

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成26年5月8日(2014.5.8)

【公開番号】特開2012-12388(P2012-12388A)

【公開日】平成24年1月19日(2012.1.19)

【年通号数】公開・登録公報2012-003

【出願番号】特願2011-125191(P2011-125191)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/706	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/473	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
C 0 7 D	413/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/553	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
A 6 1 K	31/4741	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	31/47	(2006.01)
A 6 1 K	31/4709	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
C 0 7 D	221/10	(2006.01)
C 0 7 D	405/04	(2006.01)
C 0 7 D	409/04	(2006.01)
C 0 7 D	221/16	(2006.01)
C 0 7 D	491/052	(2006.01)
C 0 7 D	491/048	(2006.01)
C 0 7 D	471/04	(2006.01)
C 0 7 D	215/26	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/06	(2006.01)
C 0 7 D	405/12	(2006.01)
C 0 7 D	215/48	(2006.01)
C 0 7 D	401/04	(2006.01)
C 0 7 H	19/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/706			
A 6 1 P	25/16			
A 6 1 P	25/28			
A 6 1 P	43/00	1	1	1
A 6 1 K	31/473			
A 6 1 K	31/5377			
C 0 7 D	413/14			
A 6 1 K	31/553			
A 6 1 K	31/675			
A 6 1 K	31/4741			

A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/4745  
 A 6 1 K 31/47  
 A 6 1 K 31/4709  
 A 6 1 K 31/551  
 A 6 1 K 31/506  
 C 0 7 D 221/10  
 C 0 7 D 405/04  
 C 0 7 D 409/04  
 C 0 7 D 221/16  
 C 0 7 D 491/052  
 C 0 7 D 491/048  
 C 0 7 D 471/04 1 1 2 T  
 C 0 7 D 215/26  
 C 0 7 D 401/12  
 C 0 7 D 401/06  
 C 0 7 D 405/12  
 C 0 7 D 215/48  
 C 0 7 D 401/04  
 C 0 7 H 19/04

## 【手続補正書】

【提出日】平成26年3月20日(2014.3.20)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

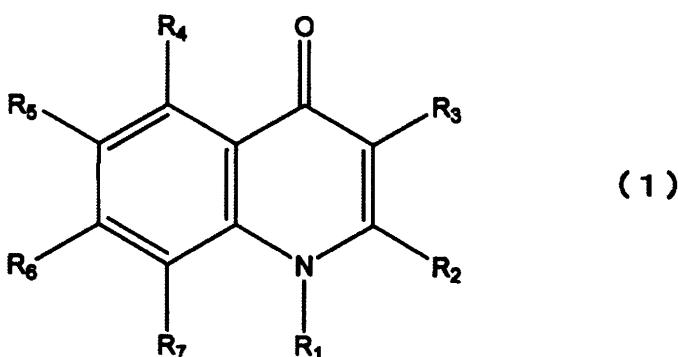
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

一般式(1)

## 【化1】



[式中、

R<sub>1</sub>は、

(1)水素、

(2)C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル基、(3)ハロゲン置換C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル基、(4)C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルケニル基、(5)C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルカノイル基、(6)ハロゲン置換C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルカノイル基、

- ( 7 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 8 ) フェニル  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 9 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルカノイル基、
- ( 10 ) フェニル  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルカノイル基、
- ( 11 )  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 12 )  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 13 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 14 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 15 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 16 )  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキルチオカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 17 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 18 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 19 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 20 )  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 21 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 22 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニルカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 23 )  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 24 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 25 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 26 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 27 ) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 28 ) オキサゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 29 )  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 30 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基、  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいピペラジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 31 ) モルホリニル基を 1 個以上有していてもよいピペリジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 32 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個以上有していてもよいアゼチジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 33 ) オキソ基を 1 個以上有していてもよいイソインドリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 34 )  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 35 )  $C_{1-6}$  アルキル基；モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいピペリジル基；及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 36 ) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 37 ) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- ( 38 ) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及びヒドロキシ保護基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ基、

もよいベンゾイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいテトラヒドロピラニル基または

(40)  $C_{1-6}$  アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシカルボニルアミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基を1個以上有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルペリジル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよい  $C_{1-6}$  アルカノイルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基を示す。

$R_2$  は、

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、

(7)  $C_{1-6}$  アルキル基；ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基；ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基を1個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいカルバモイル基、

(8)  $C_{1-6}$  アルキル基を1個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(9) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(10)  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルキル基を1個以上有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(11) ジアゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(12)  $C_{1-6}$  アルキル基、ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(13)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基または

(14) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基

を示す。

$R_3$  は、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示す。

ここで、上記  $R_3$  で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記(1)～(14)からなる群から選ばれた基が1個以上置換していてもよい：

(1)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(7) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、又はベンジルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(9) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(10)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12)  $C_{1-6}$  アルキル基を1個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルコキ

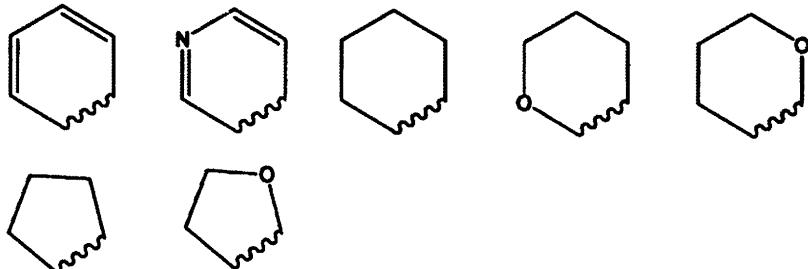
シ基、

(13) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルペリジルカルボニル基、

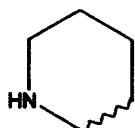
$R_4$  と  $R_5$  が結合して、

【化 2】



または、 $C_{1-6}$  アルキル及びオキソ基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよい

【化 3】



を構築している。

$R_6$  は、水素または  $C_{1-6}$  アルコキシ基を示す。

$R_7$  は、下記 (1) ~ (11) のいずれかの基を示す。

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(3) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(4) ベンジルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(5)  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(6)  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(7)  $C_{1-6}$  アルキル基及びシクロ C 3 - C 8 アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいアミノ基、

(8) シクロ C 3 - C 8 アルキルオキシ基、

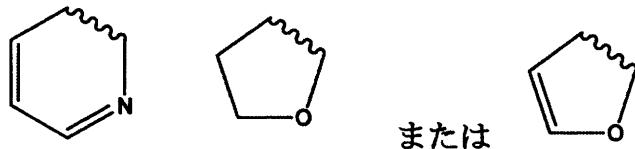
(9) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(10)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(11) ピロリジニル基；

あるいは  $R_6$  と  $R_7$  が結合して、

【化 4】



または

を構築してもよい。】

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

【請求項 2】

$R_1$  が、

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(3) ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基、

- ( 4 )  $C_{2-6}$  アルケニル基、  
 ( 5 )  $C_{1-6}$  アルカノイル基、  
 ( 6 ) ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルカノイル基、  
 ( 7 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 8 ) フェニル  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 9 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルカノイル基、  
 ( 10 ) フェニル  $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルカノイル基、  
 ( 11 )  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 12 ) アミノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 13 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 14 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 15 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 16 ) アミノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキルチオカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 17 ) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 18 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 19 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基  
  
 ( 20 )  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 21 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 22 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニルカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 23 )  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 24 ) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 25 )  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 26 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 27 ) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 28 ) オキサゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 29 ) アミノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 30 ) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 31 ) ピペリジン環上にモルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 32 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 33 ) イソインドリン環上にオキソ基を 2 個有していてもよいイソインドリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 34 ) アミノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、  
 ( 35 ) カルバモイル基上に  $C_{1-6}$  アルキル基；モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペリジル基；及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基から選ばれた基を 1 個有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(36) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(37) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいベンゾイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(39) ヒドロキシ基を 3 個及びヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または

(40)  $C_{1-6}$  アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシカルボニルアミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピペリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよい  $C_{1-6}$  アルカノイルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基

を示し、

$R_2$  が、

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、

(7)  $C_{1-6}$  アルキル基；ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基；ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基；ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル基、

(8) カルバモイル基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(9) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(10) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(11) ジアゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、または

(12) アミノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基、ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基

を示し、

$R_3$  が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記  $R_3$  で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記 (1) ~ (14) からなる群から選ばれた基が 1 個もしくは 2 個置換していてもよい：

(1)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(7) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

( 9 ) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 10 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 11 ) ピロリジルカルボニル基、  
 ( 12 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> - 6  
 アルコキシ基、  
 ( 13 ) モルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル基、  
 ( 14 ) モルホリニルペリジルカルボニル基、  
 R<sub>6</sub> が、水素または C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基を示し、  
 R<sub>7</sub> が、下記 ( 1 ) ~ ( 11 ) のいずれかの基を示す、  
 ( 1 ) 水素、  
 ( 2 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 3 ) ヒドロキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 4 ) ベンジルオキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 5 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 6 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基からなる群から選ばれた  
 基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 7 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びシクロ C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> アルキル基からなる群から選ばれた基を  
 2 個有していてもよいアミノ基、  
 ( 8 ) シクロ C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> アルキルオキシ基、  
 ( 9 ) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 10 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
 ( 11 ) ピロリジニル基  
 を示す、

請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 3】

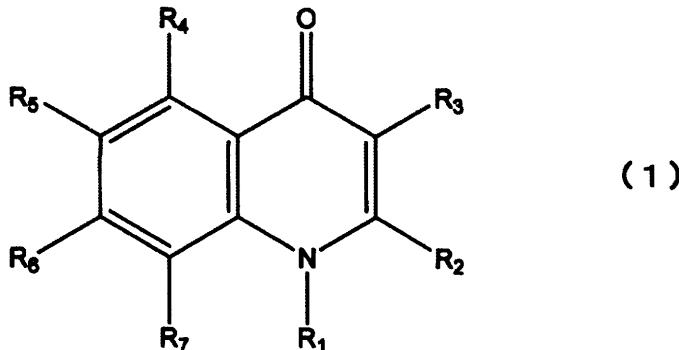
R<sub>1</sub> が、  
 ( 1 ) 水素、  
 ( 2 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 3 ) ハロゲン置換 C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 24 ) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 25 ) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 27 ) モルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 28 ) オキサゼパニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 30 ) ピペラジン環上に C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個有していてもよ  
 いピペラジル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 31 ) ピペリジル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
 ( 35 ) モルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> - 6  
 アルキル基、または  
 ( 36 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ C<sub>1</sub> -  
 6 アルキル基  
 を示し、  
 R<sub>2</sub> が、  
 ( 1 ) 水素、または  
 ( 2 ) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基  
 を示し、  
 R<sub>3</sub> が、フェニル基、チエニル基またはフリル基を示し、  
 ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル基、チエニル基またはフリル基上には、C<sub>1</sub> - 6 ア  
 ルコキシ基が 1 個置換していてもよく、  
 R<sub>6</sub> が、水素を示し、  
 R<sub>7</sub> が、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基を示す、

請求項 2 に記載の医薬。

【請求項 4】

一般式 (1)

【化 5】



[式中、

R<sub>1</sub> は、

(1) 水素、

(2) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(3) ハロゲン置換 C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(4) C<sub>2</sub> - 6 アルケニル基、

(5) C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、

(6) ハロゲン置換 C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、

(7) ヒドロキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(8) フェニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(9) ヒドロキシ C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、

(10) フェニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、

(11) C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(12) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(13) ヒドロキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(14) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(15) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(16) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(17) ヒドロキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(18) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(19) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(20) C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(21) ピペラジン環上に C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(22) ピペラジン環上に C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニルカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(23) C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(24) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(25) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(26) ピペラジン環上に C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(27) モルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(28) オキサゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(29)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(30) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいピペラジル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(31) モルホリニル基を 1 個以上有していてもよいピペリジル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(32) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個以上有していてもよいアゼチジル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(33) オキソ基を 1 個以上有していてもよいイソインドリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(34)  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(35)  $C_{1-6}$  アルキル基；モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいピペリジル基；及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(36) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(37) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及びヒドロキシ保護基を 1 個以上有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいベンゾイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいテトラヒドロピラニル基または

