.97) FR

(71) Déposant *(pour tous les Etats désignés sauf US)*: ULICE [FR/FR]; ZAC des Portes de Riom, F–63200 Riom (FR).

(72) Inventeurs; et
(75) Inventeurs/Déposants *(US seulement)*: BOUSQUET, Marie Pierre [FR/FR]; 60, boulevard de l'Embouchure, F–31200 Toulouse (FR). WILLEMONT, René–Marc [FR/FR]; 3, résidence Casteltrompette, F–31450 Pompertuzat (FR). MONSAN, Pierre [FR/FR]; Renoufail, Chemin de la Gravette, F–31700 Mondonville (FR). BOURES, Emmanuel [FR/FR]; 35, rue Eugène Gilbert, F–63000 Clermont–Ferrand (FR). MESSAGER, Arnaud [FR/FR]; 9, rue Soubrany, F–63200 Riom (FR).

(74) Mandataire: CABINET DE BOISSE ET COLAS; 37, avenue Franklin D. Roosevelt, F–75008 Paris (FR).

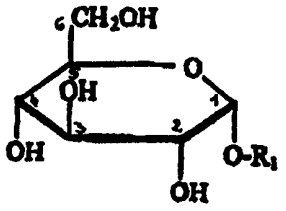
(81) Etats désignés: AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CU, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZW, brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SZ, UG, ZW), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée
Avec rapport de recherche internationale.

(88) Date de publication du rapport de recherche internationale:
7 octobre 1999 (07.10.99)

(54) Title: USE OF ALKYLMONOGLUCOSIDES AS MOLECULAR VECTORS

(54) Titre: UTILISATION D'ALKYL MONOGLUCOSIDES EN TANT QUE VECTEURS MOLECULAIRES



(I)

(57) Abstract

The invention concerns the use as molecular vector in pharmaceutical, cosmetic and food products of alkylmonoglucosides of general formula (I) in which R_1 is a linear or branched C_2–C_{18} alkyl radical.

(57) Abrégé

L'invention concerne l'utilisation comme vecteur moléculaire en pharmacie, cosmétique et alimentaire d'alkylmonoglucosides ayant la formule générale (I) dans laquelle R_1 est un radical alkyle, linéaire ou ramifié en C_2 à C_{18}.

UNIQUEMENT A TITRE D'INFORMATION

Codes utilisés pour identifier les Etats parties au PCT, sur les pages de couverture des brochures publiant des demandes internationales en vertu du PCT.

AL	Albanie	**ES**	Espagne	**LS**	Lesotho	**SI**	Slovénie
AM	Arménie	**FI**	Finlande	**LT**	Lituanie	**SK**	Slovaquie
AT	Autriche	**FR**	France	**LU**	Luxembourg	**SN**	Sénégal
AU	Australie	**GA**	Gabon	**LV**	Lettonie	**SZ**	Swaziland
AZ	Azerbaïdjan	**GB**	Royaume-Uni	**MC**	Monaco	**TD**	Tchad
BA	Bosnie-Herzégovine	**GE**	Géorgie	**MD**	République de Moldova	**TG**	Togo
BB	Barbade	**GH**	Ghana	**MG**	Madagascar	**TJ**	Tadjikistan
BE	Belgique	**GN**	Guinée	**MK**	Ex-République yougoslave de Macédoine	**TM**	Turkménistan
BF	Burkina Faso	**GR**	Grèce			**TR**	Turquie
BG	Bulgarie	**HU**	Hongrie	**ML**	Mali	**TT**	Trinité-et-Tobago
BJ	Bénin	**IE**	Irlande	**MN**	Mongolie	**UA**	Ukraine
BR	Brésil	**IL**	Israël	**MR**	Mauritanie	**UG**	Ouganda
BY	Bélarus	**IS**	Islande	**MW**	Malawi	**US**	Etats-Unis d'Amérique
CA	Canada	**IT**	Italie	**MX**	Mexique	**UZ**	Ouzbékistan
CF	République centrafricaine	**JP**	Japon	**NE**	Niger	**VN**	Viet Nam
CG	Congo	**KE**	Kenya	**NL**	Pays-Bas	**YU**	Yougoslavie
CH	Suisse	**KG**	Kirghizistan	**NO**	Norvège	**ZW**	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	**KP**	République populaire démocratique de Corée	**NZ**	Nouvelle-Zélande		
CM	Cameroun			**PL**	Pologne		
CN	Chine	**KR**	République de Corée	**PT**	Portugal		
CU	Cuba	**KZ**	Kazakstan	**RO**	Roumanie		
CZ	République tchèque	**LC**	Sainte-Lucie	**RU**	Fédération de Russie		
DE	Allemagne	**LI**	Liechtenstein	**SD**	Soudan		
DK	Danemark	**LK**	Sri Lanka	**SE**	Suède		
EE	Estonie	**LR**	Libéria	**SG**	Singapour		

