

Title (en)  
CYCLIC LACTAMS FOR CHOLESTEROL AND ATHEROSCLEROSIS CONTROL.

Title (de)  
CYCLISCHE LAKTAME ZUR KONTROLLE DES CHOLESTERINS UND DER ATHEROSKLEROSE.

Title (fr)  
LACTAMES CYCLIQUES DE REGULATION DU CHOLESTEROL ET DE L'ATHEROSCLEROSE.

Publication  
**EP 0417143 A1 19910320 (EN)**

Application  
**EP 89905896 A 19890511**

Priority  
US 20270188 A 19880603

Abstract (en)  
[origin: WO8911856A2] Cyclic lactams of formula (I), where R is hydrogen or C1 to C6-alkyl; X is oxygen or bivalent sulfur; Y is hydrogen or C1 to C6-alkyl; or -XY taken together represents hydrogen or C1 to C6-alkyl; or -XY is part of a double bond between the 5- and 6-position carbon atoms of the ring when R2 is also part of that double bond; R1 is hydrogen or C1 to C6-alkyl; R2 is part of the double bond between the 5- and 6-position lactam ring carbon atoms when -XY is also part of that same double bond and R3 is hydrogen, C1 to C6-alkyl or phenyl, or R2 and R3 are independently selected from the group consisting of hydrogen, C1 to C6-alkyl or phenyl; R4 and R5 are independently selected from the group consisting of hydrogen, C1 to C6-alkyl or phenyl, and when one of R4 and R5 is phenyl, the other is hydrogen; or R4 and R5 are taken together with the carbon to which they are bonded to complete a spiro-cycloalkyl ring having from 4 to 6 methylene carbon atoms; R6 and R7 are independently hydrogen, C1 to C6-alkyl or phenyl, and when one of R6 and R7 is phenyl, the other is hydrogen, and wherein R3 and R6 can be taken together to form a -(CH2)n-bridge ring forming connections where n is 2 or 3 across the lactam ring; provided that (I) when -XY and R2 form a double bond between the ring carbon atoms in the 5- and 6-positions, R1 is hydrogen and R3 is hydrogen, C1 to C6-alkyl or phenyl, (II) when X is oxygen or bivalent sulfur, Y is hydrogen or C1 to C6-alkyl; and (III) when -XY is taken together they represent hydrogen or C1 to C6-alkyl; are effective as drugs in warm-blooded animal patient to lower total cholesterol to treat atherosclerotic conditions and/or to alter the HDL/LDL ratio toward an increase in HDL cholesterol or toward a lower LDL cholesterol, or both, relative to the HDL/LDL ratio in a sample of the patient's blood before such treatment began.

Abstract (fr)  
On a mis au point des lactames cycliques de la formule (I) dans laquelle R représente hydrogène ou alkyle C1 à C6; X représente oxygène ou soufre bivalent; Y représente hydrogène ou alkyle C1 à C6; ou -XY pris ensemble représentent hydrogène ou alkyle C1 à C6; ou -XY font partie d'une double liaison entre les atomes de carbone en position 5 et 6 de l'anneau lorsque R2 fait aussi partie de la double liaison; R1 représente hydrogène ou alkyle C1 à C6; R2 fait partie de la double liaison entre les atomes de carbone de l'anneau de lactames en position 5 et 6 lorsque -XY font aussi partie de cette même double liaison et R3 représente hydrogène, alkyle C1 à C6 ou phényle, ou R2 et R3 sont choisis indépendamment dans le groupe composé d'hydrogène, alkyle C1 à C6 ou phényle; R4 et R5 sont choisis indépendamment dans le groupe composé d'hydrogène, alkyle C1 à C6 ou phényle, et lorsque R4 ou R5 représente phényle, l'autre représente hydrogène; ou R4 et R5 sont pris avec le carbone auquel ils sont liés pour compléter un anneau spiro-cycloalkyle comportant 4 à 6 atomes de carbone de méthylène; R6 et R7 représentent indépendamment hydrogène, alkyle C1 à C6 ou phényle et lorsque R6 ou R7 représente phényle, l'autre représente hydrogène; et dans laquelle R3 et R6 peuvent être pris ensemble pour former un anneau en pont -(CH2)n formant des liaisons où n représente 2 ou 3 sur l'anneau de lactames; à condition que (I) lorsque -XY et R2 forment une double liaison entre les atomes de carbone de l'anneau dans les positions 5 et 6, R1 représente hydrogène et R3 représente hydrogène, alkyle C1 à C6 ou phényle (II) lorsque X représente oxygène ou soufre bivalent, Y représente hydrogène ou alkyle C1 à C6, et (III) lorsque -XY sont pris ensemble, ils représentent hydrogène ou alkyle C1 à C6. Lesdits lactames cycliques sont efficaces comme produits pharmaceutiques chez des patients animaux à sang chaud pour abaisser le cholestérol total afin de traiter des états athérosclérotiques et/ou de modifier le rapport HDL/LDL, en augmentant le

IPC 1-7  
**A61K 31/395; A61K 31/435; A61K 31/44; A61K 31/445; A61K 31/55; C07D 211/76; C07D 211/88; C07D 221/20; C07D 221/24**

IPC 8 full level  
**A61K 31/395** (2006.01); **A61K 31/435** (2006.01); **A61K 31/44** (2006.01); **A61K 31/445** (2006.01); **A61K 31/4458** (2006.01); **A61K 31/451** (2006.01); **A61K 31/55** (2006.01); **A61P 3/06** (2006.01); **A61P 9/10** (2006.01); **C07D 211/76** (2006.01); **C07D 211/88** (2006.01); **C07D 221/20** (2006.01); **C07D 221/24** (2006.01)

CPC (source: EP US)  
**A61K 31/395** (2013.01 - EP US); **A61K 31/435** (2013.01 - EP); **A61K 31/44** (2013.01 - EP); **A61K 31/445** (2013.01 - EP); **A61K 31/55** (2013.01 - EP); **A61P 3/06** (2017.12 - EP); **A61P 9/10** (2017.12 - EP); **C07D 211/76** (2013.01 - EP); **C07D 211/88** (2013.01 - EP); **C07D 221/20** (2013.01 - EP); **C07D 221/24** (2013.01 - EP)

Citation (search report)  
See references of WO 8911856A2

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 8911856 A2 19891214; WO 8911856 A3 19900111**; AU 3564889 A 19900105; EP 0417143 A1 19910320; JP H03504724 A 19911017

DOCDB simple family (application)  
**US 8901949 W 19890511**; AU 3564889 A 19890511; EP 89905896 A 19890511; JP 50599089 A 19890511