

Title (en)
PHOSPHONO DERIVATIVES OF AMINO ACIDS AS METALLOPROTEINASE INHIBITORS.

Title (de)
PHOSPHONODERIVATE VON AMINOSAUREN ALS METALLOPROTEINASE INHIBITOREN.

Title (fr)
DERIVES PHOSPHONO D'ACIDES AMINES EN TANT QU'INHIBITEURS DE METALLOPROTEASES.

Publication
EP 0581923 A1 19940209 (EN)

Application
EP 93902386 A 19930115

Priority
GB 9200826 A 19920115

Abstract (en)
[origin: WO9314096A1] Compounds of formula (I) are described wherein R represents a -P(O)(X<1>R<6>)X<2>R<7> group, where X<1> and X<2>, which may be the same or different, is each an oxygen or a sulphur atom, and R<6> and R<7>, which may be the same or different each represents a hydrogen atom or an optionally substituted alkyl, aryl, or aralkyl group; R<1> represents a hydrogen atom or an optionally substituted alkyl, alkenyl, aryl, aralkyl, heteroaralkyl or heteroarylthioalkyl group; R<2> represents an optionally substituted alkyl, alkenyl, cycloalkyl, cycloalkylalkyl, aryl, aralkyl, aralkoxy, or aralkylthio group, or an amino (-NH₂), substituted amino, carboxyl (-CO₂H) or esterified carboxyl group; R<3> represents a hydrogen atom or an alkyl group; R<4> represents a hydrogen atom or an alkyl group; R<5> represents a group -[Alk]_nR<8> where Alk is an alkyl or alkenyl group optionally interrupted by one or more -O- or -S- atoms or -N(R<9>)- groups [where R<9> is a hydrogen atom or a C1-6alkyl group], n is zero or an integer 1, and R<8> is an optionally substituted cycloalkyl or cycloalkenyl group; X represents an amino (-NH₂), or substituted amino, hydroxyl or substituted hydroxyl group; and the salts, solvates and hydrates thereof. The compounds are metalloproteinase inhibitors and in particular have a selective gelatinase action, and may be of use in the treatment of cancer to control the development of tumour metastasises.

Abstract (fr)
On décrit des composés de la formule (I) leurs sels, leurs solvates et leurs hydrates. Dans cette formule, R représente un groupe -P(O)(X1R6)X2R7, où X1 et X2 peuvent être les mêmes ou différents en étant chacun un atome d'oxygène ou de soufre et R6 et R7 peuvent être les mêmes ou différents en étant chacun un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle, aryle ou aralkyle, le cas échéant substitué; R1 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle, alcényle, aryle, aralkyle, hétéroalkyle ou hétéroarylthioalkyle, le cas échéant substitué; R2 représente un groupe alkyle, alcényle, cycloalkyle, cycloalkylalkyle, aryle, aralkyle, aralcoxy, ou aralkylthio, le cas échéant substitué, ou un groupe amino (-NH₂), un groupe amino substitué, un groupe carboxyle (-CO₂H) ou carboxyle estérifié; R3 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle; R4 représente un atome d'hydrogène ou un groupe alkyle; R5 représente un groupe -[Alk]_nR8 où Alk est un groupe alkyle ou alcényle, le cas échéant coupé par un ou plusieurs atomes -O- ou -S- ou par des groupes -N(R9)- [R9 est un atome d'hydrogène ou un groupe (C1-C6)alkyle], n est égal à zéro ou au nombre entier 1 et R8 est un groupe cycloalkyle ou cycloalcényle, le cas échéant substitué; X représente un groupe amino (-NH₂) ou un groupe amino substitué, un groupe hydroxyle ou un groupe hydroxyle substitué. Ces composés sont des inhibiteurs des métalloprotéases et en particulier ils ont une activité sélective contre l'enzyme gélatinolytique et ils peuvent être utilisés dans le traitement du cancer pour combattre le développement de métastases tumorales.

IPC 1-7
C07F 9/38; **A61K 31/66**; **C07F 9/40**; **C07F 9/6533**

IPC 8 full level
A61K 31/66 (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07F 9/38** (2006.01); **C07F 9/40** (2006.01); **C07F 9/6533** (2006.01)

CPC (source: EP)
A61P 43/00 (2017.12); **C07F 9/3808** (2013.01); **C07F 9/4006** (2013.01); **C07F 9/6533** (2013.01)

Citation (search report)
See references of WO 9314096A1

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

DOCDB simple family (publication)
WO 9314096 A1 19930722; AU 3358593 A 19930803; CA 2105309 A1 19930716; EP 0581923 A1 19940209; GB 9200826 D0 19920311; JP H06506483 A 19940721

DOCDB simple family (application)
GB 9300086 W 19930115; AU 3358593 A 19930115; CA 2105309 A 19930115; EP 93902386 A 19930115; GB 9200826 A 19920115; JP 51228693 A 19930115