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interna .ial Application No
PCT/FR 98/02028

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 6 A61K31/70 A61K7/48

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 6 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)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 342 (C-1076), 29 June 1993 & JP 05 043428 A (LION CORP), 23 February 1993 see abstract ---	1-6
X	WO 95 14705 A (BIOEUROPE) 1 June 1995 see page -; claims ---	1-6
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 013, no. 011 (C-558), 11 January 1989 & JP 63 218631 A (SEKISUI CHEM CO LTD), 12 September 1988 see abstract --- -/--	1,2

[X] Further documents are listed in the continuation of box C.

[X] 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
25 November 1998	- 7. 06. 99

Name and mailing address of the ISA	Authorized officer
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	ORVIZ DIAZ P.

1

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/FR 98/02028

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category °	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	T. HALMOS: "Synthesis of glucose-chlorambucil derivatives and their recognition by the human GLUT1 glucose transporter" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=126:176810, XP002069798 see abstract & EUR. J. PHARMACOL. (1996), 318(2/3), 477-484, ---	3,5
T	H. NISHIO: "Hydantoin-containing glycosides, UV absorbents, and skin preparations containing them" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=128:26765, XP002069799 see abstract & JP 09 278788 A (KANEBO, LTD.) ---	1-6
T	T. IKEMOTO: "Preparation of cinnamic acid alkyl glycoside esters, ultraviolet ray absorbent and skin topical application" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=127:331692, XP002069800 see abstract & JP 09 268194 A (KANEBO, LTD.) -----	1-6

1

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/FR 98/ 02028

Box I Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 1 of first sheet)

This international search report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos.:
because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:

2. ☐ Claims Nos.:
because they relate to parts of the international application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful international search can be carried out, specifically:

3. ☐ Claims Nos.:
because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a).

Box II Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 2 of first sheet)

This International Searching Authority found multiple inventions in this international application, as follows:

see additional sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers all searchable claims.

2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.

3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this international search report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos.:

4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this international search report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.:

1-6

Remark on Protest

☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest.

☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

1. Claims 1-6 Use as molecular vector of an alpha-alkylmonoglucopyranoside. Use of an alkylmonoglucoside for grafting on active compounds. Method for preparing an active compound vectored by esterification of an alkylmonoglucoside.

2. Claim 7 Use of fatty acids esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

3. Claim 8 (partially) Use of retinol derivatives esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

4. Claim 8 (partially) Use of ascorbic acid derivatives esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

5. Claim 8 (partially) Use of tocopherol derivatives esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

6. Claim 8 (partially) Use of vitamin D derivatives esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

7. Claim 8 (partially) Use of an amino acid or a peptide esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

8. Claims 9, 10 Use of polyphenol derivatives esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

9. Claim 11 Use of alpha-hydroxy acids esterified in position 6 of an alpha-alkylmonoglucopyranoside.

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Interna tio nal Application No
PCT/FR 98/02028

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
WO 9514705 A	01-06-1995	FR 2712888 A	02-06-1995

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No
PCT/FR 98/02028

A. CLASSEMENT DE L'OBJET DE LA DEMANDE
CIB 6 A61K31/70 A61K7/48

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 6 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)

C. DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie °	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 017, no. 342 (C-1076), 29 juin 1993 & JP 05 043428 A (LION CORP), 23 février 1993 voir abrégé ---	1-6
X	WO 95 14705 A (BIOEUROPE) 1 juin 1995 voir page -; revendications ---	1-6
X	PATENT ABSTRACTS OF JAPAN vol. 013, no. 011 (C-558), 11 janvier 1989 & JP 63 218631 A (SEKISUI CHEM CO LTD), 12 septembre 1988 voir abrégé --- -/--	1,2

[X] Voir la suite du cadre C pour la fin de la liste des documents

[X] 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'inven tion revendiquée ne peut être considérée comme nouvelle ou comme impliquant une activité inventive par rapport au document considéré isolément

"Y" document particulièrement pertinent; l'inven tion 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	Date d'expédition du présent rapport de recherche internationale
25 novembre 1998	7. 06. 99

Nom et adresse postale de l'administration chargée de la recherche internationale	Fonctionnaire autorisé
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	ORVIZ DIAZ P.