(40)  $C_{1-6}$  アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシカルボニルアミノ基； $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピペリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよい  $C_{1-6}$  アルカノイルアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基を示す。

R<sub>2</sub> は、

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基、

(7)  $C_{1-6}$  アルキル基；ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基；ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル基、

(8)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(9) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(10)  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(11) ジアゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、

(12)  $C_{1-6}$  アルキル基、ハロゲン置換  $C_{1-6}$  アルキル基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  ア

ルキル基及びモルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(13)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基または

(14) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基

を示す。

$R_3$  は、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示す。

ここで、上記  $R_3$  で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記 (1) ~ (14) からなる群から選ばれた基が 1 個以上置換していてもよい：

(1)  $C_{1-6}$  アルキル基、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(3)  $C_{1-6}$  アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、

(7) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、又はベンジルオキシ  $C_{1-6}$

アルコキシ基、

(9) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(10)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(13) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個以上有していてもよいカルバモイル基、

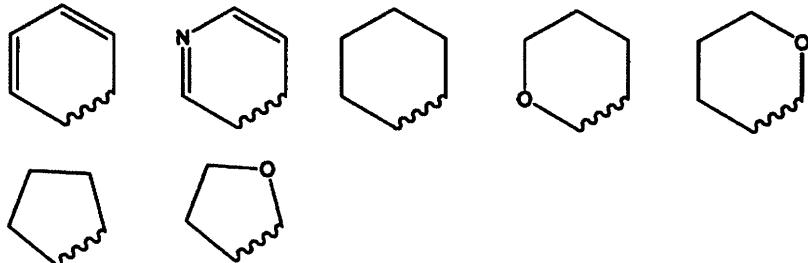
(14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

$R_4$  は、ハロゲン、 $C_{1-6}$  アルキル基または  $C_{1-6}$  アルコキシ基を示す。

$R_5$  は水素またはハロゲンを示す。

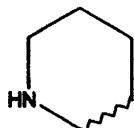
あるいは  $R_4$  と  $R_5$  が結合して、

【化 6】



または、 $C_{1-6}$  アルキル及びオキソ基からなる群から選ばれた基を 1 個以上有していてもよい

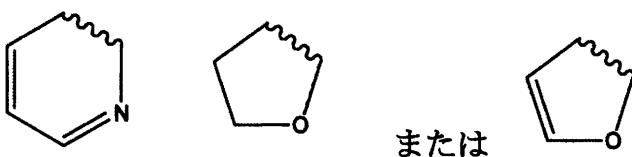
【化 7】



を構築している。

$R_6$  と  $R_7$  が結合して、

【化8】



または

を構築している。】

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

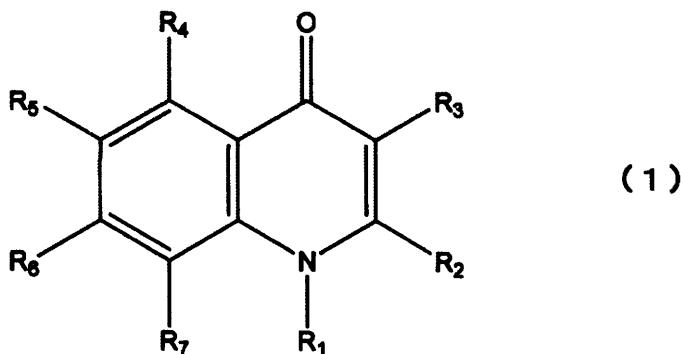
【請求項5】

R<sub>1</sub> が、(1) 水素、(2) C<sub>1</sub>~6 アルキル基または(36) C<sub>1</sub>~6 アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ C<sub>1</sub>~6 アルキル基を示し、R<sub>2</sub> が、水素を示し、R<sub>3</sub> が、フェニル基を示し、ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル基上には、C<sub>1</sub>~6 アルコキシ基が1個置換してもよく、R<sub>4</sub> が、C<sub>1</sub>~6 アルキル基またはC<sub>1</sub>~6 アルコキシ基を示し、R<sub>5</sub> が、水素を示す、請求項4に記載の医薬。

【請求項6】

一般式(1)

【化9】



[式中、

R<sub>1</sub> は、(3) ハロゲン置換 C<sub>1</sub>~6 アルキル基、(4) C<sub>2</sub>~6 アルケニル基、(5) C<sub>1</sub>~6 アルカノイル基、(6) ハロゲン置換 C<sub>1</sub>~6 アルカノイル基、(7) ヒドロキシ C<sub>1</sub>~6 アルキル基、(8) フェニル C<sub>1</sub>~6 アルコキシ C<sub>1</sub>~6 アルキル基、(9) ヒドロキシ C<sub>1</sub>~6 アルカノイル基、(10) フェニル C<sub>1</sub>~6 アルコキシ C<sub>1</sub>~6 アルカノイル基、(11) C<sub>1</sub>~6 アルキルチオ C<sub>1</sub>~6 アルキル基、(12) C<sub>1</sub>~6 アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ C<sub>1</sub>~6 アルキルチオ C<sub>1</sub>~6 アルキル基、

- (13) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (14) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (15)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルチオ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (16)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキルチオカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (17) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (18) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (19)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (20)  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (21) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (22) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニルカルボニル  $C_{1-6}$  アルキルスルホニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (23)  $C_{1-6}$  アルカノイル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (24) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (25)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (26) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (27) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (28) オキサゼパニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (29)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (30) ピペラジン環上に  $C_{1-6}$  アルキル基、 $C_{1-6}$  アルコキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (31) ピペリジン環上にモルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (32) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (33) オキソ基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいイソインドリニル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (34)  $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (35)  $C_{1-6}$  アルキル基；モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基； $C_{1-6}$  アルキル基及び  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペリジル基；及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル  $C_{1-6}$  アルキル基から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (36) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (37) ホスホノ基上に  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ  $C_{1-6}$  アルカノイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及び  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいベンゾイルオキシ  $C_{1-6}$  アルキル基、
- (39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を 1 個～4 個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または
- (40)  $C_{1-6}$  アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基； $C_{1-6}$  アル

コキシカルボニルアミノ基；C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピペリジル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルカノイルアミノC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基

を示し、

R<sub>2</sub>が、

(1) 水素、

(2) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(3) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルカノイル基、

(4) ヒドロキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシカルボニル基、

(7) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基；ハロゲン置換C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基；ヒドロキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基；ピペラジン環上にC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいカルバモイル基、

(8) カルバモイル基上にC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(9) モルホリニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(10) ピペラジン環上にC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基及びC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(11) ジアゼパニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、または

(12) アミノ基上にC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、ハロゲン置換C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、ヒドロキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基

を示し、

R<sub>3</sub>が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記R<sub>3</sub>で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記(1)~(14)からなる群から選ばれた基が1個もしくは2個置換していてもよい：

(1) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(2) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(3) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基、

(7) ヒドロキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、又はベンジルオキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(9) カルボキシC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(10) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12) カルバモイル基上にC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルコキシ基、

(13) モルホリニルC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

R<sub>4</sub>が、ハロゲンを示し、

R<sub>5</sub>が、水素またはハロゲンを示し、

R<sub>6</sub> が、水素またはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基を示し、  
R<sub>7</sub> が、下記(2)～(11)のいずれかの基を示す、  
(2) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(3) ヒドロキシC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(4) ベンジルオキシC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(5) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(6) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(7) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びシクロC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ基、  
(8) シクロC<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> アルキルオキシ基、  
(9) カルボキシC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(10) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、  
(11) ピロリジニル基】

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

【請求項7】

R<sub>1</sub> が、  
(3) ハロゲン置換C<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(4) C<sub>2</sub> - 6 アルケニル基、  
(5) C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、  
(6) ハロゲン置換C<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、  
(8) ベンジルオキシC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(10) ベンゾイルオキシC<sub>1</sub> - 6 アルカノイル基、  
(11) C<sub>1</sub> - 6 アルキルチオC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(12) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1</sub> - 6 アルキルチオC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(13) ヒドロキシC<sub>1</sub> - 6 アルキルチオC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(14) カルボキシC<sub>1</sub> - 6 アルキルチオC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(15) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキルチオC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(16) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1</sub> - 6 アルキルチオカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(17) ヒドロキシC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(18) カルボキシC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(19) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(20) C<sub>1</sub> - 6 アルカノイルC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(21) ピペラジン環上にC<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(22) ピペラジン環上にC<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキルスルホニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(24) カルボキシC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(25) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(26) ピペラジン環上にC<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(27) モルホリニルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(29) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、  
(30) ピペラジン環上にC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシC<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいピペラジルC<sub>1</sub> - 6 アルキル基、

(31) モルホリニル基を1個有していてもよいペリジルC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(32) アゼチジン環上にヒドロキシ基を1個有していてもよいアゼチジルC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(33) オキソ基を1個もしくは2個有していてもよいイソインドリニルC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(34) C<sub>1-6</sub>アルキル基及びC<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1-6</sub>アルカノイルオキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(35) C<sub>1-6</sub>アルキル基；モルホリニルC<sub>1-6</sub>アルキル基；C<sub>1-6</sub>アルキル基及びC<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいペリジル基；及びC<sub>1-6</sub>アルキル基を1個有していてもよいペラジニルC<sub>1-6</sub>アルキル基から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいカルバモイルC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(36) ホスホノ基上にC<sub>1-6</sub>アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(37) ホスホノ基上にC<sub>1-6</sub>アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシC<sub>1-6</sub>アルカノイルオキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及びC<sub>1-6</sub>アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいベンゾイルオキシC<sub>1-6</sub>アルキル基、

(39) ヒドロキシ基、ヒドロキシC<sub>1-6</sub>アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を1個～4個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または

(40) C<sub>1-6</sub>アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルアミノ基；C<sub>1-6</sub>アルコキシC<sub>1-6</sub>アルキル基を1個有していてもよいペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルペリジル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいC<sub>1-6</sub>アルカノイルアミノC<sub>1-6</sub>アルキル基

を示し、

R<sub>2</sub>が、水素を示し、

R<sub>3</sub>が、フェニル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記R<sub>3</sub>で示されるフェニル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記(1)、(2)、(4)、(5)、(7)、(8)、(10)、(11)及び(12)からなる群から選ばれた基が1個もしくは2個置換していてもよい：

(1) C<sub>1-6</sub>アルキル基、

(2) C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(7) ヒドロキシC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

(10) C<sub>1-6</sub>アルコキシカルボニルC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12) カルバモイルC<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

R<sub>4</sub>が、ハロゲンを示し、

R<sub>5</sub>が、水素またはハロゲンを示し、

R<sub>6</sub>が、水素を示し、

R<sub>7</sub>が、下記(2)、(7)、(8)または(11)の基を示す、

(2) C<sub>1-6</sub>アルコキシ基、

(7) C<sub>1-6</sub>アルキル基及びシクロC<sub>3-C8</sub>アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ基、

(8) シクロC<sub>3-C8</sub>アルキルオキシ基、

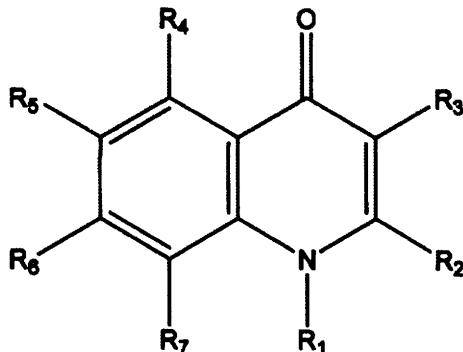
(11) ピロリジニル基を示す、

請求項 6 に記載の医薬。

【請求項 8】

一般式 (1)

【化 10】



(1)

[式中、

R<sub>1</sub> は、

(1) 水素、または

(2) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

を示し、

R<sub>2</sub> が、

(3) C<sub>1</sub> ~ 6 アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6) C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシカルボニル基、

(7) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基；ハロゲン置換 C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基；ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基；C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル基、

