9705695-6
RTMPS 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 96/30355

(43) Date de publication internationale: 3 octobre 1996 (03.10.96)

(21) Numéro de la demande internationale: PCT/FR96/00440

(22) Date de dépôt international: 25 mars 1996 (25.03.96)

(30) Données relatives à la priorité:
95/03545 — 27 mars 1995 (27.03.95) — FR
95/15381 — 22 décembre 1995 (22.12.95) — FR

(71) Déposant: RHONE-POULENC RORER S.A. [FR/FR]; 20, avenue Raymond-Aron, F-92160 Antony (FR).

(72) Inventeurs: BOUCHARD, Hervé; 114, avenue Danielle-Casanova, F-94200 Ivry-sur-Seine (FR). BOURZAT, Jean-Dominique; 36, boulevard de la Libération, F-94300 Vincennes (FR). COMMERÇON, Alain; 1 bis, rue Charles-Floquet, F-94400 Vitry-sur-Seine (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, AU, BB, BG, BR, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, IS, JP, KP, KR, LK, LR, LT, LV, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, TR, TT, UA, UZ, VN, brevet ARIPO (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).

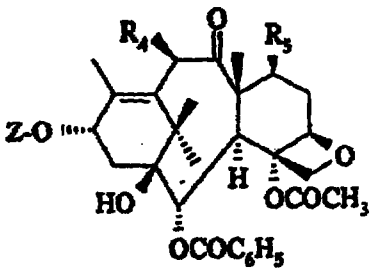
Publiée
Avec rapport de recherche internationale.

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

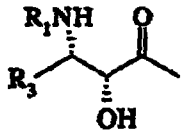
(54) Titre: NOUVEAUX TAXOIDES, LEUR PREPARATION ET LES COMPOSITIONS PHARMACEUTIQUES QUI LES CONTIENNENT

(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 substitued benzoyl radical or a thenoyl or furoyl radical, a radical R_2-O-CO-, where R_2 is an alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, bicycloalkyl, optionally substitued phenyl or heterocyclyl radical, R_3 is an aromatic heterocyclic alkyl, alkenyl, alkynyl, cycloalkyl, phenyl or naphtyl radical, R_4 is an optionally substitued alkoxy, alkenyloxy or alkynyloxy radical or a cycloalkyloxy or cycloalkenyloxy radical, and R_5 is an optionally substitued alkoxy, alkenyloxy or alkynyloxy radical or a cycloalkyloxy or cycloalkenyloxy radical. The novel products of general formula (I), wherein Z is a radical of general formula (II), have remarkable antitumoral and antileukaemic 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 thénoyle ou furoyle un radical R_2-O-CO- dans lequel R_2 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, cycloalcényle, bicycloacoyle, phényle éventuellement substitué ou hétérocyclyle, R_3 représente un radical alcoyle, alcényle, alcynyle, cycloalcoyle, phényle, naphtyle ou hétérocyclique aromatique, R_4 représente un radical alcoxy, alcényloxy, alcynyloxy éventuellement substitué ou un radical cycloalcoyloxy ou cycloalcényloxy, et R_5 représente un radical alcoxy, alcényloxy, alcynyloxy 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.

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