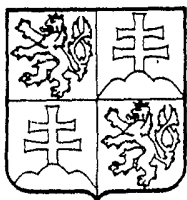


ČESKÁ A SLOVENSKÁ
FEDERATIVNÍ
REPUBLIKA
(19)



FEDERÁLNÍ ÚŘAD
PRO VYNÁLEZY

POPIS VYNÁLEZU

K AUTORSKÉMU OSVĚDČENÍ

271 643

(11)

(13) B1

(51) Int. Cl.⁵
C 07 D 401/02,
C 07 D 295/04,
C 07 D 217/12

(21) PV 303-89.P
(22) Přihlášeno 16 01 89

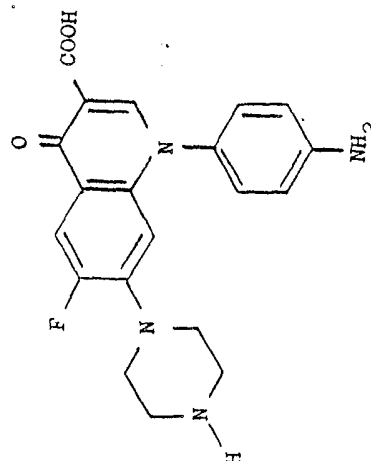
(40) Zveřejněno 12 02 90
(45) Vydáno 09 09 91

(75) Autor vynálezu RÁDL STANISLAV ing. CSc.,
HOLÁ VLADISLAVA MUDr. CSc., PRAHA

(54) 1-(4-Aminofenyl)-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-
-7-piperazinylchinolin-3-karboxylová kyselina

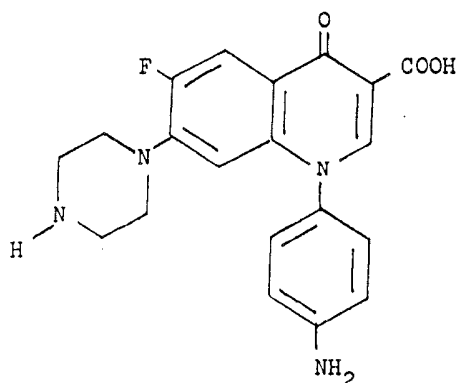
(57) Řešení se týká 1-(4-aminofenyl)-6-
-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-piperazinyl-
chinolin-3-karboxylové kyseliny vzorce I.
Tato nová, dosud nepopsaná látka vykazuje
významný antibakteriální účinek.

(I)



CS 271643 B1

Vynález se týká 1-(4-aminofenyl)-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-piperazinylochinolín-3-karboxylové kyseliny vzorce I



(I).

Je známá vysoká účinnost řady substituovaných 1-aryl-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-chinolin-3-karboxylových kyselin proti širokému spektru bakterií (Chu, D.T.W. a spol.: J. Med. Chem. 28, 1558 /1985/).

1-(4-Aminofenyl)-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-piperazinylocholin-3-karboxylová kyselina vzorce I je nová, dosud nepopsaná látka, která má antibakteriální aktivitu srovnatelnou s neúčinnějšími látkami této skupiny. Minimální inhibiční koncentrace in vitro proti *Streptococcus pyogenes*, *Escherichia coli* a *Proteus vulgaris* byly zjištěny nižší nebo rovny 1 mg/l.

Sloučeninu vzorce I lze podle vynálezu připravit redukcí námi již dříve popsané 6-fluor-1,4-dihydro-1-(4-nitrofenyl)-4-oxo-7-piperazinylocholin-3-karboxylové kyseliny. Redukci lze podle vynálezu provést síranem železnatým v prostředí vodného alkalického hydroxidu nebo vodného amoniaku.

Způsob přípravy látky vzorce I podle vynálezu je jednoduchý a poskytuje žádanou látku v uspokojivém výtěžku. Bližší podrobnosti vyplývají z následujících příkladů provedení. Uvedené příklady vynález pouze ilustrují, nikoliv omezují.

Příklad 1

K vroucímu roztoku 6-fluor-1,4-dihydro-1-(4-nitrofenyl)-4-oxo-7-piperazinylocholin-3-karboxylové kyseliny (0,82 g, 2 mmol) v 50 ml 4% vodného hydroxidu sodného byl přilít roztok 5,5 g heptahydrátu síranu železnatého ve 20 ml vody a vzniklá reakční směs byla vařena pod zpětným chladičem 30 minut. Horká reakční směs byla vakuově zfiltrována a filtrát byl okyselen octovou kyselinou a ochlazen. Nerozpustný podíl byl odsát a promyt chladnou vodou a překrystalován z 50% vodného methyalkoholu. Bylo získáno 0,42 g (55 %) látky o t.t. 256 až 259 °C.

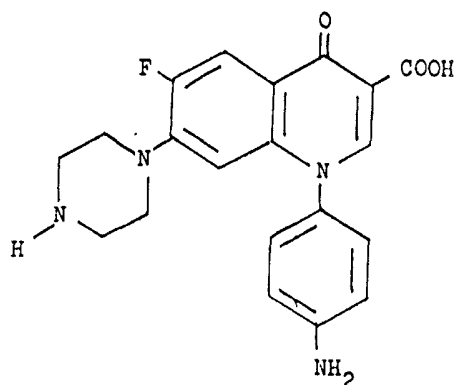
Příklad 2

Pokus byl proveden stejně jako v příkladu 1, místo 4% vodného roztoku hydroxidu sodného byl použit 10% vodný amoniak. Bylo získáno 0,37 g (48 %) látky o t.t. 256 až 259 °C.

CS 271643 B1

PŘEDMĚT VYNÁLEZU

1-(4-Aminofenyl)-6-fluor-1,4-dihydro-4-oxo-7-piperazinylchinolin-3-karboxylová kyselina vzorec I



(I)