(8) カルバモイル基上に C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(9) モルホリニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(10) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基及び C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基を 1 個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を 1 個有していてもよいピペラジニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(11) ジアゼパニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(12) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換 C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、ヒドロキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基

(13) C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基または

(14) カルボキシ C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基

を示し、

R<sub>3</sub> が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記 (1) ~ (14) からなる群から選ばれた基が 1 個置換してもよい：

(1) C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル基、

(2) C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ基、

(3) C<sub>1</sub> ~ 6 アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(7) ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、又はベンジルオキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(9) カルボキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(10) C<sub>1</sub>~6アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12) C<sub>1</sub>~6アルキル基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(13) モルホリニルC<sub>1</sub>~6アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

R<sub>4</sub>が、ハロゲン、C<sub>1</sub>~6アルキル基またはC<sub>1</sub>~6アルコキシ基を示し、

R<sub>5</sub>が、水素またはハロゲンを示し、

R<sub>6</sub>が、水素またはC<sub>1</sub>~6アルコキシ基を示し、

R<sub>7</sub>が、下記(1)~(11)のいずれかの基を示す、

(1) 水素、

(2) C<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(3) ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(4) ベンジルオキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(5) C<sub>1</sub>~6アルコキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(6) C<sub>1</sub>~6アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub>~6アルキル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(7) C<sub>1</sub>~6アルキル基及びシクロC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ基、

(8) シクロC<sub>3</sub>~C<sub>8</sub>アルキルオキシ基、

(9) カルボキシC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(10) C<sub>1</sub>~6アルコキシカルボニルC<sub>1</sub>~6アルコキシ基、

(11) ピロリジニル基】

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

【請求項9】

R<sub>1</sub>が、水素を示し、

R<sub>2</sub>が、

(3) C<sub>1</sub>~6アルカノイル基、

(4) ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6) C<sub>1</sub>~6アルコキシカルボニル基、

(7) C<sub>1</sub>~6アルキル基；ハロゲン置換C<sub>1</sub>~6アルキル基；ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルキル基；C<sub>1</sub>~6アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub>~6アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub>~6アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいカルバモイル基、

(8) C<sub>1</sub>~6アルキル基を1個有していてもよいカルバモイルC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(9) モルホリニルC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(10) C<sub>1</sub>~6アルキル基及びC<sub>1</sub>~6アルキル基を1個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個有していてもよいピペラジニルC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(11) ジアゼパニルC<sub>1</sub>~6アルキル基、

(12) C<sub>1</sub>~6アルキル基、ハロゲン置換C<sub>1</sub>~6アルキル基、ヒドロキシC<sub>1</sub>~6アルキル基及びモルホリニルC<sub>1</sub>~6アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノC<sub>1</sub>~6アルキル基または

(14) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルキル基

を示し、

$R_3$  が、フェニル基を示し、

ここで、上記  $R_3$  で示されるフェニル環上には、 $C_{1-6}$  アルコキシ基が 1 個置換している：

$R_4$  が、ハロゲンを示し、

$R_5$  が、水素を示し、

$R_6$  が、水素基を示し、

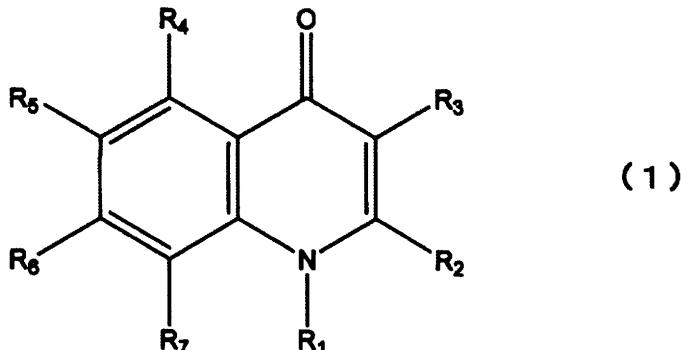
$R_7$  が、 $C_{1-6}$  アルコキシ基を示す、

請求項 8 に記載の一般式 (1) で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

【請求項 10】

一般式 (1)

【化 11】



〔式中、

$R_1$  が、

(1) 水素、または

(2)  $C_{1-6}$  アルキル基、

を示し、

$R_2$  が、水素を示し、

$R_3$  が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記  $R_3$  で示されるフェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基上には、下記 (7)、(8)、(9)、(10)、(12)、(13) 及び (14) からなる群から選ばれた基が 1 個置換している：

(7) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(8) ベンジルオキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(9) カルボキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(10)  $C_{1-6}$  アルコキシカルボニル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(12)  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(13) モルホリニル  $C_{1-6}$  アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

$R_4$  が、ハロゲンを示し、

$R_5$  が、水素またはハロゲンを示し、

$R_6$  が、水素または  $C_{1-6}$  アルコキシ基を示し、

$R_7$  が、下記 (1) ~ (11) のいずれかの基を示す、

(1) 水素、

(2)  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

(3) ヒドロキシ  $C_{1-6}$  アルコキシ基、

- (4) ベンジルオキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (5) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (6) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (7) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基及びシクロ C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub> アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ基、  
 (8) シクロ C<sub>3</sub>~C<sub>8</sub> アルキルオキシ基、  
 (9) カルボキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (10) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシカルボニル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (11) ピロリジニル基】

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

【請求項 11】

- R<sub>1</sub> が、水素を示し、  
 R<sub>3</sub> が、フェニル基を示し、  
 ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル環上には、下記 (7)~(10)、及び (12)~(14) からなる群から選ばれた基が 1 個置換している：  
 (7) ヒドロキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (8) ベンジルオキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (9) カルボキシ C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (10) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシカルボニル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (12) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (13) モルホリニル C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル基、  
 (14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

R<sub>4</sub> が、ハロゲンを示し、

R<sub>5</sub> が、水素を示し、

R<sub>6</sub> が、水素を示し、

R<sub>7</sub> が、下記 (2) または (11) の基を示す、

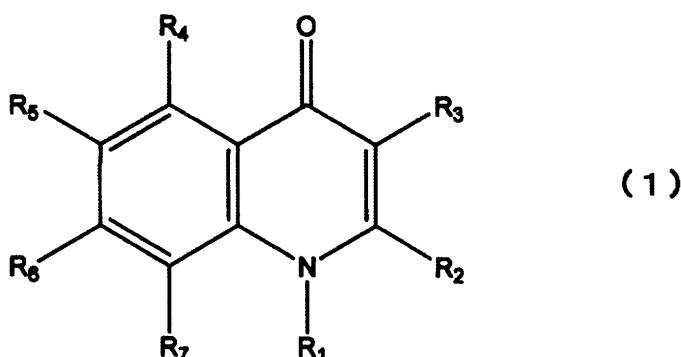
- (2) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルコキシ基、  
 (11) ピロリジニル基を示す、

請求項 10 に記載の医薬。

【請求項 12】

一般式 (1)

【化 12】



〔式中、

- R<sub>1</sub> が、  
 (1) 水素、または  
 (2) C<sub>1</sub>~<sub>6</sub> アルキル基、  
 を示し、

R<sub>2</sub> が、水素を示し、

R<sub>3</sub> が、フェニル基を示し、

ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル環上には、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基が 1 個置換している：

R<sub>4</sub> が、ハロゲン、C<sub>1</sub> - 6 アルキル基またはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基を示し、

R<sub>5</sub> が、水素またはハロゲンを示し、

R<sub>6</sub> が、水素またはC<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基を示し、

R<sub>7</sub> が、下記 (6)、(9) または (10) の基を示す、

(6) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、

(9) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、

(10) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基 ]

で表されるキノロン化合物またはその塩からなる医薬。

**【請求項 1 3】**

R<sub>1</sub> が、水素を示し、

R<sub>3</sub> が、フェニル基を示し、

ここで、上記 R<sub>3</sub> で示されるフェニル環上には、C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基が 1 個置換している：

R<sub>4</sub> が、ハロゲンを示し、

R<sub>5</sub> が、水素を示し、

R<sub>6</sub> が、水素を示し、

R<sub>7</sub> が、下記 (6)、(9)、(10) または (11) の基を示す、

(6) C<sub>1</sub> - 6 アルキル基及びモルホリニル C<sub>1</sub> - 6 アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいカルバモイル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、

(9) カルボキシ C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、

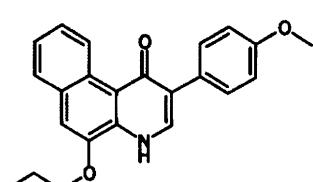
(10) C<sub>1</sub> - 6 アルコキシカルボニル C<sub>1</sub> - 6 アルコキシ基、

