

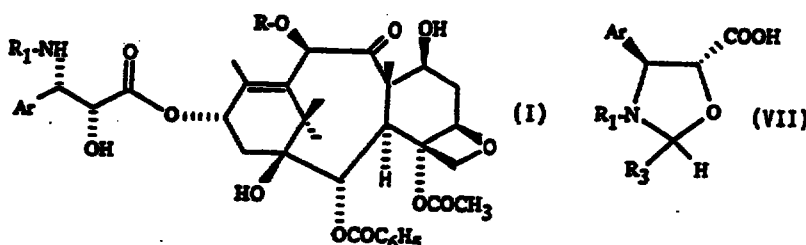
PCT WORLD ORGANISATION FOR INTELLECTUAL PROPERTY
International Office
INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED UNDER THE PATENT
COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification: C07D 305/14, 263/04, 413/12	A1	(11) International publication number: WO 94/07878 (43) International publication date: 14 April 1994 (14.04.94)
(21) International application number: PCT/FR93/00968 (22) International filing date: 4 October 1993 (04.10.93) (30) Data relating to the priority: 92/11742 5 October 1992 (05.10.92) FR (71) Applicant (for all designated States except US): RHONE-POULENC RORER S.A. [FR/FR]: 20, avenue Raymond-Aron, F-92160 Antony (FR). (72) Inventors; and (75) Inventors/Applicants (US only): Alain COMMERCON [FR/FR]: 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (FR). Eric DIDIER [FR/FR]: 69, avenue des Gobelins, F-75013 Paris (FR). Etienne FOUQUE [FR/FR]: 90, avenue de Bonneuil, F-94100 Saint-Maur-des-Fossés (FR).	(74) Representative: Jacques PILARD: Rhône-Poulenc Rorer S.A., Patents Directorate, 20, avenue Raymond-Aron, F-92165 Antony Cédex (FR). (81) Designated States: AU, BY, CA, CZ, FI, HU, JP, KR, KZ, NO, NZ, PL, RU, SK, UA, US, European Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE). Published With the International Search Report REPLACED SHEETS SG ☒ Description : paged to paged ☒ Claim(s) : paged to paged ☐ Drawing(s) : paged to paged ☒ Abstract : paged to paged INDEXED BY RECEPT	

As printed

(54) Title: METHOD OF PREPARING TAXANE DERIVATIVES

(54) Titre: PROCÉDE DE PRÉPARATION DE DÉRIVÉS DU TAXANE



This Sheet Has Been Replaced



(57) Abstract

Method of preparing taxane derivatives of general formula (I) by esterification of protected baccatine III or 10-deacetyl-baccatine III by means of an acid of general formula (VII), deprotection of the side chain and elimination of the hydroxy function protection groupings. In general formulae (I) and (VII): Ar stands for aryl, R is hydrogen or acetyl, R₁ is benzoyl or R₂-O-CO- in which R₂ is alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, bicycloalkyl, phenyl or heterocyclyl, and R₃ is hydrogen, alkoxy, optionally substituted aryl.

(57) Abrégé

Procédé de préparation de dérivés du taxane de formule générale (I) par estérification de la baccatine III ou de la désacetyl-10 baccatine III protégé au moyen d'un acide de formule générale (VII), déprotection de la chaîne latérale et élimination des groupements protecteurs des fonctions hydroxy. Dans les formules générales (I) et (VII): Ar représente aryle, R représente hydrogène ou acétyle, R₁ représente benzoyle ou R₂-O-CO- dans lequel R₂ représente alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, cycloalcényle, bicycloalcoyle, phényle ou hétérocyclyle, R₃ représente hydrogène, alcoxy, aryle éventuellement substitué.