(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
2006 年7 月27 日 (27.07.2006)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2006/077984 A1

(51) 国際特許分類:
C07D 401/04 (2006.01) *A61P 31/00* (2006.01)
A61K 31/4709 (2006.01) *A61P 31/04* (2006.01)

(21) 国際出願番号: PCT/JP2006/300884

(22) 国際出願日: 2006 年1 月20 日 (20.01.2006)

(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2005-013738 2005 年1 月21 日 (21.01.2005) 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 (TAKAHASHI, 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). 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). 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).

(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.

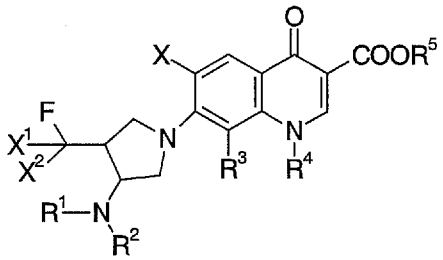
(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, LV, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

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: FLUOROALKYLPYRROLIDINE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: フルオロアルキルピロリジン誘導体



(1)

(57) Abstract: A compound represented by the following formula (1), a salt thereof, or a hydrate of either. [Chemical formula 1] (1) [In the formula, R^1 represents hydrogen, optionally substituted alkyl, or cycloalkyl or represents substituted carbonyl derived from an amino acid, dipeptide, or tripeptide; R^2 represents hydrogen, optionally substituted alkyl, or cycloalkyl; R^3 represents alkyl or haloalkyl; R^4 represents cycloalkyl or halogenated cycloalkyl; R^5 represents hydrogen, phenyl, acetoxymethyl, pivaloyloxymethyl, ethoxycarbonyl, choline, dimethylaminoethyl, 5-indanyl, phthalidyl, 5-alkyl-2-oxo-1,3-dioxol-4-ylmethyl, 3-acetoxy-2-oxobutyl, or phenylalkyl constituted of alkylene and phenyl; X^1 and X^2 each independently represents hydrogen or halogeno; and X represents hydrogen or halogeno.] The compound has potent antibacterial activity against a wide range of gram-positive bacteria and gram-negative bacteria and is highly safe. It is useful as a quinolone antibacterial drug and a preventive and/or therapeutic agent for infectious diseases.

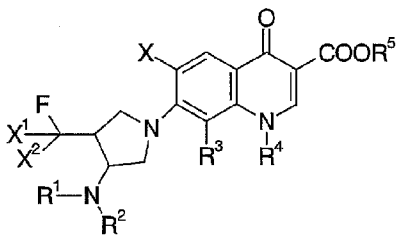
[続葉有]

WO 2006/077984 A1

(57) 要約:

本発明は、下記式(1)で表わされる化合物、その塩、またはそれらの水和物に関する。

【化1】



(1)

[式中、R^1は、水素原子、置換基を有していてもよいアルキル基、またはシクロアルキル基を表わすか、あるいはアミノ酸、ジペプチド、またはトリペプチド由来の置換カルボニル基を表わす;
R^2は、水素原子、置換基を有していてもよいアルキル基、またはシクロアルキル基を表わす;
R^3は、アルキル基、またはハロゲン置換アルキル基を表わす;
R^4は、シクロアルキル基、またはハロゲン置換シクロアルキル基を表わす;
R^5は、水素原子、フェニル基、アセトキシメチル基、ピバロイルオキシメチル基、エトキシカルボニル基、コリン基、ジメチルアミノエチル基、5－インダニル基、フタリジル基、5－アルキル－2－オキソ－1，3－ジオキソール－4－イルメチル基、3－アセトキシ－2－オキソブチル基、またはアルキレン基とフェニル基から構成されるフェニルアルキル基を表わす;
X^1およびX^2は、それぞれ独立に、水素原子またはハロゲン原子を表わす;
Xは、水素原子またはハロゲン原子を表わす。]

この化合物は、グラム陽性菌およびグラム陰性菌に対して幅広く強力な抗菌活性を示し、かつ高い安全性を有し、キノロン系抗菌薬、並びに感染症の予防および／または治療薬として有用である。