(12)特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局

(43) 国際公開日
2002 年5 月23 日 (23.05.2002)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 02/40478 A1

(51) 国際特許分類[7]: C07D 471/04, 401/04, 498/04, C07K 5/06, 5/10, A61K 31/4375, 31/4709, 31/5383, 38/05, 38/06, 31/04

(21) 国際出願番号: PCT/JP01/10086

(22) 国際出願日: 2001 年11 月19 日 (19.11.2001)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願 2000-352269
2000 年11 月20 日 (20.11.2000) JP
特願2001-248822 2001 年8 月20 日 (20.08.2001) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 第一製薬株式会社 (DAIICHI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-0027 東京都中央区日本橋三丁目14番10号 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高橋 寿 (TAKAHASHI, Hisashi) [JP/JP]. 宮内理江 (MIYAUCHI, Rie) [JP/JP]. 伊藤雅夫 (ITOH, Masao) [JP/JP]. 竹村 真 (TAKEMURA, Makoto) [JP/JP]. 早川勇夫 (HAYAKAWA, Isao) [JP/JP]; 〒134-0081 東京都江戸川区北葛西一丁目16番13号 第一製薬株式会社 東京研究開発センター内 Tokyo (JP).

(74) 代理人: 弁理士 小栗昌平, 外(OGURI, Shohei et al.); 〒107-6028 東京都港区赤坂一丁目12番32号 アーク森ビル28階 栄光特許事務所 Tokyo (JP).

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

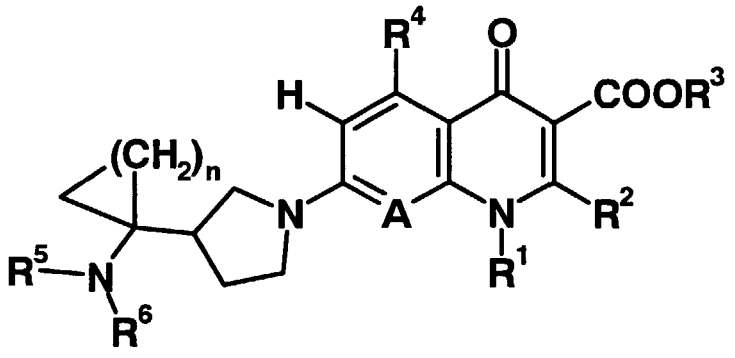
(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

２文字コード及び他の略語については、定期発行される各*PCT*ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: DEHALOGENO COMPOUNDS

(54) 発明の名称: デハロゲノ化合物



(I)

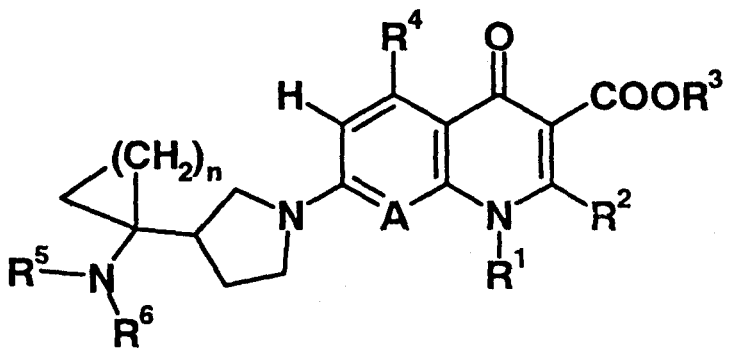
(57) Abstract: 3-(1-Aminocycloalkyl)pyrrolidinyl-substituted-6-dehalogeno(hydrogen-substituted)quinolonecarboxylic acid derivatives having specific substituents as represented by the following general formula (I), salts thereof and hydrates of the same exhibit a broad and potent antibacterial activity on gram-negative and gram-positive bacteria, in particular, resistant bacteria typified by gram-positive cocci including MRSA, PRSP and VRE. Thus, these compounds are usable as drugs.

[続葉有]

WO 02/40478 A1

(57) 要約:

特定の置換基を有する下記一般式（Ｉ）で表される構造の３－（１－アミノシクロアルキル）ピロリジニル置換－６－デハロゲノ（水素置換）キノロンカルボン酸誘導体、その塩、およびそれらの水和物が、グラム陰性菌およびグラム陽性菌に対して幅広い強力な抗菌活性を示すこと、とりわけＭＲＳＡ、ＰＲＳＰ、およびＶＲＥを含むグラム陽性球菌に代表される耐性菌に対して強力な抗菌活性を示し、薬剤として用いられる。



I