(11) ピロリジニル基を示す、

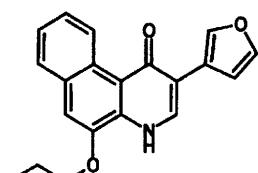
請求項 1 2 に記載の医薬。

**【請求項 1 4】**

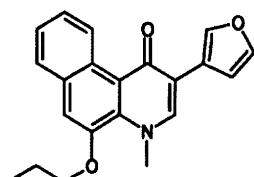
**【化 1 3】**



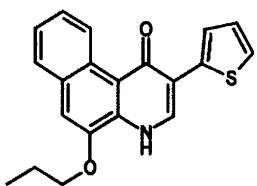
**【化 1 4】**



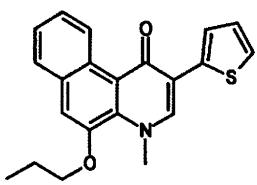
**【化 1 5】**



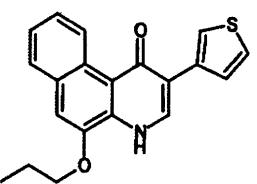
【化 1 6】



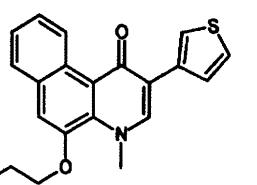
【化 1 7】



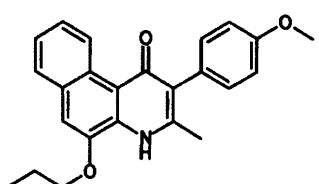
【化 1 8】



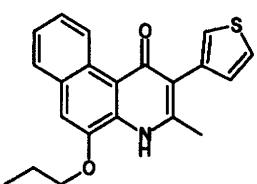
【化 1 9】



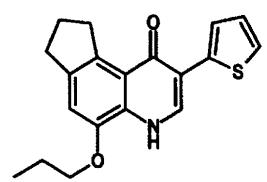
【化 2 0】



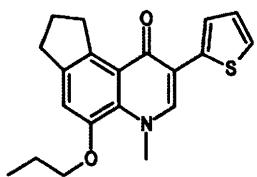
【化 2 1】



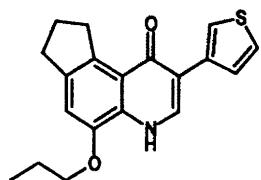
【化 2 2】



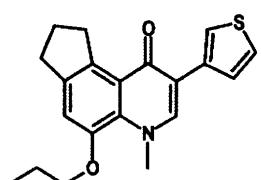
【化 2 3】



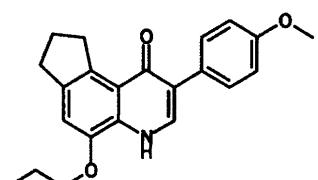
【化 2 4】



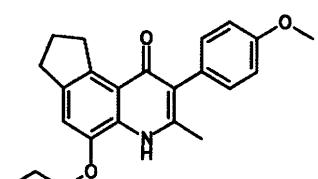
【化 2 5】



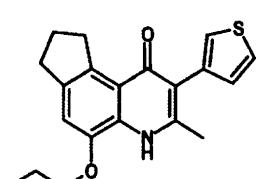
【化 2 6】



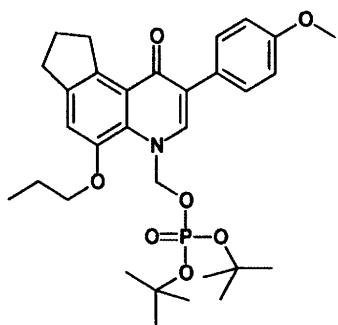
【化 2 7】



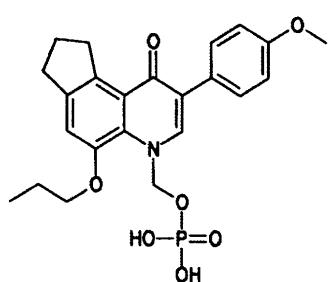
【化 2 8】



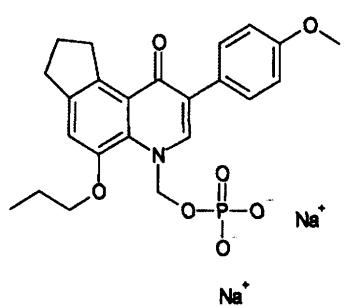
【化 2 9】



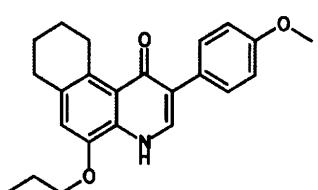
【化 3 0】



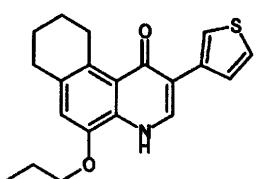
【化 3 1】



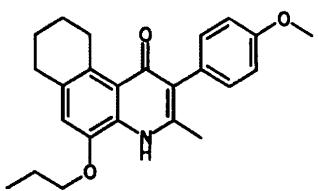
【化 3 2】



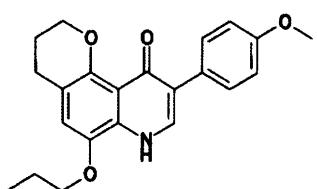
【化 3 3】



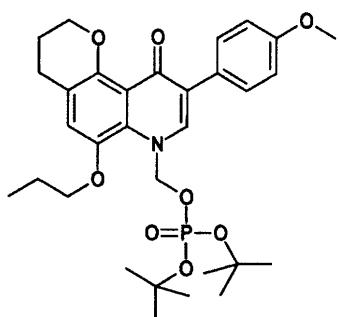
【化 3 4】



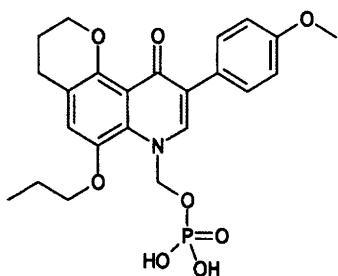
【化 3 5】



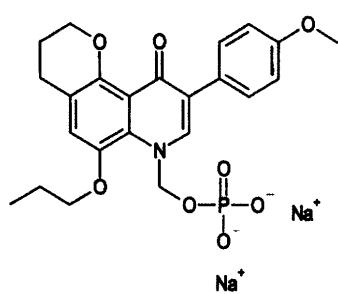
【化 3 6】



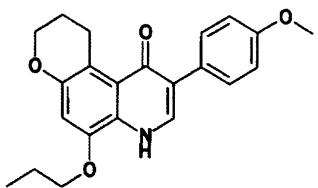
【化 3 7】



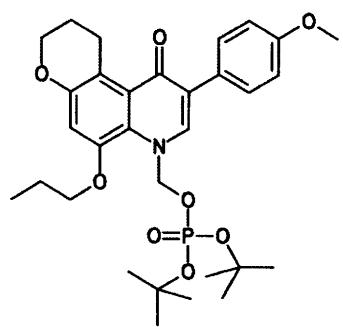
【化 3 8】



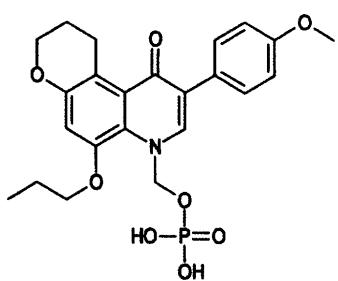
【化 3 9】



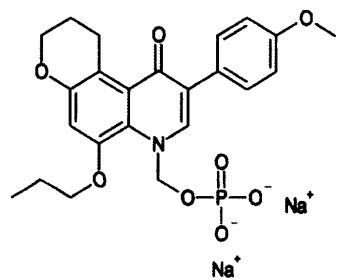
【化 4 0】



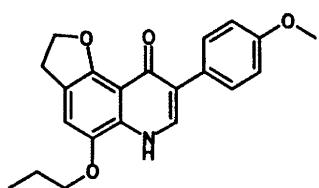
【化 4 1】



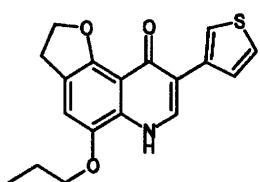
【化 4 2】



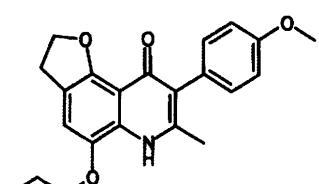
【化 4 3】



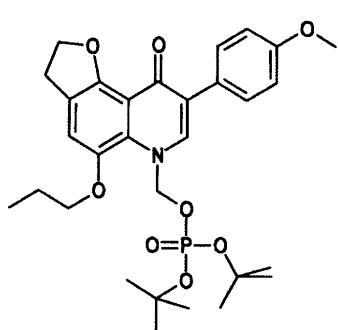
【化 4 4】



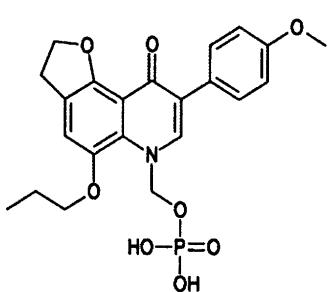
【化 4 5】



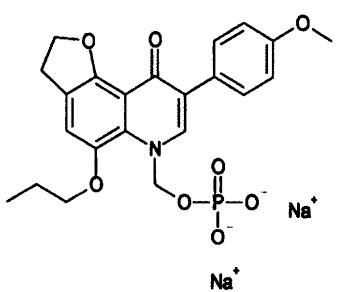
【化 4 6】



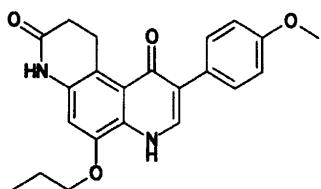
【化 4 7】



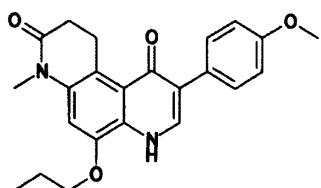
【化 4 8】



【化49】

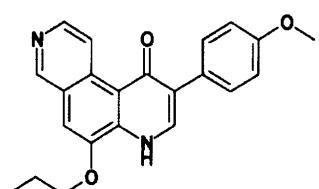


【化50】



又は

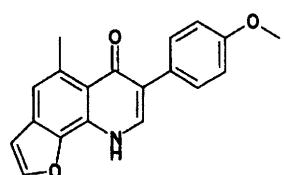
【化51】



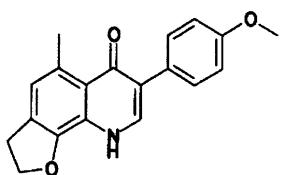
である請求項1に記載の医薬。

【請求項15】

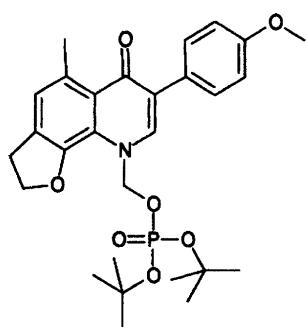
【化52】



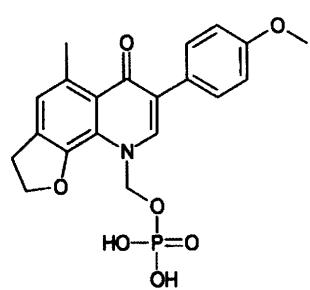
【化53】



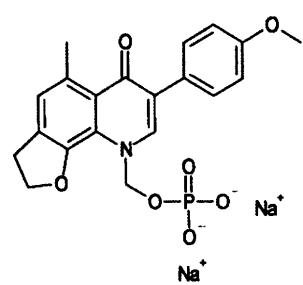
【化 5 4】



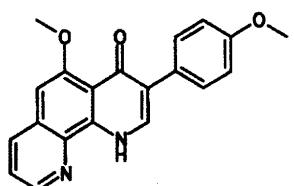
【化 5 5】



【化 5 6】



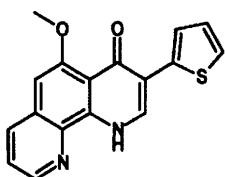
【化 5 7】



【化 5 8】

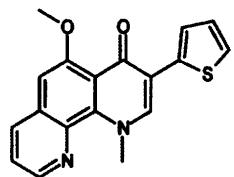


【化 5 9】



又は

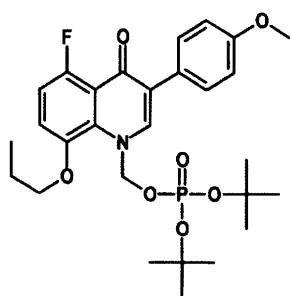
【化 6 0】



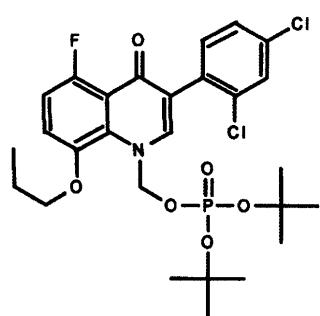
