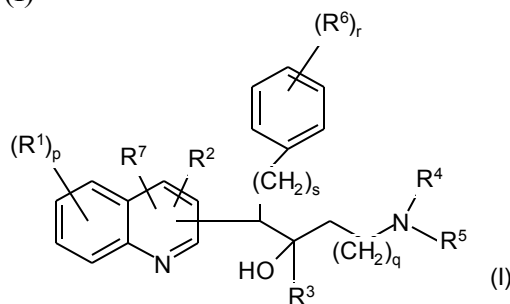


1. Сполука формули (I)



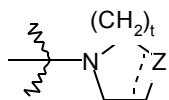
її фармацевтично прийнятні кислотні або основні адитивні солі, її четвертинні аміни, її стереохімічно ізомерні форми, її таутомерні та N-оксидні форми, де

R^1 являє собою водень, галоген, галогеналкіл, ціано, гідрокси, Ar, Het, алкіл, алкілокси, алкілтію, алкілоксіалкіл, алкілтіюалкіл, Ar-алкіл або ді(Ar)алкіл;

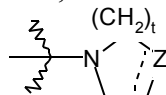
p означає ціле число, рівне 1, 2 або 3;

s означає ціле число, рівне нулю, 1, 2, 3 або 4;

R являє собою водень; галоген; алкіл; гідрокси; меркапто; алкілоксигрупу, необов'язково заміщену аміно або моно- або ді(алкіл)аміно, або радикалом формули



, де Z являє собою CH_2 , CH-R^8 , O, S, N-R^8 , а t означає ціле число, рівне 1 або 2, а пунктирна лінія означає необов'язковий зв'язок; алкілоксіалкілокси; алкілтію; моно- або ді(алкіл)аміно, де алкіл може бути необов'язково заміщений одним або двома замісниками, кожен незалежно вибраний з алкілокси або Ar, або Het, або морфолінілу, або 2-



оксопіролідінілу; Ar, Het або радикал формули , де Z являє собою CH_2 , CH-R^8 , O, S, N-R^8 ; t означає ціле число, рівне 1 або 2; а пунктирна лінія означає необов'язковий зв'язок;

R^3 являє собою алкіл, Ar, Ar-алкіл, Het або Het-алкіл;

q означає ціле число, рівне нулю, 1, 2, 3 або 4;

R^4 та R^5 , кожен, незалежно являє собою водень, алкіл або бензил; або

R^4 та R^5 , разом та включаючи N, до якого вони приєднані, можуть утворювати радикал, вибраний із групи, що включає піролідініл, 2H-піролідініл, 2-піролініл, 3-піролініл, піролідініл, імідазолідініл, піразолідініл, 2-імідазолініл, 2-піразолініл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, піперидиніл, піридиніл, піперазиніл, імідазолідініл, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, триазиніл, морфолініл та тіоморфолініл, кожен з зазначених циклів необов'язково заміщений алкілом, галогеном, галогеналкілом, гідрокси, алкілокси, аміном, моно- або діалкіламіном, алкілтію, алкілоксіалкілом, алкілтіюалкілом та піримідинілом;

R^6 являє собою водень, галоген, галогеналкіл, гідрокси, Ar, алкіл, алкілокси, алкілтію, алкілоксіалкіл, алкілтіюалкіл, Ar-алкіл або ді(Ar)алкіл; або

два сусідніх радикали R^6 можуть разом з фенільним кільцем, до якого вони приєднані, утворювати нафтил;

r означає ціле число, рівне 1, 2, 3, 4 або 5; та

R^7 являє собою водень, алкіл, Ar або Het;

R^8 являє собою водень, алкіл, гідроксил, амінокарбоніл, моно- або ді(алкіл)амінокарбоніл, Ar, Het, алкіл, заміщений одним або двома Het, алкіл, заміщений одним або двома Ar, Het-C(=O)- або Ar-C(=O)- ;

