

Title (en)  
PROCESS FOR THE PREPARATION OF QUINOLINE CARBOXYLIC ACID DERIVATIVES.

Title (de)  
VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON CHINOLINCARBONSÄURE ABKÖMMLINGEN.

Title (fr)  
PROCEDE POUR LA PREPARATION DE DERIVES D'ACIDE CARBOXYLIQUE DE QUINOLEINE.

Publication  
**EP 0329719 A1 19890830 (EN)**

Application  
**EP 88904603 A 19880520**

Priority  
• HU 285887 A 19870624  
• HU 314687 A 19870710

Abstract (en)  
[origin: WO8810253A1] The invention relates to a new process for the preparation of compounds of general formula (I) (wherein R<1> stands for phenyl being optionally substituted by 1 or 2 halogen atoms, or a group of the general formula CH<sub>2</sub>CR<6>R<7>R<8> (wherein R<6>, R<7> and R<8> stand for hydrogen or halogen); R<2> stands for piperazinyl or 4-methyl-piperazinyl; R<3> stands for hydrogen or fluorine) and pharmaceutically acceptable salts thereof which comprises reacting a compound of general formula (II) (wherein R stands for halogen or an aliphatic acyloxy group containing 2 to 6 carbon atoms or an aromatic acyloxy group containing 7 to 11 carbon atoms, R<4> stands for fluorine or chlorine) with a piperazine derivative of general formula (III) (wherein R<5> stands for hydrogen or methyl) or a salt thereof and subjecting the compound of general formula (IV) thus obtained (wherein R, R<1>, R<2> and R<3> are as stated above) to hydrolysis after or without isolation and if desired converting the compound of general formula (I) thus obtained into a salt thereof or setting free the same from its salt. The compounds of general formula (I) are known antibacterial agents. The advantage of the process of the present invention is that it makes the desired compounds of general formula (I) available in a simple manner, with high yields and in a short reaction time.

Abstract (fr)  
Nouveau procédé pour la préparation de composés de formule générale (I) (où R1 représente un phényle éventuellement substitué par 1 ou 2 atomes d'halogène, ou un groupe de formule générale CH<sub>2</sub>CR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>R<sub>8</sub> (dans laquelle R<sub>6</sub>, R<sub>7</sub> et R<sub>8</sub> représentent un hydrogène ou un halogène); R<sub>2</sub> est pipérazinyle ou 4-méthyle-pipérazinyle; R<sub>3</sub> est hydrogène ou fluor) et de leurs sels pharmaceutiquement acceptables. Ce procédé consiste à faire réagir un composé de formule générale (II) (dans laquelle R est un halogène ou groupe acyloxy aliphatique contenant de 2 à 6 atomes de carbone ou bien un groupe acyloxy aromatique contenant de 7 à 11 atomes de carbone, R<sub>4</sub> est fluor ou chlore) avec un dérivé de pipérazine de formule générale (III) ( où R<sub>5</sub> est hydrogène ou méthyle ou bien son sel et à soumettre le composé ainsi obtenu de formule générale (IV) (où R, R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> et R<sub>3</sub> ont les notations précitées) à une hydrolyse après ou sans isolation, et si on le désire, à convertir le composé de formule générale (I) ainsi obtenu en son sel ou à libérer ledit composé de son sel. Les composés de formule générale (I) sont des agents antibactériens connus. L'avantage du procédé décrit est qu'il permet d'obtenir les composés désirés de formule générale (I) de manière simple, avec des rendements élevés et un temps de réaction court.

IPC 1-7  
**A61K 31/47; C07D 215/56; C07F 5/02**

IPC 8 full level  
**C07D 215/56** (2006.01); **C07F 5/02** (2006.01)

CPC (source: EP KR)  
**C07D 215/56** (2013.01 - EP KR)

Citation (search report)  
See references of WO 8810253A1

Designated contracting state (EPC)  
AT BE CH DE FR GB IT LI LU NL SE

DOCDB simple family (publication)  
**WO 8810253 A1 19881229**; CA 1325010 C 19931207; CN 1025028 C 19940615; CN 1032166 A 19890405; CS 274677 B2 19910915; CS 412388 A2 19901114; DK 84089 A 19890223; DK 84089 D0 19890223; EP 0329719 A1 19890830; ES 2006994 A6 19890516; FI 890723 A0 19890215; FI 890723 A 19890215; FI 91400 B 19940315; FI 91400 C 19940627; JP 2693988 B2 19971224; JP H02500366 A 19900208; KR 890701564 A 19891221; KR 970005911 B1 19970422; YU 121788 A 19891231; YU 46570 B 19931116

DOCDB simple family (application)  
**HU 8800036 W 19880520**; CA 570183 A 19880623; CN 88103892 A 19880624; CS 412388 A 19880614; DK 84089 A 19890223; EP 88904603 A 19880520; ES 8801926 A 19880621; FI 890723 A 19890215; JP 50432888 A 19880520; KR 890700325 A 19890223; YU 121788 A 19880623