1

Formulaire PCT/ISA/210 (deuxième feuille) (juillet 1992)

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demar nternationale No
PCT/FR 98/02028

C.(suite) DOCUMENTS CONSIDERES COMME PERTINENTS

Catégorie °	Identification des documents cités, avec, le cas échéant, l'indication des passages pertinents	no. des revendications visées
X	T. HALMOS: "Synthesis of glucose-chlorambucil derivatives and their recognition by the human GLUT1 glucose transporter" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=126:176810, XP002069798 voir abrégé & EUR. J. PHARMACOL. (1996), 318(2/3), 477-484, ---	3,5
T	H. NISHIO: "Hydantoin-containing glycosides, UV absorbents, and skin preparations containing them" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=128:26765, XP002069799 voir abrégé & JP 09 278788 A (KANEBO, LTD.) ---	1-6
T	T. IKEMOTO: "Preparation of cinnamic acid alkyl glycoside esters, ultraviolet ray absorbent and skin topical application" STN INTERNATIONAL, KARLSRUHE, FILE CHEMICAL ABSTRACTS, AN=127:331692, XP002069800 voir abrégé & JP 09 268194 A (KANEBO, LTD.) -----	1-6

1

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

De .de internationale n°
PCT/FR 98/02028

Cadre I Observations - lorsqu'il a été estimé que certaines revendications ne pouvaient pas faire l'objet d'une recherche (suite du point 1 de la première feuille)

Conformément à l'article 17.2)a), certaines revendications n'ont pas fait l'objet d'une recherche pour les motifs suivants:

1. ☐ Les revendications n^{os} se rapportent à un objet à l'égard duquel l'administration n'est pas tenue de procéder à la recherche, à savoir:

2. ☐ Les revendications n^{os} se rapportent à des parties de la demande internationale qui ne remplissent pas suffisamment les conditions prescrites pour qu'une recherche significative puisse être effectuée, en particulier:

3. ☐ Les revendications n^{os} sont des revendications dépendantes et ne sont pas rédigées conformément aux dispositions de la deuxième et de la troisième phrases de la règle 6.4.a).

Cadre II Observations - lorsqu'il y a absence d'unité de l'invention (suite du point 2 de la première feuille)

L'administration chargée de la recherche internationale a trouvé plusieurs inventions dans la demande internationale, à savoir:

voir feuille additionelle

1. ☐ Comme toutes les taxes additionnelles ont été payées dans les délais par le déposant, le présent rapport de recherche internationale porte sur toutes les revendications pouvant faire l'objet d'une recherche.

2. ☐ Comme toutes les recherches portant sur les revendications qui s'y prêtaient ont pu être effectuées sans effort particulier justifiant une taxe additionnelle, l'administration n'a sollicité le paiement d'aucune taxe de cette nature.

3. ☐ Comme une partie seulement des taxes additionnelles demandées a été payée dans les délais par le déposant, le présent rapport de recherche internationale ne porte que sur les revendications pour lesquelles les taxes ont été payées, à savoir les revendications n^{os}

4. ☒ Aucune taxe additionnelle demandée n'a été payée dans les délais par le déposant. En conséquence, le présent rapport de recherche internationale ne porte que sur l'invention mentionnée en premier lieu dans les revendications; elle est couverte par les revendications n^{os}

1-6

Remarque quant à la réserve

☐ Les taxes additionnelles étaient accompagnées d'une réserve de la part du déposant.

☐ Le paiement des taxes additionnelles n'était assorti d'aucune réserve.

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No. PCT/ FR 98/02028

SUITE DES RENSEIGNEMENTS INDIQUES SUR PCT/ISA/ 210

1. revendications 1-6	Utilisation comme vecteur moléculaire d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside. Utilisation d'un alkymonoglucoside pour le greffage sur des actifs. Procédé de préparation d'un composé actif vectorisé par estérification dΛun alkylmonoglucoside.
2. revendication 7	Utilisation d'acides gras esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
3. revendication 8 (partiellement)	Utilisation de dérivés du rétinol esterifiés en positions 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
4. revendication 8 (partiellement)	Utilisation de dérivés de l'acide ascorbique esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
5. revendication 8 (partiellement)	Utilisation de dérivés du tocophérol esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
6. revendication 8 (partiellement)	Utilisation de dérivés des vitamines D esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
7. revendication 8 (partiellement)	Utilisation d'un acide aminé ou d'un peptide esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
8. revendications 9,10	Utilisation de dérivés de polyphénols esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.
9. recendication 11	Utilisation d'alpha hydroxy acides esterifiés en position 6 d'un alpha-alkylmonoglucopyranoside.

RAPPORT DE RECHERCHE INTERNATIONALE

Demande internationale No
PCT/FR 98/02028

Document brevet cité au rapport de recherche	Date de publication	Membre(s) de la famille de brevet(s)	Date de publication
WO 9514705 A	01-06-1995	FR 2712888 A	02-06-1995