алкіл являє собою нерозгалужений або розгалужений насичений вуглеводневий радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю; або являє собою циклічний насичений вуглеводневий радикал, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю; або являє собою циклічний насичений вуглеводневий радикал, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, приєднаний до нерозгалуженого або розгалуженого насиченого вуглеводневого радикала, що містить від 1

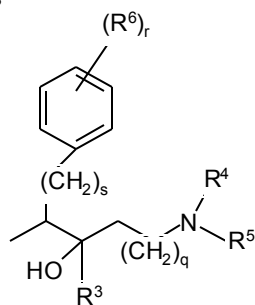
до 6 атомів вуглецю; де кожен атом вуглецю може бути необов'язково заміщений галогеном, гідрокси, алкілокси або оксо;

Ar означає гомоцикл, вибраний з групи, що включає феніл, нафтил, аценафтил, тетрагідронафтил, кожен необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, кожен замісник незалежно вибраний із групи: гідрокси, галоген, ціано, нітро, аміно, моно- або діалкіламіно, алкіл, галогеналкіл, алкілокси, галогеналкілокси, карбоксил, алкілоксикарбоніл, алкілкарбоніл, амінокарбоніл, морфолініл та моно- або діалкіламінокарбоніл;

Het означає моноциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає N-феноксипіперидиніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, фураніл, тієніл, оксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, ізотіазоліл, триазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл та піридазиніл; або біциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає хінолініл, ізохінолініл, 1,2,3,4-тетрагідроізохінолініл, хіноксолініл, індоліл, індазоліл, бензимидазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензотіазоліл, бензізотіазоліл, бензофураніл, бензотієніл, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксиніл або бензо[1,3]діоксоліл;

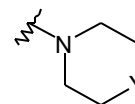
атом вуглецю кожного моноциклічного та біциклічного гетероциклу може бути необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними з групи: галоген, гідрокси, алкіл або алкілокси;

галоген являє собою замісник, вибраний із групи: фтор, хлор, бром та йод, а галогеналкіл являє собою нерозгалужений або розгалужений насичений вуглеводневий радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю або циклічний насичений вуглеводневий радикал, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, де один або декілька атомів вуглецю заміщені одним або декількома атомами галогену;



за умови, що коли радикал розташований в положенні 3 хінолінового фрагмента; R^7 розташований в положенні 4 хінолінового фрагмента, а R^2 розташований в положенні 2 хінолінового фрагмента та являє собою водень, гідрокси, меркапто, алкілокси,

алкілоксіалкілокси, алкілтію, моно- або ді(алкіл)аміно або радикал формули

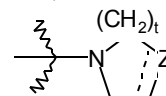


являє собою CH_2 , O, S, NH або N-алкіл;

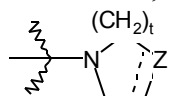
тоді s означає 1, 2, 3 або 4.

2. Сполука за п. 1, де

R^2 являє собою водень; галоген; алкіл; гідрокси; меркапто; алкілокси, необов'язково



заміщений аміно або моно- або ді(алкіл)аміно, або радикалом формули , де Z являє собою CH_2 , $\text{CH}-R^8$, O, S, $\text{N}-R^8$, а t означає ціле число, рівне 1 або 2, а пунктирна лінія означає необов'язковий зв'язок: алкілоксіалкілокси; алкілтію; моно- або ді(алкіл)аміно, де алкіл може бути необов'язково заміщений одним або двома замісниками, кожен незалежно вибраний з алкілокси або Ar, або Het, або морфолінілу, або 2-оксопіролідінілу; Het або



радикал формули , де Z являє собою CH_2 , $\text{CH}-R^8$, O, S, $\text{N}-R^8$; t означає ціле число, рівне 1 або 2; а пунктирна лінія означає необов'язковий зв'язок;

