(E) 9705317-7

02/03/98

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 : C07D 491/22, A61K 31/47, C07D 471/14, 491/04, 213/64, 213/61 // (C07D 491/22, 313:00, 221:00, 221:00, 209:00) (C07D 471/14, 221:00, 221:00, 209:00) (C07D 491/04, 313:00, 221:00)

A1

(11) Numéro de publication internationale: **WO 97/00876**

(43) Date de publication internationale: 9 janvier 1997 (09.01.97)

(21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR96/00980

(22) Date de dépôt international: 21 juin 1996 (21.06.96)

(30) Données relatives à la priorité:

9512670.2	21 juin 1995 (21.06.95)	GB
08/610,476	4 mars 1996 (04.03.96)	US

(71) Déposant *(pour tous les Etats désignés sauf US)*: SOCIETE DE CONSEILS DE RECHERCHES ET D'APPLICATIONS SCIENTIFIQUES (SCRAS) [FR/FR]; 51/53, rue du Docteur-Blanche, F-75016 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(US seulement)*: BIGG, Dennis [FR/FR]; 8, rue Neuve, F-91190 Gif-sur-Yvette (FR). LAVERGNE, Olivier [FR/FR]; 6, rue des Anglais, F-91300 Massy (FR). PLA RODAS, Francesc [ES/ES]; 55, rue Camprodon, E-17430 Santa Coloma de Farners (ES). POMMIER, Jacques [FR/FR]; 93/95, avenue Henri-Barbusse, F-92700 Colombes (FR). ULIBARRI, Gérard [FR/FR]; 20, rue du Royaume, F-91440 Bures-sur-Yvette (FR).

(74) Mandataire: BOURGOUIN, André; Société de Conseils Administratifs et Financiers (SCAF), Service Brevets & Marques, 24, rue Erlanger, F-75781 Paris Cédex 16 (FR).

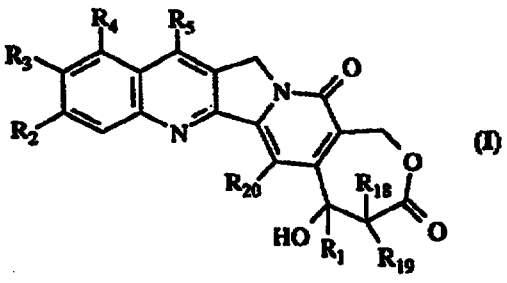
(81) Etats désignés: AL, AM, AT, AU, AZ, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, GB, GE, HU, IL, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, brevet ARIPO (KE, LS, MW, SD, SZ, UG),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

Publiée

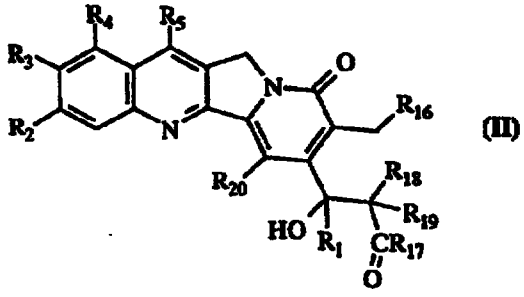
Avec rapport de recherche internationale.

(54) Title: NOVEL CAMPTOTHECIN ANALOGUES, PREPARATION METHODS THEREFOR, USE THEREOF AS DRUGS, AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAID ANALOGUES

(54) Titre: NOUVEAUX ANALOGUES DE LA CAMPTOTHECINE, DES PROCEDES DE PREPARATION, LEUR APPLICATION COMME MEDICAMENTS ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES LES CONTENANT



(I)



(II)

(57) Abstract

A camptothecin analogue characterised in that the hydroxy lactone of the camptothecin is a β-hydroxy lactone or the corresponding β-hydroxyacid, resulting from the opening of said lactone, or a derivative of said β-hydroxyacid, or a pharmaceutically acceptable salt thereof, is disclosed. In particular, compounds of formulae (I) and (II) are disclosed. Methods for preparing the compounds of formulae (I) and (II), pharmaceutical compositions containing said compounds, and their use, particularly as topoisomerase inhibitors and antitumoral drugs, are also disclosed.

(57) Abrégé

L'invention concerne un analogue de la camptothécine, caractérisé en ce que l'hydroxy lactone de la camptothécine est une β-hydroxy lactone ou le β-hydroxy acide correspondant, résultant de l'ouverture de cette lactone, ou un dérivé de ce β-hydroxy acide, ou un sel pharmaceutiquement acceptable de ces derniers, et en particulier des composés de formule générale (I) et (II). L'invention concerne également des procédés de préparation des composés de formule (I) et (II) ci-dessus, des compositions pharmaceutiques les contenant et leur utilisation notamment en tant qu'inhibiteurs de topoisomérase et anti-tumoraux.

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.

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