

Title (en)
THIOL-CARBOXYLIC ACID DERIVATIVES AS COLLAGENASE INHIBITORS.

Title (de)
THIOLCARBONSÄUREDERIVATE ALS KOLLAGENASE-INHIBITOREN.

Title (fr)
DERIVES D'ACIDE THIOL-CARBOXYLIQUE A TITRE D'INHIBITEURS DE COLLAGENASE.

Publication
EP 0579648 A1 19940126 (EN)

Application
EP 92907683 A 19920406

Priority
GB 9107367 A 19910408

Abstract (en)
[origin: WO9217444A1] A compound of formula (I) or a salt, solvate or hydrate thereof in which, R1 is -OH; alkoxy; aryloxy or aralkyloxy; -NR6R7, where each of R6 and R7 is independently hydrogen or alkyl, or R6 and R7 together with the nitrogen atom to which they are bonded form a 5-, 6- or 7-membered ring with an additional oxygen, sulphur or optionally substituted nitrogen atom in the ring; or a group (II) where R8 is hydrogen; alkyl optionally substituted by -OH, alkoxy, -NR6R7, guanidine, -CO2H, CONH2, SH, or S-alkyl; or -CH2-Ar where Ar is optionally substituted aryl; and R9 is alkoxy; OH; or -NR6R7; R2 is hydrogen; or acyl, such as (a) or (b)-, where Z is optionally substituted aryl; R3 is C3-6 alkyl; R4 is -(CH2)nNR10R11, -(CH2)nNHCOR12, -(CH2)nNR13C(=NR14)NR10R11, -(CH2)nCONH(CH2)qNR10R11 or -(CH2)n-R15 where n is an integer from 1 to 6, and q is an integer from 2 to 4, and each of R10 and R11 is independently hydrogen or alkyl, or R10 and R11 together with the nitrogen atom to which they are bonded form a 5-, 6- or 7-membered ring with an optional oxygen or sulphur atom or an optionally substituted second nitrogen atom in the ring, R12 is alkyl, alkoxy, aralkyloxy or -(CH2)mNR10R11, where m is 1 or 2, R13 is hydrogen or alkyl, R14 is hydrogen or alkyl or R14 and R10 together with the nitrogen atoms to which they are bonded form an optionally substituted 5-, 6- or 7-membered ring, and R15 is an optionally substituted piperidyl ring; and R5 is hydrogen, alkyl, -CH2-(CH2)nOR16, -CH2-(CH2)n-OCOR17 or (III) where n is an integer from 1 to 6, R16, R17 and R18 are independently hydrogen or C1-6 alkyl, and R19 is hydroxy, -O-C1-6alkyl or NR10R11 where R10 and R11 are as defined for R4, for use in the treatment of collagenolytic conditions.

Abstract (fr)
Composé répondant à la formule (I), ou son sel, solvate ou hydrate. Dans ladite formule (I), R1 représente -OH; alcoxy; aryloxy ou aralkyloxy; -NR6R7 où R6 et R7 représentent, indépendamment l'un de l'autre, hydrogène ou alkyle, ou représentent conjointement avec l'atome d'azote auquel ils sont liés un cycle penta-, hexa- ou heptagonal possédant un atome supplémentaire d'oxygène, de soufre ou d'azote éventuellement substitué; ou un groupe (II), dans lequel R8 représente hydrogène; alkyle éventuellement substitué par .OH, alcoxy, NR6R7, guanidine, -CO2H, CONH2, SH, ou S-alkyle; ou -CH2-Ar où Ar représente aryle éventuellement substitué; et R9 représente alcoxy. OH; ou NR6R7; R2 représente hydrogène; ou acyle, par exemple (a) ou (b), où Z représente aryle éventuellement substitué; R3 représente alkyle C3-6; R4 représente -(CH2)nNR10R11, -(CH2)nNHCOR12, -(CH2)nNR13C(=NR14)NR10R11, -(CH2)nCONH(CH2)qNR10R11 ou -(CH2)n-R15 où n est un nombre entier compris entre 1 et 6 et q est un nombre entier compris entre 2 et 4, et R10 et R11 représentent, indépendamment l'un de l'autre, hydrogène ou alkyle, ou représentent conjointement avec l'atome d'azote auquel ils sont liés un cycle penta-, hexa- ou heptagonal possédant éventuellement un atome d'oxygène ou de soufre ou un second atome d'azote éventuellement substitué, R12 représente alkyle, alcoxy, aralkyloxy, ou -(CH2)mNR10R11 où m est 1 ou 2, R13 représente hydrogène ou alkyle, R14 représente hydrogène ou alkyle, ou R14 et R10 forment, conjointement avec les atomes d'azote auxquels ils sont liés, un cycle penta-, hexa-, ou heptagonal éventuellement substitué, et R15 représente un cycle pipéridyle éventuellement substitué; et R5 représente hydrogène, alkyle, -CH2-(CH2)nOR16, -CH2-(CH2)n-OCOR17 ou (V), où n est un nombre entier compris entre 1 et 6, R16 R17 et R18 représentent, indépendamment les uns des autres, hydrogène ou alkyle C1-6, et R19 représente hydroxy, -O-alkyle C1-6 ou NR10R11 où R10 et R11 ont les mêmes notations que pour R4; ce composé est destiné au traitement

IPC 1-7
C07C 327/32; **C07C 323/60**; **A61K 31/265**; **A61K 31/27**

IPC 8 full level
A61K 31/16 (2006.01); **A61K 31/19** (2006.01); **A61K 31/22** (2006.01); **A61P 29/00** (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07C 323/60** (2006.01); **C07C 327/32** (2006.01); **C07D 295/18** (2006.01)

CPC (source: EP)
A61P 29/00 (2017.12); **A61P 43/00** (2017.12); **C07C 323/60** (2013.01); **C07C 327/32** (2013.01)

Citation (search report)
See references of WO 9217444A1

Designated contracting state (EPC)
AT BE CH DE DK ES FR GB GR IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)
WO 9217444 A1 19921015; AU 1456792 A 19921102; CA 2107334 A1 19921009; EP 0579648 A1 19940126; GB 9107367 D0 19910522; IE 921100 A1 19921021; JP H06506206 A 19940714; MX 9201575 A 19930801; NZ 242240 A 19931125; PT 100353 A 19930630; TW 210333 B 19930801; ZA 922501 B 19931007

DOCDB simple family (application)
GB 9200612 W 19920406; AU 1456792 A 19920406; CA 2107334 A 19920406; EP 92907683 A 19920406; GB 9107367 A 19910408; IE 921100 A 19920407; JP 50717992 A 19920406; MX 9201575 A 19920406; NZ 24224092 A 19920406; PT 10035392 A 19920407; TW 81102615 A 19920407; ZA 922501 A 19920407