である請求項 4 に記載の医薬。

【請求項 1 6】

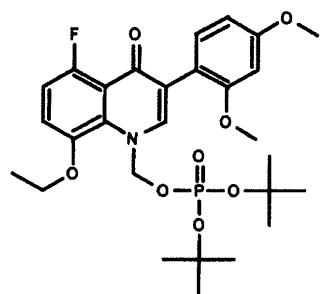
【化 6 1】



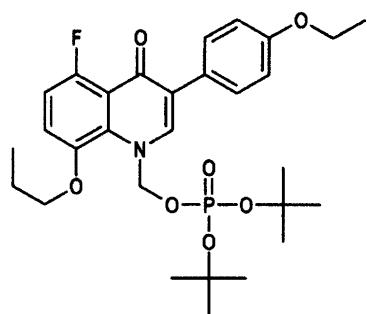
【化 6 2】



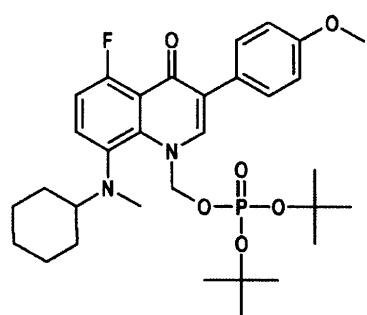
【化 6 3】



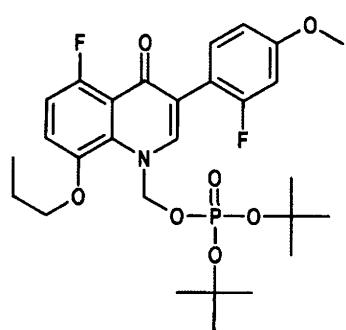
【化 6 4】



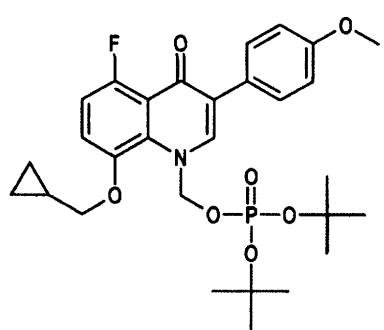
【化 6 5】



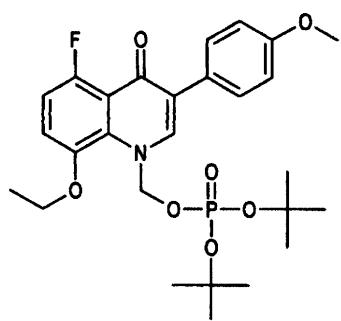
【化 6 6】



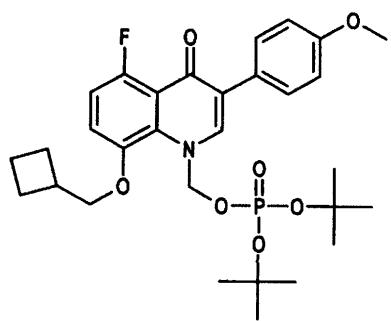
【化 6 7】



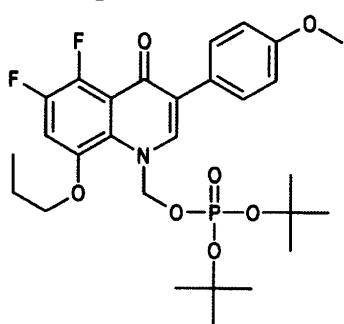
【化 6 8】



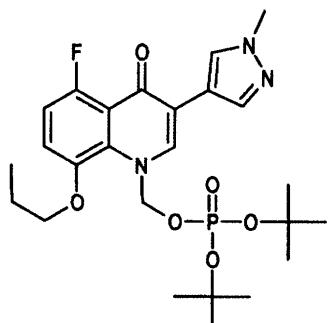
【化 6 9】



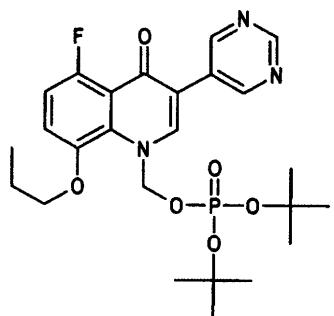
【化 7 0】



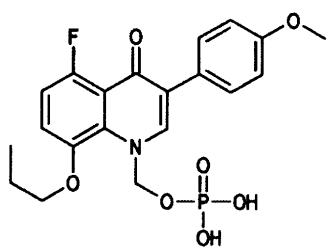
【化 7 1】



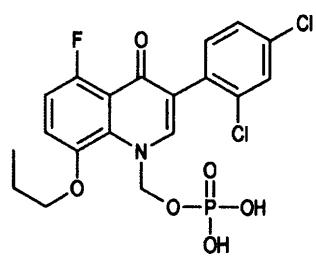
【化 7 2】



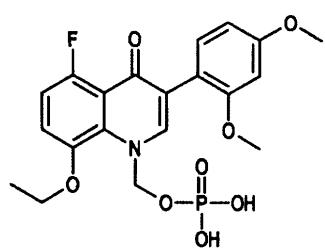
【化 7 3】



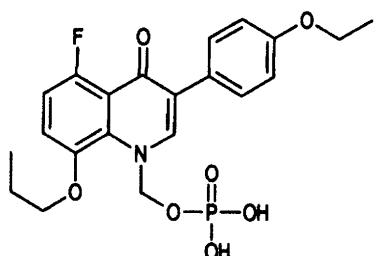
【化 7 4】



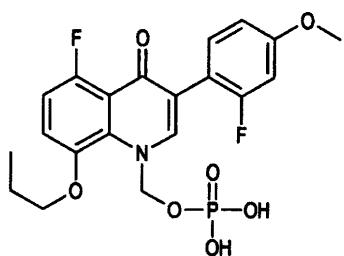
【化 7 5】



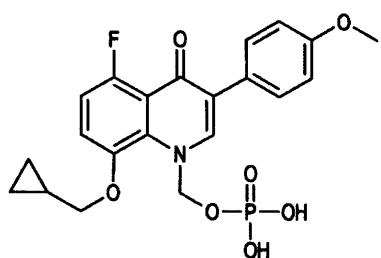
【化 7 6】



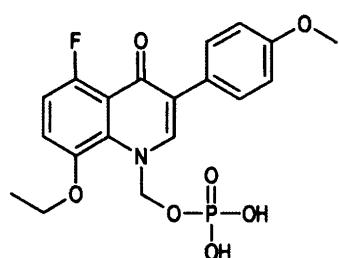
【化 7 7】



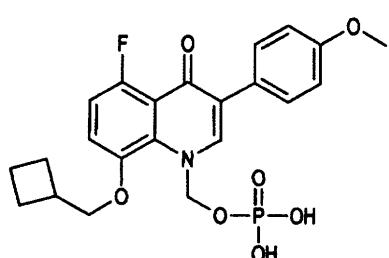
【化 7 8】



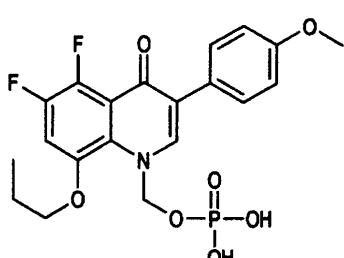
【化 7 9】



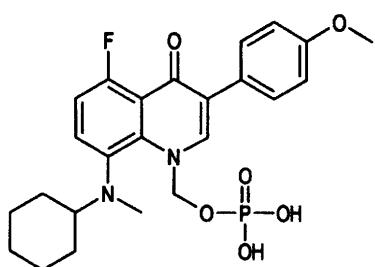
【化 8 0】



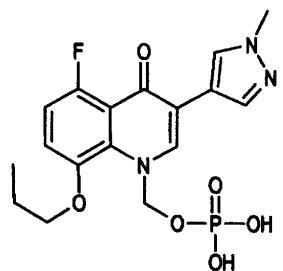
【化 8 1】



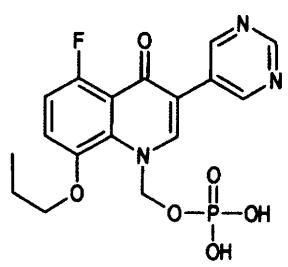
【化 8 2】



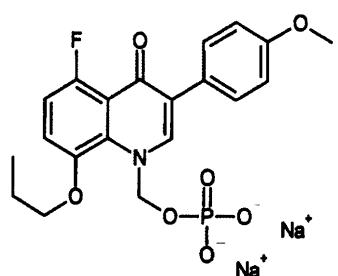
【化 8 3】



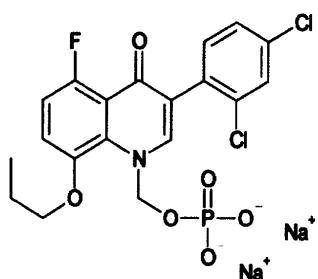
【化 8 4】



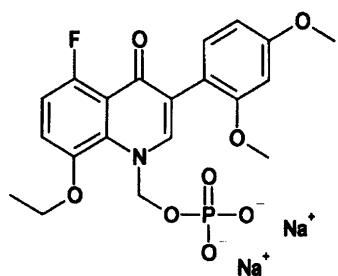
【化 8 5】



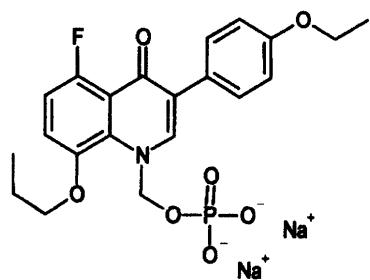
【化 8 6】



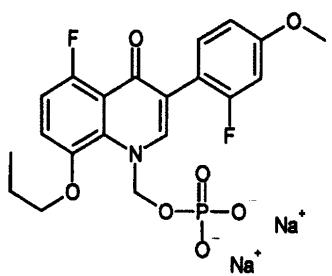
【化 8 7】



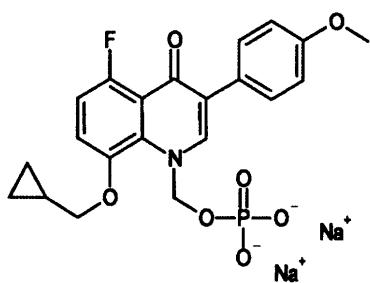
【化 8 8】



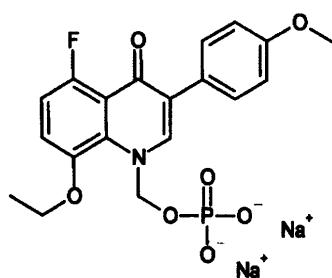
【化 8 9】



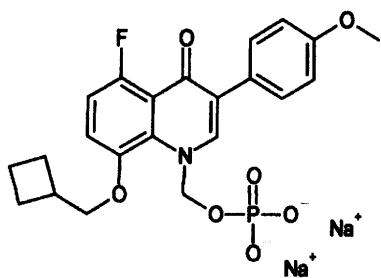
【化 9 0】



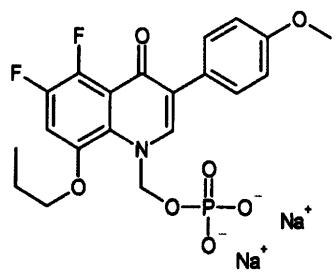
【化 9 1】



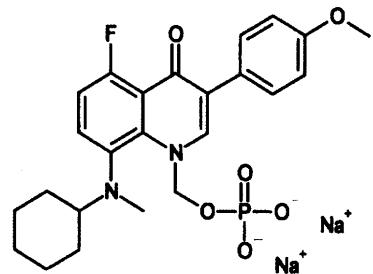
【化 9 2】



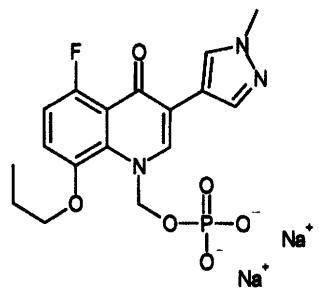
【化 9 3】



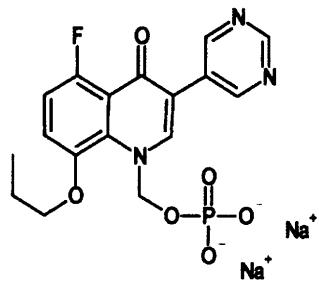
【化 9 4】



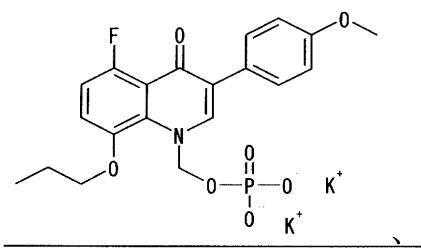
【化 9 5】



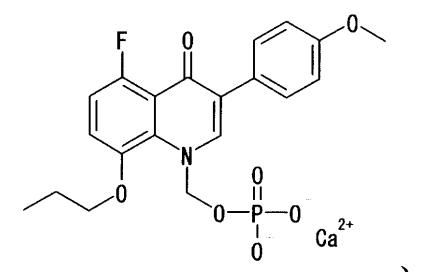
【化 9 6】



【化97】

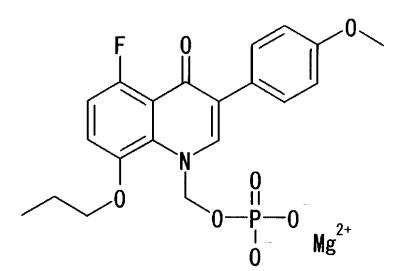


【化98】



又は

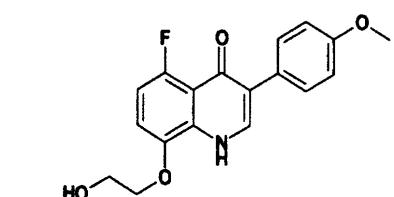
【化99】



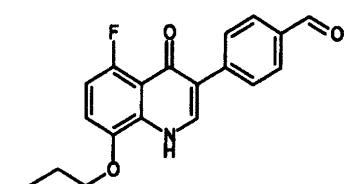
である請求項6に記載の医薬。

【請求項17】

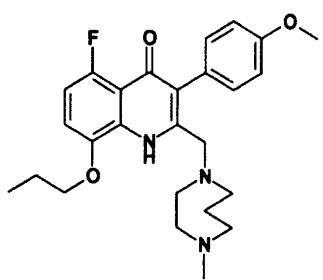
【化100】



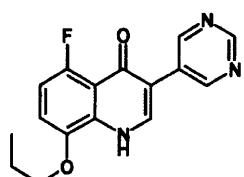
【化101】



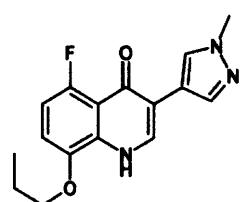
【化 102】



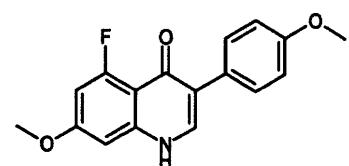
【化 103】



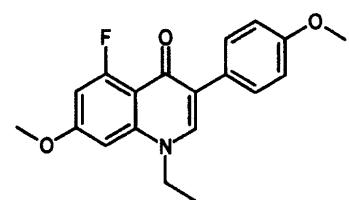
【化 104】



【化 105】

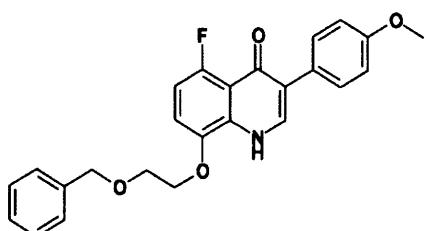


【化 106】



又は

【化 107】



であるキノロン化合物又はその塩からなる医薬。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の医薬を有効成分として含有する、神経変性疾患、神経機能の障害に伴う疾患、またはミトコンドリア機能の低下に伴う疾患の治療及び／または予防剤。

