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, A61K 31/335

A1

(11) International publication number: WO 96/13494

(43) International publication date: 9 May 1996 (09.05.96)

(21) International application number: PCT/FR95/01393

(22) International filing date: 23 October 1995 (23.10.95)

(30) Data relating to the priority: 94/12.795 26 October 1994 (26.10.94) 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]; 114, avenue Danielle-Casanova, F-94200 Ivry-sur-Seine (FR). Jean-Dominique BOURZAT [FR/FR]; 36, boulevard de la Libération, F-94300 Vincennes (FR). Alain COMMERÇON [FR/FR]; 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (FR). Corinne TERRIER [FR/FR]; 32 bis, boulevard de Chanzy, F-93190 Livry-Gargan (FR). Martine ZUCCO [FR/FR]; 24, rue Adrien-Tessier, F-94320 Thiais (FR).

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

(81) Designated States: 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, European Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, 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), ARIPO Patent (KE, LS, MW, SD, SZ, UG).

Published
With the International Search Report.

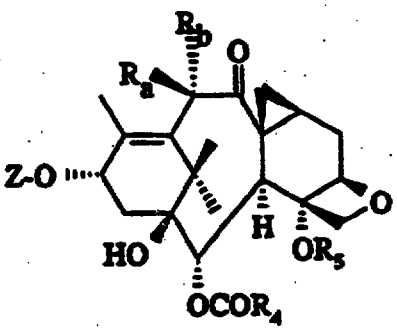
As printed

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

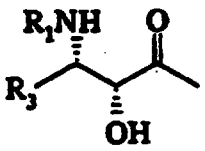
(54) Titre: NOUVEAUX TAXOIDES, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(57) Abstract

Novel taxoids of general 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.

ONLY FOR INFORMATION

Codes used to identify the PCT member States on the flyleaves of the brochures in which international applications made under the PCT are published.

AT	Austria
AU	Australia
BB	Barbados
BE	Belgium
BF	Burkina Fasso
BG	Bulgaria
BJ	Benin
BR	Brazil
BY	Belarus
CA	Canada
CF	Central African Republic
CG	Congo
CH	Switzerland
CI	Ivory Coast
CM	Cameroon
CN	China
CS	Czechoslovakia
CZ	Czech Republic
DE	Germany
DK	Denmark
ES	Spain
FI	Finland
FR	France
GA	Gabon
GB	United Kingdom
GE	Georgia
GN	Guinea
GR	Greece
HU	Hungary
IE	Ireland
IT	Italy
JP	Japan
KE	Kenya
KG	Kyrghyzstan
KP	Democratic People's Republic of Korea
KR	Republic of Korea
KZ	Kazakhstan
LI	Liechtenstein
LK	Sri Lanka
LU	Luxembourg
LV	Latvia
MC	Monaco
MD	Republic of Moldova
MG	Madagascar
ML	Mali
MN	Mongolia
MR	Mauritania
MW	Malawi
NE	Niger
NL	Netherlands
NO	Norway
NZ	New Zealand
PL	Poland
PT	Portugal
RO	Romania
RU	Russian Federation
SD	Sudan
SE	Sweden
SI	Slovenia
SK	Slovakia
SN	Senegal
TD	Chad
TG	Togo
TJ	Tajikistan
TT	Trinidad and Tobago
UA	Ukraine
US	United States of America
UZ	Uzbekistan
VN	Vietnam