9705521
RTMP copy

PCT ORGANISATION MONDIALE DE LA PROPRIETE INTELLECTUELLE
Bureau international

DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIEE EN VERTU DU TRAITE DE COOPERATION EN MATIERE DE BREVETS (PCT)

(51) Classification internationale des brevets 6 : C07D 305/14, A61K 31/335 — A1

(11) Numéro de publication internationale: WO 96/13494

(43) Date de publication internationale: 9 mai 1996 (09.05.96)

(21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR95/01393

(22) Date de dépôt international: 23 octobre 1995 (23.10.95)

(30) Données relatives à la priorité:
94/12795 26 octobre 1994 (26.10.94) FR

(71) Déposant *(pour tous les Etats désignés sauf US)*: RHONE-POULENC RORER S.A. [FR/FR]; 20, avenue Raymond-Aron, F-92160 Antony (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants *(US seulement)*: BOUCHARD, Hervé [FR/FR]; 114, avenue Danielle-Casanova, F-94200 Ivry-sur-Seine (FR). BOURZAT, Jean-Dominique [FR/FR]; 36, boulevard de la Libération, F-94300 Vincennes (FR). COMMERÇON, Alain [FR/FR]; 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (FR). TERRIER, Corinne [FR/FR]; 32 bis, boulevard de Chanzy, F-93190 Livry-Gargan (FR). ZUCCO, Martine [FR/FR]; 24, rue Adrien-Tessier, F-94320 Thiais (FR).

(74) Mandataire: PILARD, Jacques; Rhône-Poulenc Rorer S.A., Direction Brevets, 20, avenue Raymond-Aron, F-92165 Antony Cédex (FR).

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

Publiée
Avec rapport de recherche internationale.

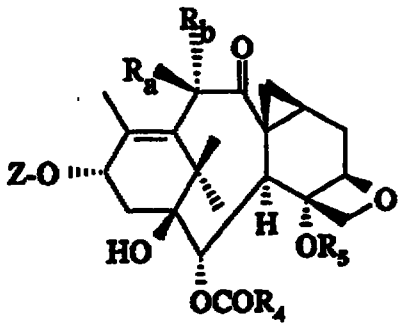
PCT Publication & Translation

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

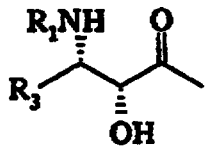
(54) Titre: NOUVEAUX TAXOIDES, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(57) Abstract

Novel taxoids of general formulas (I) and (II), preparation thereof, and pharmaceutical compositions containing same. In general formula (I), R_a is hydrogen, hydroxy, alkoxy, acyloxy or alkoxyacetoxy and R_b is hydrogen, or R_a and R_b, taken together with the carbon atom to which they are attached, form a ketone function; Z is a hydrogen atom or a radical of general formula (II), wherein R_1 is an optionally substituted benzoyl, thenoyl or furoyl 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 aromatic heterocyclic, alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, phenyl or naphthyl radical; R_4 is an alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, bicycloalkyl, aryl or heterocyclyl radical; and R_5 is an optionally substituted cycloalkenyl, alkyl, alkenyl, alkynyl or cycloalkyl radical. The novel products of general formula (I), wherein Z is a radical of general formula (II), have remarkable antitumoral and antineoplastic properties.



(I)



(II)

(57) Abrégé

Nouveaux taxoïdes de formules générales (I) et (II), leur préparation et les compositions pharmaceutiques qui les contiennent. Dans la formule générale (I): R_a représente hydrogène, hydroxy, alcoxy, acyloxy, alcoxyacétoxy et R_b représente hydrogène ou bien R_a et R_b forment ensemble avec l'atome de carbone auquel ils sont liés une fonction cétone; Z représente un atome d'hydrogène ou un radical de formule générale (II) dans laquelle R_1 représente un radical benzoyle éventuellement substitué, thénoyle ou furoyle 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, phényle, naphtyle ou hétérocyclique aromatique; R_4 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, cycloalcényle, bicycloalcoyle, aryle ou hétérocyclyle, et R_5 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle ou cycloalcényle éventuellement substitué. Les nouveaux produits de formule générale (I) dans laquelle Z représente un radical de formule générale (II) présentent des propriétés antitumorales et antileucémiques remarquables.

UNIQUEMENT A TITRE D'INFORMATION

Codes utilisés pour identifier les Etats parties au PCT, sur les pages de couverture des brochures publiant des demandes internationales en vertu du PCT.

AT	Autriche	GB	Royaume-Uni	MR	Mauritanie
AU	Australie	GE	Géorgie	MW	Malawi
BB	Barbade	GN	Guinée	NE	Niger
BE	Belgique	GR	Grèce	NL	Pays-Bas
BF	Burkina Faso	HU	Hongrie	NO	Norvège
BG	Bulgarie	IE	Irlande	NZ	Nouvelle-Zélande
BJ	Bénin	IT	Italie	PL	Pologne
BR	Brésil	JP	Japon	PT	Portugal
BY	Bélarus	KE	Kenya	RO	Roumanie
CA	Canada	KG	Kirghizistan	RU	Fédération de Russie
CF	République centrafricaine	KP	République populaire démocratique de Corée	SD	Soudan
CG	Congo			SE	Suède
CH	Suisse	KR	République de Corée	SI	Slovénie
CI	Côte d'Ivoire	KZ	Kazakhstan	SK	Slovaquie
CM	Cameroun	LI	Liechtenstein	SN	Sénégal
CN	Chine	LK	Sri Lanka	TD	Tchad
CS	Tchécoslovaquie	LU	Luxembourg	TG	Togo
CZ	République tchèque	LV	Lettonie	TJ	Tadjikistan
DE	Allemagne	MC	Monaco	TT	Trinité-et-Tobago
DK	Danemark	MD	République de Moldova	UA	Ukraine
ES	Espagne	MG	Madagascar	US	Etats-Unis d'Amérique
FI	Finlande	ML	Mali	UZ	Ouzbékistan
FR	France	MN	Mongolie	VN	Viet Nam
GA	Gabon				