【請求項 19】

神経変性疾患が、パーキンソン病、パーキンソン症候群、若年性パーキンソンニズム、線条体黒質変性症、進行性核上性麻痺、純粹無動症、アルツハイマー病、ピック病、ブリオン病、大脳皮質基底核変性症、びまん性レビー小体病、ハンチントン病、有棘赤血球舞踏病、良性遺伝性舞踏病、発作性舞踏アテトーゼ、本態性振戦、本態性ミオクローヌス、ジル・ド・ラ・トゥレット症候群、レット症候群、変性性バリズム、変形性筋ジストニー、アテトーゼ、痙性斜頸、メイジ症候群、脳性麻痺、ウィルソン病、瀬川病、ハレルフォルデン・スバツ症候群、神経軸索ジストロフィー、淡蒼球萎縮症、脊髄小脳変性症、皮質性小脳萎縮症、ホームズ型小脳萎縮症、オリーブ橋小脳萎縮症、遺伝性オリーブ橋小脳萎縮症、ジョセフ病、歯状核赤核淡蒼球ルイ体萎縮症、ゲルストマン・シュトロイスラー・シャインカ症候群、フリードライヒ運動失調症、ルシー・レビー症候群、メイ・ホワイト症候群、先天性小脳失調症、周期性遺伝性失調症、毛細血管拡張運動失調症、筋萎縮性側索硬化症、進行性球麻痺、脊髄性進行性筋萎縮症、球脊髄性筋萎縮症、ウェルドニッヒ・ホフマン病、クーゲルベルク・ウエランダー病、遺伝性痙性対麻痺、脊髄空洞症、延髄空洞症、アーノルド・キアリー奇形、スティフマン症候群、クリッペル・ファイル症候群、ファチオーロンド病、低位脊髄症、ダンディー・ウォーカー症候群、二分脊椎、シーグレン・ラーソン症候群、放射線脊髄症、加齢黄斑変性、並びに脳梗塞及び脳出血から選ばれる脳卒中及び／またはそれに伴う機能不全もしくは神経脱落症状からなる群から選ばれる疾患である、請求項 18 に記載の治療及び／または予防剤。

【請求項 20】

神経機能の障害に伴う疾患が、脊髄損傷、化学療法で誘発された神経障害、糖尿病性神経障害、放射性障害、並びに多発性硬化症、急性散在性脳脊髄炎、横断性脊髄炎、進行性多巣性白質脳症、亜急性硬化症全脳炎、慢性炎症性脱髓性多発根神経炎及びギラン・パレー症候群から選ばれる脱髓疾患からなる群から選ばれる疾患である、請求項 18 に記載の治療及び／または予防剤。

【請求項 21】

ミトコンドリア機能の低下に伴う疾患が、ピアソン症候群、糖尿病、難聴、悪性片頭痛、レーバー病、メラス (MELAS)、マーフ (MERRF)、マーフ/メラス重複症候群、NARP、純粹型ミオパチー、ミトコンドリア心筋症、ミオパチー、痴呆、胃腸運動失調、後天性鉄芽球性貧血、アミノグリコシド誘発性難聴、チトクロム b 遺伝子変異による複合体III欠損症、対称性多発性脂肪腫症、運動失調、ミオクローヌス、網膜症、MNGIE、ANT1異常症、トワインクル異常症、POLG異常症、反復性ミオグロビン尿症、SANDO、ARCO、複合体I欠損症、複合体II欠損症、視神經萎縮、複合体IV欠損重症乳児型、ミトコンドリアDNA欠乏症候群、リー脳症、慢性進行性外眼筋麻痺症候群 (CPEO)、キーンズ・セイヤー症候群、脳症、乳酸血症、ミオグロビン尿、薬物誘発性ミトコンドリア病、統合失調症、大うつ病性障害、双極I型障害、双極II型障害、混合状態、気分変調性障害、非定型うつ病、季節性感情障害、産後うつ病、軽症うつ病、反復性短期うつ病性障害、難治性うつ病、慢性うつ病、重複うつ病及び急性腎不全からなる群から選ばれる疾患である、請求項 18 に記載の治療及び／または予防剤。

【請求項 22】

請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の医薬を有効成分として含有する、虚血性心疾患及び／またはそれに伴う機能不全、心不全、心筋症、大動脈乖離、免疫不全症、自己免疫疾患、腎不全、糖尿病、アテローム塞栓性腎疾患、多発性囊胞腎、髓質囊胞性疾患、腎皮質壞死、悪性腎硬化症、腎不全、腎障害、肝性脳症、肝不全、慢性閉塞性肺疾患、肺塞栓症、気管支拡張症、珪肺症、黑色肺、特発性肺線維症、スティーブンス・ジョンソン症候群、

中毒性表皮壊死症、筋ジストロフィ、クロストリジウム性筋肉壊死並びに大腿骨頸部骨壊死の疾患の治療及び/または予防剤。

**【請求項 2 3】**

項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の医薬と薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

**【請求項 2 4】**

項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の医薬と薬学的に許容される担体とを混合することを含む医薬組成物の製造方法。

**【手続補正 2】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0 0 1 6

**【補正方法】**変更

**【補正の内容】**

**【0 0 1 6】**

[ 式中、

R<sub>1</sub> は、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) 低級アルキル基、
- ( 3 ) ハロゲン置換低級アルキル基、
- ( 4 ) 低級アルケニル基、
- ( 5 ) 低級アルカノイル基、
- ( 6 ) ハロゲン置換低級アルカノイル基、
- ( 7 ) ヒドロキシ低級アルキル基、
- ( 8 ) 保護されたヒドロキシ低級アルキル基、
- ( 9 ) ヒドロキシ低級アルカノイル基、
- ( 1 0 ) 保護されたヒドロキシ低級アルカノイル基、
- ( 1 1 ) 低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 1 2 ) 低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 1 3 ) ヒドロキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 1 4 ) カルボキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 1 5 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 1 6 ) 低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ低級アルキルチオカルボニル低級アルキル基、
- ( 1 7 ) ヒドロキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 1 8 ) カルボキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 1 9 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 2 0 ) 低級アルカノイル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 2 1 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 2 2 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 2 3 ) 低級アルカノイル低級アルキル基、
- ( 2 4 ) カルボキシ低級アルキル基、
- ( 2 5 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 2 6 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいピペラジニル低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 2 7 ) モルホリニル低級アルキル基、
- ( 2 8 ) オキサゼパニル低級アルキル基、
- ( 2 9 ) 低級アルキル基を 1 個以上有していてもよいアミノ低級アルキル基、
- ( 3 0 ) ピペラジン環上に低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基及びピリジル

基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいピペラジル低級アルキル基、  
 (31) モルホリニル基を1個以上有していてもよいピペリジル低級アルキル基、  
 (32) アゼチジン環上にヒドロキシ基を1個以上有していてもよいアゼチジル低級アルキル基、  
 (33) オキソ基を1個以上有していてもよいイソインドリニル低級アルキル基、  
 (34) 低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいアミノ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、  
 (35) 低級アルキル基；モルホリニル低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいピペリジル基；及び低級アルキル基を1個以上有していてもよいピペラジニル低級アルキル基から選ばれた基を1個以上有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、  
 (36) ヒドロキシ保護基を1個以上有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基、  
 (37) ヒドロキシ保護基を1個以上有していてもよいホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、  
 (38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、保護されたヒドロキシ基及びヒドロキシ保護基を1個以上有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいベンゾイルオキシ低級アルキル基、  
 (39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいテトラヒドロピラニル基または  
 (40) 低級アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；低級アルコキシカルボニルアミノ基；低級アルコキシ低級アルキル基を1個以上有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピペリジル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよい低級アルカノイルアミノ低級アルキル基  
 を示す。

$R_2$  は、

(1) 水素、  
 (2) 低級アルキル基、  
 (3) 低級アルカノイル基、  
 (4) ヒドロキシ低級アルキル基、  
 (5) カルボキシ基、  
 (6) 低級アルコキシカルボニル基、  
 (7) 低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルキル基；ヒドロキシ低級アルキル基；低級アルキル基を1個以上有していてもよいピペラジニル低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいカルバモイル基、  
 (8) 低級アルキル基を1個以上有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、  
 (9) モルホリニル低級アルキル基、  
 (10) 低級アルキル基及び低級アルキル基を1個以上有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個以上有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、  
 (11) ジアゼパニル低級アルキル基、  
 (12) 低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個以上有していてもよいアミノ低級アルキル基、  
 (13) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基または  
 (14) カルボキシ低級アルキル基  
 を示す。

$R_3$  は、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示す。

ここで、上記  $R_3$  で示される芳香環及び複素環上には、下記(1)～(14)からなる群から選ばれた基が1個以上置換していてもよい：

(1) 低級アルキル基、

- (2) 低級アルコキシ基、
- (3) 低級アルカノイル基、
- (4) ハロゲン、
- (5) ヒドロキシ基、
- (6) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (7) ヒドロキシ低級アルコキシ基、
- (8) 保護されたヒドロキシ低級アルコキシ基、
- (9) カルボキシ低級アルコキシ基、
- (10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、
- (11) ピロリジルカルボニル基、
- (12) 低級アルキル基を1個以上有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、
- (13) モルホリニル低級アルキル基を1個以上有していてもよいカルバモイル基、
- (14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

R<sub>4</sub> は、ハロゲン、低級アルキル基または低級アルコキシ基を示す。

R<sub>5</sub> は水素またはハロゲンを示す。

あるいは R<sub>4</sub> と R<sub>5</sub> が結合して、

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0028

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0028】

項3. キノロン化合物が、一般式(1)におけるR<sub>1</sub>が、

- (1) 水素、
- (2) 低級アルキル基、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
- (4) 低級アルケニル基、
- (5) 低級アルカノイル基、
- (6) ハロゲン置換低級アルカノイル基、
- (7) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (8) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、
- (9) ヒドロキシ低級アルカノイル基、
- (10) フェニル低級アルコキシ低級アルカノイル基、
- (11) 低級アルキルチオ低級アルキル基、
- (12) アミノ基上に低級アルキル基を2個有していてもよいアミノ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- (13) ヒドロキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- (14) カルボキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- (15) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルチオ低級アルキル基、
- (16) アミノ基上に低級アルキル基を2個有していてもよいアミノ低級アルキルチオカルボニル低級アルキル基、
- (17) ヒドロキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (18) カルボキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (19) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (20) 低級アルカノイル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (21) ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (22) ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- (23) 低級アルカノイル低級アルキル基、

