9803895-3
IPOS & 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 97/32869**

(43) Date de publication internationale: 12 septembre 1997 (12.09.97)

(21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR97/00386

(22) Date de dépôt international: 5 mars 1997 (05.03.97)

(30) Données relatives à la priorité:
96/02804 6 mars 1996 (06.03.96) 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]; 7, allée de la Prévôté, F-94320 Thiais (FR). BOURZAT, Jean-Dominique [FR/FR]; 36, boulevard de la Libération, F-94300 Vincennes (FR). COMMERCON, Alain [FR/FR]; 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (FR).

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

(81) Etats désignés: AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CU, CZ, EE, GE, GH, 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, YU, brevet ARIPO (GH, KE, LS, MW, SD, SZ, UG), brevet eurasien (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), brevet européen (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FI, 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).

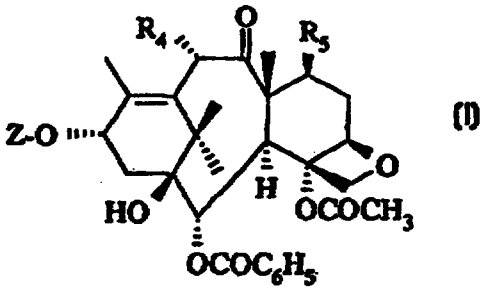
Publiée
Avec rapport de recherche internationale.

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

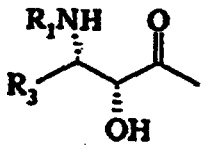
(54) Titre: TAXOIDES, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(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 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, phenyl, naphthyl or aromatic heterocyclic radical; R_4 is a hydroxy radical or an alkoxy, alkenyloxy, optionally substituted alkynyloxy, alkanoyloxy, alkenoyloxy, alkynyloxy, alkoxyacetyl or alkyloxycarbonyloxy radical, or a cycloalkyloxy, cycloalkenyloxy, arylcarbonyloxy or heterocyclylcarbonyloxy radical; and R_5 is an optionally substituted alkoxy radical or a cycloalkyloxy or cycloalkenyloxy radical. The novel compounds 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 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 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 hydroxy ou un radical acoxy, alcényloxy, alcynyloxy éventuellement substitué, alcanoyloxy, alcénoyloxy, alcynoyloxy, alcoxyacétyle, alcoyloxycarbonyloxy, ou un radical cycloalcoyloxy ou cycloalcényloxy ou arylcarbonyloxy ou hétérocyclylcarbonyloxy, et R_5 représente un radical alcoxy éventuellement substitué ou un radical cycloalcoyloxy ou cycloalcényloxy. Les nouveaux produits de formule générale (I) dans laquelle Z représente un radical de formule générale (II) présentent des propriétés antitumorales et antileucémiques remarquables.