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

(51) International patent classification[6] : C07D 305/14, 493/08, A61K 31/335 — A1

(11) International publication number: WO 97/23473

(43) International publication date: 3 July 1997 (03.07.97)

(21) International application number: PCT/FR96/02031

(22) International filing date: 19 December 1996 (19.12.96)

(30) Data relating to the priority: 95/15,379 22 December 1995 (22.12.95) 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): Hervé BOUCHARD [FR/FR]; 7, allée de la Prévôté, F-94320 Thiais (FR). Alain COMMERÇON [FR/FR]; 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (FR).

(74) Representative: Magali LE PENNEC; Rhône-Poulenc Rorer S.A., Patents Directorate, 20, avenue Raymond-Aron, F-92165 Antony Cédex (FR).

(81) Designated States: AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CU, CZ, EE, GE, HU, IL, IS, JP, KP, KR, LC, LK, LR, LT, LV, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, TR, TT, UA, US, UZ, VN, ARIPO Patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published
With the International Search Report.

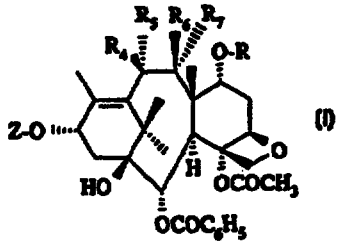
As printed

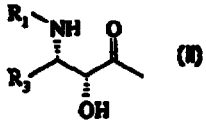
(54) Title: NOVEL TAXOIDS, PREPARATION THEREOF AND PHARMACEUTICAL COMPOSITIONS CONTAINING SAME

(54) Titre: NOUVEAUX TAXOIDES, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(57) Abstract

Novel taxoids of general formula (I), the preparation thereof and pharmaceutical compositions containing same, are disclosed. In general formula (I), Z is a hydrogen atom or a radical of general formula (II), wherein R_1 is an optionally substituted benzoyl, furoyl or thenoyl radical or a radical R_2-O-CO- where R_2 is an alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, bicycloalkyl, optionally substituted phenyl or heterocyclyl radical; R_3 is an alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, naphthyl or aromatic heterocyclic radical; or R_4 is a hydrogen atom, R_6 and R_7 together form a ketone function, and R and R_5 together form a bond; or R_4 is a hydrogen atom or a hydroxy radical or an alkoxy, alkenyloxy, optionally substituted alkynyloxy, alkanoyloxy, aroyloxy, alkenoyloxy, alkynoyloxy, cycloalkanoyloxy, alkoxyacetyl, alkylthioacetyl, alkyloxycarbonyloxy, cycloalkyloxy, cycloalkenyloxy, carbamoyloxy, alkylcarbamoyloxy or dialkylcarbamoyloxy radical; R_5 is a hydrogen atom, or R_4 and R_5 together form a ketone function, R_6 is a hydrogen atom, and R and R_7 together form a bond. The novel products of general formula (I), wherein Z is a radical of general formula (II), have remarkable antitumoral and antileukemic properties.





(57) Abrégé

Nouveaux taxoïdes de formule générale (I), leur préparation et les compositions pharmaceutiques qui les contiennent. Dans la formule générale (I), Z représente un atome d'hydrogène ou un radical de formule générale (II), dans laquelle R_1 représente un radical benzoyle éventuellement substitué, furoyle ou thénoyle ou un radical R_2-O-CO- dans lequel R_2 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, cycloalcényle, bicycloalcoyle, phényle éventuellement substitué ou hétérocyclyle; R_3 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, cycloalcényle, phényle, naphtyle ou hétérocyclique aromatique; ou bien, R_4 représente un atome d'hydrogène; R_6 et R_7 forment ensemble une fonction cétone; et R et R_5 forment ensemble une liaison; ou bien, R_4 représente un atome d'hydrogène ou un radical hydroxy ou un radical alcoxy, alcényloxy, alcynyloxy éventuellement substitué, alcanoyloxy, aroyloxy, alcénoyloxy, alcynoyloxy, cycloalcanoyloxy, alcoxyacétyle, alcoylthioacétyle, alcoyloxycarbonyloxy, cycloalcoyloxy, cycloalcényloxy, carbamoyloxy, alcoylcarbamoyloxy ou dialcoylcarbamoyloxy; R_5 représente un atome d'hydrogène; ou R_4 et R_5 forment ensemble une fonction cétone; R_6 représente un atome d'hydrogène; et R et R_7 forment ensemble une liaison. Les nouveaux produits de formule générale (I) dans laquelle Z représente un radical de formule générale (II) présentent des propriétés antitumorales et antileucémiques remarquables.