- ( 2 4 ) カルボキシ低級アルキル基、
- ( 2 5 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 2 6 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 2 7 ) モルホリニル低級アルキル基、
- ( 2 8 ) オキサゼバニル低級アルキル基、
- ( 2 9 ) アミノ基上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいアミノ低級アルキル基、
- ( 3 0 ) ピペラジン環上に低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル低級アルキル基、
- ( 3 1 ) ピペリジン環上にモルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル低級アルキル基、
- ( 3 2 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル低級アルキル基、
- ( 3 3 ) イソインドリン環上にオキソ基を 2 個有していてもよいイソインドリニル低級アルキル基、
- ( 3 4 ) アミノ基上に低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、
- ( 3 5 ) カルバモイル基上に低級アルキル基；モルホリニル低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペリジル基；及び低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基から選ばれた基を 1 個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、
- ( 3 6 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基、
- ( 3 7 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、
- ( 3 8 ) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及び低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいベンゾイルオキシ低級アルキル基、
- ( 3 9 ) ヒドロキシ基を 3 個及びヒドロキシ低級アルキル基を 1 個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または
- ( 4 0 ) 低級アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；低級アルコキシカルボニルアミノ基；低級アルコキシ低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよい低級アルカノイルアミノ低級アルキル基を示し、

R<sub>2</sub> が、

- ( 1 ) 水素、
- ( 2 ) 低級アルキル基、
- ( 3 ) 低級アルカノイル基、
- ( 4 ) ヒドロキシ低級アルキル基、
- ( 5 ) カルボキシ基、
- ( 6 ) 低級アルコキシカルボニル基、
- ( 7 ) 低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルキル基；ヒドロキシ低級アルキル基；ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル基、
- ( 8 ) カルバモイル基上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、
- ( 9 ) モルホリニル低級アルキル基、

(10) ピペラジン環上に低級アルキル基及び低級アルキル基を1個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、

(11) ジアゼパニル低級アルキル基、または

(12) アミノ基上に低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルキル基

を示し、

$R_3$  が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記  $R_3$  で示される芳香環及び複素環上には、下記(1)～(14)からなる群から選ばれた基が1個もしくは2個置換していてもよい：

(1) 低級アルキル基、

(2) 低級アルコキシ基、

(3) 低級アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシ低級アルキル基、

(7) ヒドロキシ低級アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシ低級アルコキシ基、

(9) カルボキシ低級アルコキシ基、

(10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12) 低級アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、

(13) モルホリニル低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルピペリジルカルボニル基、

$R_6$  が、水素または低級アルコキシ基を示し、

$R_7$  が、

(1) 水素、

(2) 低級アルコキシ基、

(3) ヒドロキシ低級アルコキシ基、

(4) ベンジルオキシ低級アルコキシ基、

(5) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、

(6) 低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、

(7) 低級アルキル基及びシクロC3-C8アルキル基からなる群から選ばれた基を2個有していてもよいアミノ基、

(8) シクロC3-C8アルキルオキシ基、

(9) カルボキシ低級アルコキシ基、

(10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、または

(11) ピロリジニル基を示す、

キノロン化合物である、項2に記載の医薬。

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0029

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0029】

項4. キノロン化合物が、一般式(1)における  $R_1$  が、

(1) 水素、  
 (2) 低級アルキル基、  
 (3) ハロゲン置換低級アルキル基、  
 (24) カルボキシ低級アルキル基、  
 (25) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、  
 (27) モルホリニル低級アルキル基、  
 (28) オキサゼパニル低級アルキル基、  
 (30) ピペラジン環上に低級アルコキシ低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジル低級アルキル基、  
 (31) ピペリジル低級アルキル基、  
 (35) モルホリニル低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、または  
 (36) 低級アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基

を示し、

$R_2$  が、

(1) 水素、または

(2) 低級アルキル基

を示し、

$R_3$  が、フェニル基、チエニル基またはフリル基を示し（ここで、上記  $R_3$  で示される芳香環及び複素環上には、低級アルコキシ基が1個置換していてもよい）、

$R_6$  が、水素を示し、

$R_7$  が、低級アルコキシ基を示す、

キノロン化合物である、項3に記載の医薬。

【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0033

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0033】

項6.キノロン化合物が、一般式(1)における $R_1$ が、

(1) 水素、

(2) 低級アルキル基または

(36) 低級アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基

を示し、

$R_2$  が、水素を示し、

$R_3$  が、低級アルコキシ基が1個置換していてもよいフェニル基を示し、

$R_4$  が、低級アルキル基または低級アルコキシ基を示し、

$R_5$  が、水素を示す、

キノロン化合物である、項5に記載の医薬。

【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0034

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0034】

項7.キノロン化合物が、一般式(1)における $R_1$ が、

(3) ハロゲン置換低級アルキル基、

(4) 低級アルケニル基、

- ( 5 ) 低級アルカノイル基、
- ( 6 ) ハロゲン置換低級アルカノイル基、
- ( 7 ) ヒドロキシ低級アルキル基、
- ( 8 ) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、
- ( 9 ) ヒドロキシ低級アルカノイル基、
- ( 10 ) フェニル低級アルコキシ低級アルカノイル基、
- ( 11 ) 低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 12 ) 低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 13 ) ヒドロキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 14 ) カルボキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 15 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルチオ低級アルキル基、
- ( 16 ) 低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルキルチオカルボニル低級アルキル基、
- ( 17 ) ヒドロキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 18 ) カルボキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 19 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 20 ) 低級アルカノイル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 21 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 22 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
- ( 23 ) 低級アルカノイル低級アルキル基、
- ( 24 ) カルボキシ低級アルキル基、
- ( 25 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 26 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
- ( 27 ) モルホリニル低級アルキル基、
- ( 28 ) オキサゼパニル低級アルキル基、
- ( 29 ) 低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルキル基、
- ( 30 ) ピペラジン環上に低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル低級アルキル基、
- ( 31 ) ピペリジン環上にモルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル低級アルキル基、
- ( 32 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル低級アルキル基、
- ( 33 ) オキソ基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいイソインドリニル低級アルキル基、
- ( 34 ) 低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、
- ( 35 ) 低級アルキル基；モルホリニル低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペリジル基；及び低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、
- ( 36 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基、
- ( 37 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、
- ( 38 ) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及び低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個有してい

てもよいベンゾイルオキシ低級アルキル基、

(39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を1個～4個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または

(40) 低級アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；低級アルコキシカルボニルアミノ基；低級アルコキシ低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルペリジル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよい低級アルカノイルアミノ低級アルキル基

を示し、

$R_2$  が、

(1) 水素、

(2) 低級アルキル基、

(3) 低級アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ低級アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6) 低級アルコキシカルボニル基、

(7) 低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルキル基；ヒドロキシ低級アルキル基；ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいカルバモイル基、

(8) カルバモイル基上に低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、

(9) モルホリニル低級アルキル基、

(10) ピペラジン環上に低級アルキル基及び低級アルキル基を1個有していてもよいピリジル基からなる群から選ばれる基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基、

(11) ジアゼパニル低級アルキル基、または

(12) アミノ基上に低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルキル基

を示し、

$R_3$  が、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記  $R_3$  で示される芳香環及び複素環上には、下記(1)～(14)からなる群から選ばれた基が1個もしくは2個置換していてもよい：

(1) 低級アルキル基、

(2) 低級アルコキシ基、

(3) 低級アルカノイル基、

(4) ハロゲン、

(5) ヒドロキシ基、

(6) ヒドロキシ低級アルキル基、

(7) ヒドロキシ低級アルコキシ基、

(8) テトラヒドロピラニルオキシ低級アルコキシ基、

(9) カルボキシ低級アルコキシ基、

(10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、

(11) ピロリジルカルボニル基、

(12) カルバモイル基上に低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、

(13) モルホリニル低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル基、

(14) モルホリニルペリジルカルボニル基、

$R_4$  が、ハロゲン、低級アルキル基または低級アルコキシ基を示し、

$R_5$  が、水素またはハロゲンを示し、  
 $R_6$  が、水素または低級アルコキシ基を示し、  
 $R_7$  が、

- (1) 水素、
- (2) 低級アルコキシ基、
- (3) ヒドロキシ低級アルコキシ基、
- (4) ベンジルオキシ低級アルコキシ基、
- (5) 低級アルコキシ低級アルコキシ基、
- (6) 低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、
- (7) 低級アルキル基及びシクロC3-C8アルキル基からなる群から選ばれた基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ基、
- (8) シクロC3-C8アルキルオキシ基、
- (9) カルボキシ低級アルコキシ基、
- (10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、または
- (11) ピロリジニル基を示す、

キノロン化合物である、項1に記載の医薬。

【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0035

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0035】

- 項8. キノロン化合物が、一般式(1)における $R_1$ が、
- (3) ハロゲン置換低級アルキル基、
  - (4) 低級アルケニル基、
  - (5) 低級アルカノイル基、
  - (6) ハロゲン置換低級アルカノイル基、
  - (8) ベンジルオキシ低級アルキル基、
  - (10) ベンゾイルオキシ低級アルカノイル基、
  - (11) 低級アルキルチオ低級アルキル基、
  - (12) 低級アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルキルチオ低級アルキル基、
  - (13) ヒドロキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
  - (14) カルボキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、
  - (15) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルチオ低級アルキル基、
  - (16) 低級アルキル基を1個もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルキルチオカルボニル低級アルキル基、
  - (17) ヒドロキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (18) カルボキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (19) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (20) 低級アルカノイル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (21) ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (22) ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、
  - (24) カルボキシ低級アルキル基、
  - (25) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、
  - (26) ピペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいピペラジニル低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、

( 2 7 ) モルホリニル低級アルキル基、  
 ( 2 9 ) 低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルキル基、  
 ( 3 0 ) ピペラジン環上に低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル低級アルキル基、  
 ( 3 1 ) モルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル低級アルキル基、  
 ( 3 2 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル低級アルキル基、  
 ( 3 3 ) オキソ基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいイソインドリニル低級アルキル基、  
 ( 3 4 ) 低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、  
 ( 3 5 ) 低級アルキル基；モルホリニル低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペリジル基；及び低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキル基から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、  
 ( 3 6 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基、  
 ( 3 7 ) ホスホノ基上に低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、  
 ( 3 8 ) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、ベンジルオキシ基及び低級アルキル基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいベンゾイルオキシ低級アルキル基、  
 ( 3 9 ) ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を 1 個～ 4 個有していてもよいテトラヒドロピラニル基または  
 ( 4 0 ) 低級アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；低級アルコキシカルボニルアミノ基；低級アルコキシ低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルピペリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよい低級アルカノイルアミノ低級アルキル基を示し、

R<sub>2</sub> が、水素を示し、

R<sub>3</sub> が、フェニル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示し、

ここで、上記 R<sub>3</sub> で示される芳香環及び複素環上には、下記 ( 1 ) 、 ( 2 ) 、 ( 4 ) 、 ( 5 ) 、 ( 7 ) 、 ( 8 ) 、 ( 10 ) 、 ( 11 ) 及び ( 12 ) からなる群から選ばれた基が 1 個もしくは 2 個置換していてもよい：

- ( 1 ) 低級アルキル基、
- ( 2 ) 低級アルコキシ基、
- ( 4 ) ハロゲン、
- ( 5 ) ヒドロキシ基、
- ( 7 ) ヒドロキシ低級アルコキシ基、
- ( 8 ) テトラヒドロピラニルオキシ低級アルコキシ基、
- ( 10 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、
- ( 11 ) ピロリジルカルボニル基、
- ( 12 ) カルバモイル低級アルコキシ基、

R<sub>4</sub> が、ハロゲンを示し、

R<sub>5</sub> が、水素またはハロゲンを示し、

R<sub>6</sub> が、水素を示し、

R<sub>7</sub> が、

( 2 ) 低級アルコキシ基、

( 7 ) 低級アルキル基及びシクロ C<sub>3</sub> - C<sub>8</sub> アルキル基からなる群から選ばれた基を 1 個もしくは 2 個有していてもよいアミノ基、

( 8 ) シクロ C 3 - C 8 アルキルオキシ基、または  
( 11 ) ピロリジニル基を示す、  
キノロン化合物である、項 7 に記載の医薬。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0052

