

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2006年11月23日 (23.11.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/123792 A1

(51) 国際特許分類:

C07D 401/04 (2006.01) A61P 31/04 (2006.01)
 A61K 31/4709 (2006.01) A61P 31/00 (2006.01)
 A61K 31/5383 (2006.01) C07D 498/06 (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/310069

(22) 国際出願日: 2006年5月19日 (19.05.2006)

(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2005-146386 2005年5月19日 (19.05.2005) JP
 特願2005-344514
 2005年11月29日 (29.11.2005) JP
 特願2006-080629 2006年3月23日 (23.03.2006) 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]; 〒1038234 東京都中央区日本橋3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 (TAKA-HASHI, Hisashi) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1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). 稲垣 裕章 (INAGAKI, Hiroaki) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1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). 小森谷 聡 (KOMORIYA, Satoshi) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1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). 竹村 真 (TAKEMURA, Makoto) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1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). 宮内 理江 (MIYAUCHI, Rie) [JP/JP]; 〒1348630 東京都江戸川区北葛西1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: 特許業務法人アルガ特許事務所 (THE PATENT CORPORATE BODY ARUGA PATENT OFFICE); 〒1030013 東京都中央区日本橋人形町1丁目3番6号共同ビル Tokyo (JP).

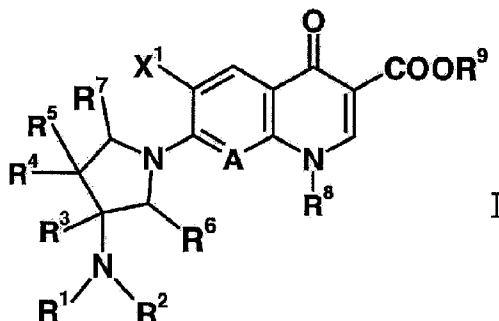
(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KN, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, LY, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,

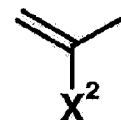
[続葉有]

(54) Title: TRI- OR TETRA-SUBSTITUTED-3-AMINOPYRROLIDINE DERIVATIVES

(54) 発明の名称: トリー、テトラー置換ー3ーアミノピロリジン誘導体



I



II

(57) Abstract: It is intended to provide quinolone type synthetic antibacterial agents having a potent antibacterial activity against a broad scope of gram-positive and gram-negative bacteria and a high safety and remedies for infections. A compound represented by the following general formula (I), its salt or hydrate thereof: I wherein R¹ and R² represent each hydrogen, etc.; R³ represents C₁₋₆ alkyl, etc.; R⁴ and R⁵ independently represent each hydrogen, C₁₋₆ alkyl, etc., provided that R⁴ and R⁵ are not hydrogen atoms at the same time, and the above substituents R⁴ and R⁵ may be united and form a spiro ring structure together with the pyrrolidine ring; R⁶ and R⁷ independently represent each hydrogen or C₁₋₆ alkyl; R⁸ represents a C₁₋₆ haloalkyl group, etc.; X¹ represents hydrogen or halogen; and A represents a nitrogen atom or a partial structure represented by the following general formula (II).

[続葉有]

WO 2006/123792 A1



IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).

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。

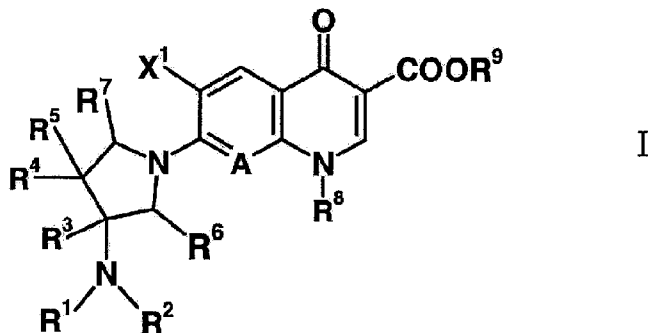
添付公開書類:

— 国際調査報告書

(57) 要約:

グラム陽性菌およびグラム陰性菌に対して広範で、且つ、強力な抗菌活性を示し、しかも高い安全性を有するキノロン系合成抗菌薬および感染症治療薬を提供する。

下記の式(I)で表わされる化合物、その塩、またはそれらの水和物。



[式中、 R^1 および R^2 は、水素原子等を示し；

R^3 は、炭素数1から6のアルキル基等を示し；

R^4 および R^5 は、それぞれ独立に、水素原子、炭素数1から6のアルキル基等を示し、ただし、 R^4 および R^5 は、同時に水素原子となることはなく、

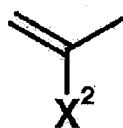
さらに、上記の置換基 R^4 および R^5 は一体化して、ピロリジン環と共にスピロ環状構造を形成してもよく、

R^6 および R^7 は、それぞれ独立に、水素原子または炭素数1から6のアルキル基を示し；

R^8 は、炭素数1から6のハロゲン置換アルキル基等を示し；

X^1 は、水素原子またはハロゲン原子を示し；

Aは、窒素原子または式(II)



で表わされる部分構造を示す。]