

(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
18 décembre 2003 (18.12.2003)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 03/104303 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
C08G 69/10, A61K 47/34, 47/42, 9/51, C08G 69/48

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR03/50003

(22) Date de dépôt international : 3 juin 2003 (03.06.2003)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
02 07008 7 juin 2002 (07.06.2002) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) :
FLAMEL TECHNOLOGIES [FR/FR]; 33 avenue du
Docteur Georges Lévy, F-69200 VENISSIEUX (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : CHAN,
You-Ping [FR/FR]; 14 bd Jean XXIII, F-69008 LYON
(FR). ANGOT, Stéphanie [FR/FR]; 123 bis cours Al-
bert Thomas, F-69003 LYON (FR). BREYNE, Olivier
[FR/FR]; 5 rue Rosset, F-69004 LYON (FR).

(74) Mandataires : CABINET PLASSERAUD etc.; 84 rue
d'Amsterdam, F-75440 PARIS CEDEX 09 (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, NI, 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.

(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, RO, SE, SI, SK,
TR), brevet OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ,
GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

- avec rapport de recherche internationale
- avant l'expiration du délai prévu pour la modification des
revendications, sera republiée si des modifications sont re-
çues

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

(54) Title: POLYAMINOACIDS FUNCTIONALIZED BY ALPHA TOCOPHEROL AND USES THEREOF, PARTICULAR FOR
THERAPEUTIC APPLICATIONS

(54) Titre : POLYAMINOACIDES FONCTIONNALISÉS PAR DE L'ALPHA-TOCOPHEROL ET LEURS APPLICATIONS NO-
TAMMENT THÉRAPEUTIQUES

(57) Abstract: The invention concerns novel biodegradable polyaminoacid materials, useful in particular for vectoring active
principle(s). The invention also concerns novel pharmaceutical, cosmetic, dietetic or phytosanitary compositions based on said
polyaminoacids. The invention aims at providing a novel polymer raw material, capable of being used for vectoring active
principles and enabling optimal fulfillment of all specified requirements: biocompatibility, biodegradability, easy and inexpensive
transformation into particles vectoring active principles, said particles being themselves capable of forming colloidal suspensions,
of being easily associated with numerous active principles, and of releasing said active principles in vivo. Therefor, the present
invention concerns first of all amphiphilic polyaminoacids comprising aspartic acid units and/or glutamic acid units, characterized in
that at least part of said units carry grafts including at least one alpha-tocopherol motif, for example (polyglutamate or polyaspartate
grafted with alpha-tocopherol of synthetic or natural origin).

(57) Abrégé : La présente invention concerne des nouveaux matériaux à base de polyaminoacide5 biodégradables, utiles notamment
pour la vectorisation de principe(s) actif(s) (PA) L'invention vise aussi de nouvelles compositions pharmaceutiques, cosmétiques
diététiques ou phytosanitaires à base de ces polyaminoacides. Le but de l'invention est de fournir une nouvelle matière première
polymère, susceptible d'être utilisée pour la vectorisation de PA et permettant de satisfaire de manière optimale à toutes les spécifica-
tions du cahier des charges : biocompatibilité, biodégradabilité, aptitude à se transformer aisément et économiquement en particules
de vectorisation de principes actifs, ces particules étant elles même propres à former des suspensions colloïdales aqueuses stables, à
s'associer facilement avec de nombreux principes actifs, et à libérer ces principes actifs in vivo. Ce but est atteint par la présente in-
vention qui concerne tout d'abord des polyaminoacides amphiphiles comprenant des unités aspartique et/ou des unités glutamiques,
caractérisés en ce qu'au moins une partie de ces unités sont porteuses de greffons comportant au moins un motif alpha-tocophérol,
e.g. : (polyglutamate ou polyaspartate greffé par l'alpha tocophérol d'origine synthétique ou naturelle).



WO 03/104303 A1