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0052】

[式中、

R<sub>1</sub> は、

( 1 ) 水素、

( 2 ) 低級アルキル基、

( 3 ) ハロゲン置換低級アルキル基、

( 4 ) 低級アルケニル基、

( 5 ) 低級アルカノイル基、

( 6 ) ハロゲン置換低級アルカノイル基、

( 7 ) ヒドロキシ低級アルキル基、

( 8 ) フェニル低級アルコキシ低級アルキル基、

( 9 ) ヒドロキシ低級アルカノイル基、

( 10 ) フェニル低級アルコキシ低級アルカノイル基、

( 11 ) 低級アルキルチオ低級アルキル基、

( 12 ) アミノ基上に低級アルキル基を 1 もしくは 2 個(さらに好ましくは 2 個)有していてもよいアミノ低級アルキルチオ低級アルキル基、

( 13 ) ヒドロキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、

( 14 ) カルボキシ低級アルキルチオ低級アルキル基、

( 15 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルチオ低級アルキル基、

( 16 ) アミノ基上に低級アルキル基を 1 もしくは 2 個(さらに好ましくは 2 個)有していてもよいアミノ低級アルキルチオカルボニル低級アルキル基、

( 17 ) ヒドロキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 18 ) カルボキシ低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 19 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 20 ) 低級アルカノイル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 21 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 22 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニルカルボニル低級アルキルスルホニル低級アルキル基、

( 23 ) 低級アルカノイル低級アルキル基、

( 24 ) カルボキシ低級アルキル基、

( 25 ) 低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、

( 26 ) ピペラジン環上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいピペラジニル低級アルコキシカルボニル低級アルキル基、

( 27 ) モルホリニル低級アルキル基、

( 28 ) オキサゼパニル低級アルキル基、

( 29 ) アミノ基上に低級アルキル基を 1 個有していてもよいアミノ低級アルキル基、

( 30 ) ピペラジン環上に低級アルキル基、低級アルコキシ低級アルキル基及びピリジル基からなる群から選ばれた基を 1 個有していてもよいピペラジル低級アルキル基、

( 31 ) ピペリジン環上にモルホリニル基を 1 個有していてもよいピペリジル低級アルキル基、

( 32 ) アゼチジン環上にヒドロキシ基を 1 個有していてもよいアゼチジル低級アルキル

基、

(33) イソインドリン環上にオキソ基を2個有していてもよいイソインドリニル低級アルキル基、

(34) アミノ基上に低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、

(35) カルバモイル基上に低級アルキル基；モルホリニル低級アルキル基；低級アルキル基及び低級アルコキシカルボニル基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいペリジル基；及び低級アルキル基を1個有していてもよいペラジニル低級アルキル基から選ばれた基を1もしくは2個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、

(36) ホスホノ基上に低級アルキル基を1もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ低級アルキル基、

(37) ホスホノ基上に低級アルキル基を1もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基、

(38) ベンゼン環上に、ヒドロキシ基、保護されたヒドロキシ基及び低級アルキル基を1もしくは2個有していてもよいホスホノオキシ基からなる群から選ばれた基を1個有していてもよいベンゾイルオキシ低級アルキル基、

(39) ヒドロキシ基、ヒドロキシ低級アルキル基及びカルボキシル基からなる群から選ばれた基を1～4個(好ましくは4個)有していてもよいテトラヒドロピラニル基(さらに好ましくは3個のヒドロキシ基及び1個のヒドロキシ低級アルキル基を有するテトラヒドロピラニル基)、

または

(40) 低級アルカノイル基上にハロゲン；ヒドロキシ基；アミノ基；低級アルコキシカルボニルアミノ基；低級アルコキシ低級アルキル基を1個有していてもよいペラジニル基；イミダゾリル基及びモルホリニルペリジル基からなる群から選ばれた基を1もしくは2個有していてもよい低級アルカノイルアミノ低級アルキル基

を示す。

R<sub>2</sub>は、

(1) 水素、

(2) 低級アルキル基、

(3) 低級アルカノイル基、

(4) ヒドロキシ低級アルキル基、

(5) カルボキシ基、

(6) 低級アルコキシカルボニル基、

(7) 低級アルキル基；ハロゲン置換低級アルキル基；ヒドロキシ低級アルキル基；ペラジン環上に低級アルキル基を1個有していてもよいペラジニル低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基を1もしくは2個有していてもよいカルバモイル基、

(8) カルバモイル基上に低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルキル基、

(9) モルホリニル低級アルキル基、

(10) 低級アルキル基及び低級アルキル基を1個有していてもよいペリジル基からなる群から選ばれる基をペラジン環上に1個有していてもよいペラジニル低級アルキル基、

(11) ジアゼパニル低級アルキル基

または

(12) 低級アルキル基、ハロゲン置換低級アルキル基、ヒドロキシ低級アルキル基及びモルホリニル低級アルキル基からなる群から選ばれた基をアミノ基上に1もしくは2個有していてもよいアミノ低級アルキル基

を示す。

$R_3$  は、フェニル基、チエニル基、フリル基、ピラゾリル基またはピリミジニル基を示す。

ここで、上記  $R_3$  で示される芳香環及び複素環上には、下記(1)～(14)からなる群から選ばれた基が1もしくは2個置換していてもよい：

- (1) 低級アルキル基、
- (2) 低級アルコキシ基、
- (3) 低級アルカノイル基、
- (4) ハロゲン、
- (5) ヒドロキシ基、
- (6) ヒドロキシ低級アルキル基、
- (7) ヒドロキシ低級アルコキシ基、
- (8) 保護されたヒドロキシ低級アルコキシ基、
- (9) カルボキシ低級アルコキシ基、
- (10) 低級アルコキシカルボニル低級アルコキシ基、
- (11) ピロリジルカルボニル基、
- (12) カルバモイル基上に低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル低級アルコキシ基、
- (13) モルホリニル低級アルキル基を1個有していてもよいカルバモイル基、
- (14) モルホリニルペリジルカルボニル基、

$R_4$  は、ハロゲン、低級アルキル基、低級アルコキシ基を示す。

$R_5$  は水素またはハロゲンを示す。

あるいは  $R_4$  と  $R_5$  が結合して、

【手続補正9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0076

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0076】

ホスホノオキシ低級アルカノイル基としては、例えば、1～3個(好ましくは1個)の前記例示の保護されたホスホノオキシ基を有する、前記例示の低級アルカノイル基を挙げることができる。

【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0077

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0077】

ホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ基のホスホノオキシ低級アルカノイル部分は前記のとおりである。

【手続補正11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0078

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0078】

ホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基としては、例えば、1～3個(好ましくは1個)の前記例示のホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ基を有する、前記例示の低級アルキル基を挙げることができる。

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 8 4

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【0 0 8 4】

ホスホノオキシ低級アルキル基としては、例えば、1～3個（好ましくは1個）のホスホリルオキシ基を有する、前記例示の低級アルキル基を挙げることができる。

【手続補正13】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 0 2 1 9

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【0 2 1 9】

[式中、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、及びR<sub>7</sub>は前記と同じであり、R<sub>1a</sub>は、ヒドロキシ保護基を有するホスホノオキシ低級アルキル基、ヒドロキシ保護基を有するホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基または、ベンゼン環上に、ヒドロキシ保護基を有するホスホノオキシ基を有するベンゾイルオキシ低級アルキル基、R<sub>1b</sub>は、ホスホノオキシ低級アルキル基、ホスホノオキシ低級アルカノイルオキシ低級アルキル基または、ベンゼン環上に、ホスホノオキシ基を有するベンゾイルオキシ低級アルキル基を示す。]

化合物(1c)を、無溶媒または不活性溶媒中、ヒドロキシ保護基の脱保護反応に付することにより、化合物(1d)を製造することができる。

【手続補正14】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 1 0 5 3

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【1 0 5 3】

4-(ジ-tert-ブチルホスホノオキシ)-安息香酸5-フルオロ-3-(4-メトキシフェニル)-4-オキソ-8-プロポキシ-4H-キノリン-1-イルメチルエステルの製造

4-ヒドロキシ安息香酸5-フルオロ-3-(4-メトキシフェニル)-4-オキソ-8-プロポキシ-4H-キノリン-1-イルメチルエステル2.2g(4.6ミリモル)をアセトン50mlに懸濁し、テトラゾール420mgおよびジ-tert-ブチルジイソプロピルホスホラミジト1.9mlを加え、室温で2時間攪拌した。反応液を氷冷し、30%過酸化水素水2.9mlを加えて同温度で時間攪拌した。反応液にチオ硫酸ナトリウム水溶液および炭酸水素ナトリウム水溶液を加えて攪拌後、減圧下に濃縮した。残渣に水を加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥し、次いで減圧下に濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=100:1:2:1)で精製した。精製物を減圧下に濃縮乾固して白色無定形固体の4-(ジ-tert-ブチルホスホノオキシ)-安息香酸5-フルオロ-3-(4-メトキシフェニル)-4-オキソ-8-プロポキシ-4H-キノリン-1-イルメチルエステル2.51g(収率81%)を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm: 1.06 (3H, t, J=7.4Hz), 1.50 (18H, s), 1.80-2.00 (2H, m), 3.84 (3H, s), 4.08 (2H, t, J=6.7Hz), 6.63 (2H, s), 6.90-7.00 (3H, m), 7.10 (1H, d, J=4.4, 9.0Hz), 7.26 (2H, d, J=8.5Hz), 7.62 (2H, d, J=8.7Hz), 7.83 (1H, s), 7.97 (2H, d, J=8.5Hz)。

【手続補正15】

【補正対象書類名】 明細書

【補正対象項目名】 1 0 5 6

【補正方法】 変更

## 【補正の内容】

## 【1056】

4 - ホスホノオキシ安息香酸 5 - フルオロ - 3 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 8 - プロポキシ - 4H - キノリン - 1 - イルメチルエステルの製造

4 - (ジ - tert - プチルホスホノオキシ) - 安息香酸 5 - フルオロ - 3 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 8 - プロポキシ - 4H - キノリン - 1 - イルメチルエステル 500mg のジクロロメタン溶液 (10ml) に氷冷下、トリフルオロ酢酸 2ml を加えて同温度で 1 時間攪拌した。得られる混合物を浴温 30 以下で減圧下に濃縮し、残渣を酢酸エチル - n - ヘキサンから再結晶して、淡黄色粉末の 4 - ホスホノオキシ安息香酸 5 - フルオロ - 3 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 8 - プロポキシ - 4H - キノリン - 1 - イルメチルエステル 406.7mg (収率 98%) を得た。

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sub>6</sub>) ppm : 0.93 (3H, t, J=7.4Hz), 1.60-1.85 (2H, m), 3.79 (3H, s), 4.06 (2H, t, J=6.5Hz), 6.64 (2H, s), 6.98 (2H, d, J=8.8Hz), 7.09 (1H, dd, J=9.1, 11.5Hz), 7.27 (2H, d, J=8.7Hz), 7.37 (1H, dd, J=4.4, 9.1Hz), 7.62 (2H, d, J=8.8Hz), 7.92 (2H, d, J=8.7Hz), 8.38 (1H, s)。

## 【手続補正16】

## 【補正対象書類名】明細書

## 【補正対象項目名】1071

## 【補正方法】変更

## 【補正の内容】

## 【1071】

(ジ - tert - プチルホスホノオキシ) 酢酸 5 - フルオロ - 3 - (4 - メトキシフェニル) - 4 - オキソ - 8 - プロポキシ - 4H - キノリン - 1 - イルメチルエステルの製造

適当な出発原料を用い、実施例 23 と同様にして、上記化合物を製造した。

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>) ppm : 1.09 (3H, t, J=7.4Hz), 1.44 (18H, s), 1.80-2.00 (2H, m), 3.84 (3H, s), 4.06 (2H, t, J=6.7Hz), 4.53 (2H, d, J=8.9Hz), 6.51 (2H, s), 6.90-7.00 (3H, m), 7.08 (1H, dd, J=4.5, 9.0Hz), 7.59 (2H, d, J=8.9Hz), 7.73 (1H, s)。