

Title (en)  
CYCLIC KETAL DERIVATIVES.

Title (de)  
CYCLISCHE KETALDERIVATE.

Title (fr)  
DERIVES DE CETAL CYCLIQUES.

Publication  
**EP 0630379 A1 19941228 (EN)**

Application  
**EP 93906481 A 19930302**

Priority  
• EP 9300487 W 19930302  
• GB 9205136 A 19920310

Abstract (en)  
[origin: WO9318040A1] Compounds are described of formula (I), wherein R<1> represents a hydroxyl group or a group selected from - OCOCH= $\leq$ E>CHCH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>, -OCOCH= $\leq$ E>CHC(CH<sub>3</sub>)= $\leq$ E>CHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> or -OCO-X-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> [where X is - CH= $\leq$ E>CHCH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>CH(OH)CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH= $\leq$ E>CHC(OH)(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>2</sub>- or -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-]; R<2> represents a hydroxyl group; R<3> represents a group selected from (1) (where R<7> is a hydrogen atom or an acetyl group), -C(CH<sub>3</sub>)= $\leq$ E>CHCH(CH<sub>2</sub>R<8>)CH<sub>2</sub>Ph (where R<8> is a hydrogen or a hydroxyl group), -C(CH<sub>2</sub>OH)=Z>CHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph, -C(=CH<sub>2</sub>)CH(OH)CH(CH<sub>2</sub>OH)CH<sub>2</sub>Ph, -C(=CH<sub>2</sub>)CH(NHCOCH<sub>3</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph, -C(CH<sub>2</sub>NHCOCH<sub>3</sub>)= $\leq$ E>CHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph and (2); R<4> and R<5> may each independently represent a hydrogen atom or a methyl group; R<6> represents a tetrazole ring linked via the ring carbon atom to the rest of the molecule and optionally substituted at one of the ring nitrogen atoms by a C1-4alkyl group; and salts thereof. These compounds inhibit the enzyme squalene synthase and/or are intermediates for the preparation of compounds which inhibit the enzyme squalene synthase. Compounds of the inventions may be formulated for use in a variety of conditions where a lowering of the level of blood plasma cholesterol in animals would be beneficial and for use in combating fungal infections in animals.

Abstract (fr)  
L'invention concerne des composés de la formule (I) dans laquelle R1 représente un groupe hydroxyle ou un groupe choisi parmi - OCOCH=ECHCH(CH<sub>3</sub>)(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>CH<sub>3</sub>, -OCOCH=ECHC(CH<sub>3</sub>)=ECHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> ou -OCO-X-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub> [où X représente - CH=ECHCH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>CH(OH)CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH=ECHC(OH)(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>CH(OH)CH<sub>2</sub>- ou -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)-]; R2 représente un groupe hydroxyle; R3 représente un groupe choisi parmi la formule (1) (dans laquelle R7 représente un atome d'hydrogène ou un groupe acétyle), -C(CH<sub>3</sub>=ECHCH(CH<sub>2</sub>R8)CH<sub>2</sub>Ph (où R8 représente un groupe hydrogène ou un groupe hydroxyle), -C(CH<sub>2</sub>OH)=ZCHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph, -C(=CH<sub>2</sub>)CH(OH)CH(CH<sub>2</sub>OH)CH<sub>2</sub>Ph, -C(=CH<sub>2</sub>)CH(NHCOCH<sub>3</sub>)CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph, -C(CH<sub>2</sub>NHCOCH<sub>3</sub>)=ECHCH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Ph et la formule (2); R4 ainsi que R5 peuvent chacun indépendamment représenter un atome d'hydrogène ou un groupe méthyle; R6 représente un cycle tétrazole lié par l'intermédiaire de l'atome de carbone du cycle au reste de la molécule et facultativement substitué au niveau d'un des atomes d'azote du cycle par un groupe alkyle C1-4; ainsi que leurs sels. Ces composés inhibent la synthèse de squalène et/ou constituent des intermédiaires de préparation de composés inhibant la synthèse de squalène. Des composés de l'invention peuvent être formulés pour une utilisation dans divers états dans lesquels l'abaissement de la cholestérolémie chez des animaux présente un caractère favorable, et pour combattre des mycoses chez des animaux.

IPC 1-7  
**C07D 493/08**; **A61K 31/34**; **C07H 9/04**; **C07H 19/01**

IPC 8 full level  
**C07H 9/02** (2006.01); **A61K 31/34** (2006.01); **A61K 31/70** (2006.01); **A61K 31/7028** (2006.01); **A61P 3/00** (2006.01); **A61P 3/06** (2006.01); **A61P 9/08** (2006.01); **A61P 9/10** (2006.01); **A61P 31/04** (2006.01); **A61P 43/00** (2006.01); **C07D 493/08** (2006.01); **C07H 9/04** (2006.01); **C07H 15/10** (2006.01); **C07H 19/01** (2006.01)

CPC (source: EP)  
**A61P 3/00** (2017.12); **A61P 3/06** (2017.12); **A61P 9/08** (2017.12); **A61P 9/10** (2017.12); **A61P 31/04** (2017.12); **A61P 43/00** (2017.12); **C07D 493/08** (2013.01); **C07H 9/04** (2013.01); **C07H 19/01** (2013.01)

Citation (search report)  
See references of WO 9318040A1

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE DK ES FR GB GR IE IT LI LU MC NL PT SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 9318040 A1 19930916**; AU 3745893 A 19931005; CA 2131010 A1 19930916; EP 0630379 A1 19941228; GB 9205136 D0 19920422; JP H07504422 A 19950518

DOCDB simple family (application)  
**EP 9300487 W 19930302**; AU 3745893 A 19930302; CA 2131010 A 19930302; EP 93906481 A 19930302; GB 9205136 A 19920310; JP 51531893 A 19930302