

Title (en)

IMPROVEMENTS RELATING TO THE CONTROL OF NEOPLASTIC TISSUE GROWTH.

Title (de)

NEOPLASTISCHEM GEWEBEWACHSTUM.

Title (fr)

AMELIORATIONS RELATIVES A LA REGULATION DE LA CROISSANCE DE TISSUS NEOPLASTIQUES.

Publication

EP 0429454 A1 19910605 (EN)

Application

EP 89903769 A 19890222

Priority

GB 8804068 A 19880222

Abstract (en)

[origin: EP0330432A1] Compounds of the general formula: <CHEM> wherein R is H, an acyl group or a hydrocarbyl group containing up to 6 carbon atoms, have cytotoxic activity against several tumours. The 4-hydroxylamino compound can be obtained directly from the corresponding 2,4-dinitro compound by selective chemical reduction or by the action of a nitroreductase obtainable from Walker tumour cells. The 2,4-dinitro compound is substantially devoid of cytotoxic activity except in relation to Walker tumour cells and hence can act as a prodrug in regimes where a prodrug is localised in vivo in the regions of a tumour to be treated and is then activated to the cytotoxic 4-hydroxylamino compound under the influence of the enzyme.

Abstract (fr)

Les composés de la formule générale (I), dans laquelle R représente H, un groupe acyle ou un groupe hydrocarbyle contenant jusqu'à 6 atomes de carbone, ont une activité cytotoxique contre plusieurs tumeurs. On peut obtenir directement le composé 4-hydroxylamino à partir du composé 2,4-dinitro correspondant par réduction chimique sélective ou par l'action d'une nitroréductase que l'on peut obtenir à partir de cellules tumorales de Walker. Le composé 2,4-dinitro est sensiblement dépourvu d'activité cytotoxique excepté à l'égard des cellules tumorales de Walker, et donc il peut faire office de promédicament dans des régimes dans lesquels un promédicament est localisé in vivo dans les régions d'une tumeur à traiter, il est alors activé pour devenir le composé 4-hydroxylamino cytotoxique sous l'effet de l'enzyme.

IPC 1-7

A61K 31/395; A61K 37/50; C07D 203/14; C12P 17/10

IPC 8 full level

A61K 31/395 (2006.01); **A61K 31/396** (2006.01); **A61K 38/44** (2006.01); **A61P 35/00** (2006.01); **C07D 203/08** (2006.01); **C07D 203/14** (2006.01); **C12N 9/02** (2006.01); **C12P 17/10** (2006.01)

CPC (source: EP)

A61P 35/00 (2017.12); **C07D 203/14** (2013.01); **C12N 9/0036** (2013.01); **C12P 17/10** (2013.01); **C12Y 106/05002** (2013.01)

Citation (search report)

See references of WO 8907592A1

Designated contracting state (EPC)

AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)

EP 0330432 A1 19890830; AU 3439889 A 19890906; EP 0429454 A1 19910605; GB 8804068 D0 19880323; JP H03503761 A 19910822; WO 8907592 A1 19890824; ZA 891363 B 19891129

DOCDB simple family (application)

EP 89301678 A 19890222; AU 3439889 A 19890222; EP 89903769 A 19890222; GB 8804068 A 19880222; GB 8900179 W 19890222; JP 50376289 A 19890222; ZA 891363 A 19890222