10 JAN 2003

2003005287

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

(19) Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle
Bureau international

*162162*

(43) Date de la publication internationale
24 janvier 2002 (24.01.2002)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 02/06324 A3

(51) Classification internationale des brevets[7] : C07K 14/435, C12N 15/12, 15/82, A61K 38/17, A61P 31/00

(21) Numéro de la demande internationale : PCT/FR01/02164

(22) Date de dépôt international : 5 juillet 2001 (05.07.2001)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
00/09248 13 juillet 2000 (13.07.2000) FR
00/11949 19 septembre 2000 (19.09.2000) FR

(71) Déposant *(pour tous les États désignés sauf US)* : ENTOMED (S.A.) [FR/FR]; Rue Tobias Stimmer, F-67400 Illkirch (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(pour US seulement)* : DIMARCQ, Jean-Luc [FR/FR]; 24, rue de Bruxelles, F-67000 Strasbourg (FR). LEGRAIN, Michèle [FR/FR]; 30, bas Village, F-67140 Stotzheim (FR). MENIN, Laure [/CH]; 19, chemin de l'Epi d'Or, CH-1053 Cugy (VD) (CH).

(74) Mandataires : BREESE, Pierre etc.; Breese-Majerowicz, 3, avenue de l'Opéra, F-75001 Paris (FR).

(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, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(84) États désignés *(régional)* : brevet ARIPO (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, 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, TR), 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: 23 mai 2002

*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.*

(54) **Title:** ANTIFUNGAL AND/OR ANTIBACTERIAL PEPTIDES, PREPARATION METHODS AND COMPOSITION CONTAINING SAME

(54) **Titre :** PEPTIDES ANTIFONGIQUES ET/OU ANTIBACTERIENS, LEURS PREPARATIONS ET LES COMPOSITIONS LES CONTENANT

(57) **Abstract:** The invention concerns peptides derived from heliomicine by substitution of one or several amino acids, characterised in that said peptides correspond to formula (I): $X_1$, $X_2$, $X_3$, $X_4$, $X_5$, $X_6$, $C_7$, $X_8$, $X_9$, $X_{10}$, $X_{11}$, $X_{12}$, $X_{13}$, $X_{14}$, $X_{15}$, $X_{16}$, $X_{17}$, $C_{18}$, $X_{19}$, $X_{20}$, $X_{21}$, $C_{22}$ $X_{23}$, $X_{24}$, $X_{25}$, $X_{26}$, $X_{27}$, $X_{28}$, $X_{29}$, $X_{30}$, $X_{31}$, $X_{32}$, $X_{33}$, $X_{34}$, $X_{35}$, $X_{36}$, $X_{37}$, $X_{38}$, $X_{39}$, $C_{40}$, $X_{41}$, $C_{42}$, $X_{43}$, $X_{44}$ wherein: $X_1$, $X_{17}$, $X_{21}$ $X_{43}$ are amino acids; $X_{16}$, $X_{44}$ are small polar amino acids; $X_{19}$ is a large polar amino acid; $X_{36}$ is a small or lightly hydrophobic amino acid; $X_{38}$ is a lightly hydrophobic or small amino acid; said substitutions being such that: at least one of $X_1$, $X_{17}$, $X_{21}$, $X_{43}$ is a basic or polar, advantageously large polar amino acid, and/or at least one of the amino acids $X_{16}$, $X_{44}$ is a basic amino acid or a large polar amino acid, and/or $X_{19}$ is a basic amino acid, and/or at least one of the amino acids $X_{36}$, $X_{38}$ is a strongly hydrophobic amino acid. The invention also concerns antifungal and/or antibacterial compositions comprising at least one of said peptides.

(57) **Abrégé :** La présente invention concerne des peptides dérivés de l'héliomicine par substitution de un à plusieurs acides aminés, caractérisé en ce que lesdits peptides répondent à la formule (I): $X_1$, $X_2$, $X_3$, $X_4$, $X_5$, $X_6$, $X_7$, $X_8$, $X_9$, $X_{10}$, $X_{11}$, $X_{12}$, $X_{13}$, $X_{14}$, $X_{15}$, $X_{16}$, $X_{17}$, $X_{18}$, $X_{19}$, $X_{20}$, $X_{21}$, $X_{22}$, $X_{23}$, $X_{24}$, $X_{25}$, $X_{26}$, $X_{27}$, $X_{28}$, $X_{29}$, $X_{30}$, $X_{31}$, $X_{32}$, $X_{33}$, $X_{34}$, $X_{35}$, $X_{36}$, $X_{37}$, $X_{38}$, $X_{39}$, $X_{40}$, $X_{41}$, $X_{42}$, $X_{43}$, $X_{44}$, dans laquelle: $X_1$, $X_{17}$, $X_{43}$ sont des acides aminés acides, $X_{16}$, $X_{44}$ sont des acides aminés polaires petits, $X_{19}$ est un acide aminé polaire large, $X_{36}$ est un acide aminé petit ou faiblement hydrophobe $X_{38}$ est un acide aminé faiblement hydrophobe ou petit, lesdites substitutions étant telles que: l'un au moins des $X_1$, $X_{17}$, $X_{21}$, $X_{43}$ est un acide aminé basique ou polaire avantageusement polaire large, et/ou l'un au moins des acides aminés $X_{16}$, $X_{44}$ est un acide aminé basique ou un acide aminé polaire large, et/ou $X_{19}$ est un acide aminé basique, et/ou l'un au moins des acides aminés $X_{36}$, $X_{38}$ est un acide aminé fortement hydrophobe. L'invention concerne aussi des compositions antifongiques et/ou antimicrobiennes comprenant au moins un desdits peptides.

WO 02/06324 A3

*ACTION*