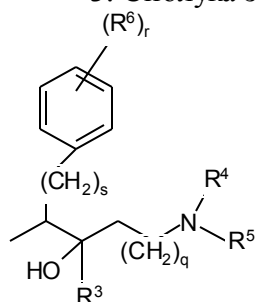
R^4 та R^5 , кожен, незалежно являють собою водень, алкіл або бензил;

або R^4 та R^5 , разом та включаючи N, до якого вони приєднані, можуть утворювати радикал, вибраний із групи, що включає піролідініл, 2H-піроліл, 2-піролініл, 3-піролініл,

піроліл, імідазолідиніл, піразолідиніл, 2-імідазолініл, 2-піразолініл, імідазоліл, піразоліл, триазоліл, піперидиніл, піридиніл, піперазиніл, імідазолідиніл, піридазиніл, піримідиніл, піразиніл, триазиніл, морфолініл та тіоморфолініл, необов'язково заміщені алкілом, галогеном, галогеналкілом, гідрокси, алкілокси, аміном, моно- або діалкіламіном, алкілтіо, алкілоксіалкілом, алкілтіоалкілом та піримідинілом;

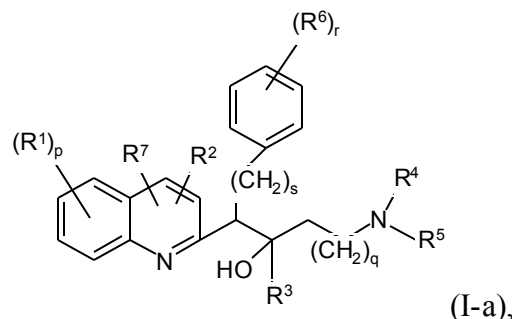
R^8 являє собою водень, алкіл, амінокарбоніл, моно- або ді(алкіл)аміно карбоніл, Ar, Het, алкіл, заміщений одним або двома Het, алкіл, заміщений одним або двома Ar, Het- $C(=O)-$; Het означає моноциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає N-феноксипіперидиніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, фураніл, тієніл, оксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, ізотіазоліл, триазоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл та піридазиніл; або біциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає хінолініл, хіноксалініл, індоліл, індазоліл, бензімідазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензотіазоліл, бензізотіазоліл, бензофураніл, бензотієніл, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксиніл або бензо[1,3]діоксоліл; атом вуглецю кожного моноциклічного та біциклічного гетероциклу може бути необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, вибраними з групи: галоген, гідрокси, алкіл або алкілокси;

3. Сполука за пп. 1 або 2, за умови, що коли радикал



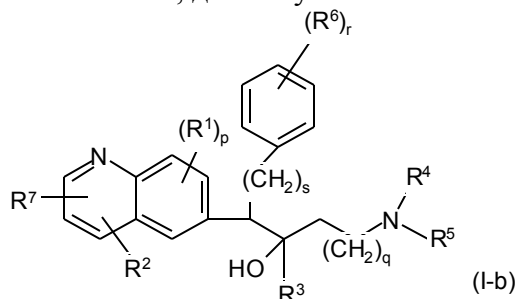
розташований в положенні 3 хінолінового фрагмента; R^7 розташований в положенні 4 хінолінового фрагмента, а R^2 розташований в положенні 2 хінолінового фрагмента, тоді s означає 1, 2, 3 або 4.

4. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де сполука являє собою сполуку формули (I-a)



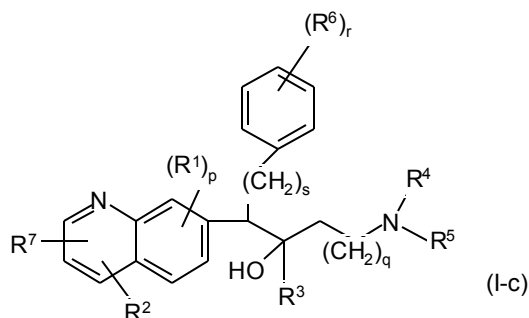
де R^1-R^7 , p, s, r та q є такими, як визначено в будь-якому з пп. 1-3.

5. Сполука за будь-яким з пп. 1-3, де сполука являє собою сполуку формули (I-b)



де R^1-R^7 , p, s, r та q є такими, як визначено в будь-якому з пп. 1-3.

6. Сполука за будь-яким з пп. 1-3, де сполука являє собою сполуку формули (I-c)



де R^1 - R^7 , p , s , r та q є такими, як визначено в будь-якому з пп. 1-3.

7. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^1 являє собою галоген.

8. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де r дорівнює 1.

9. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^2 являє собою водень, галоген або C_{1-6} -алкіл.

10. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^3 являє собою нафтил або феніл, причому кожен необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, переважно такий замісник являє собою галоген.

11. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де q означає число, рівне 1.

12. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^4 та R^5 , кожен, незалежно являє собою водень або C_{1-6} -алкіл.

13. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^6 являє собою водень, алкіл або галоген.

14. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де R^7 являє собою водень або Ar.

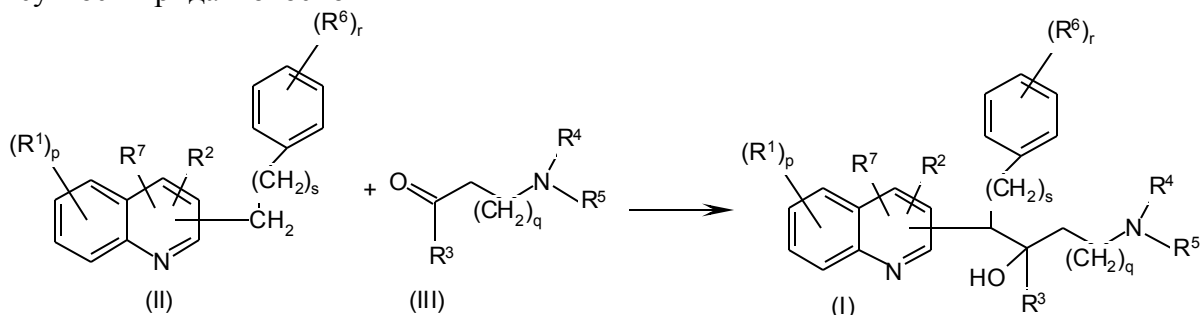
15. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, де s означає ціле число, рівне 0 або 1.

16. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів для застосування як лікарського засобу.

17. Композиція, що містить фармацевтично прийнятний носій та як активний інгредієнт терапевтично ефективну кількість сполуки, яку визначено в будь-якому з пп. 1-15.

18. Застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-15 або композиції за п. 17 для виробництва лікарського засобу для лікування мікобактеріальних захворювань.

19. Спосіб одержання сполуки за п. 1, який **відрізняється** тим, що проміжну сполуку формули (II) піддають взаємодії з проміжною сполукою формули (III), в присутності придатного агента сполучення та в присутності придатного розчинника та, необов'язково, в присутності придатної основи



де R^1 - R^7 , p , s , r та q є такими, як визначено в п. 1;

або, при бажанні, сполуки формули (Ia) або (Ib) переводять одна в одну шляхом відомих у даній галузі реакцій перетворень та потім, при бажанні, переводять сполуки формули (Ia) або (Ib) у терапевтично активну нетоксичну кислотно-адитивну сіль шляхом обробки кислотою або в терапевтично активну нетоксичну основно-адитивну сіль шляхом обробки основою, або навпаки, переводять кислотно-адитивну сольову форму в вільну основу шляхом обробки лугом, або переводять основно-адитивну сіль у вільну кислоту шляхом обробки кислотою, та, при бажанні, одержують їх стереохімічно ізомерні форми, четвертинні аміни, таутомерні форми або N-оксидні форми.