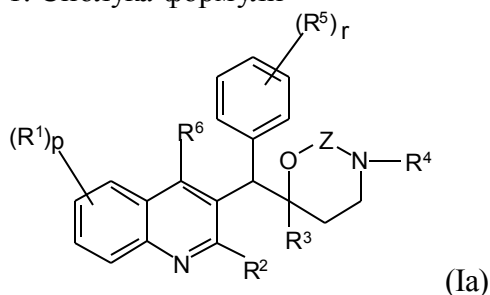
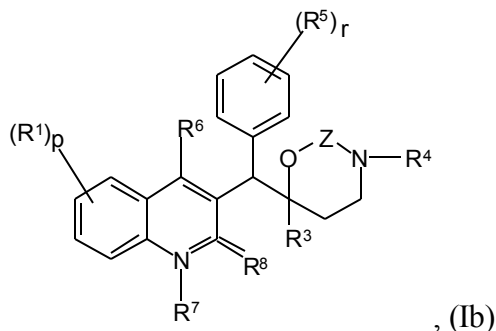


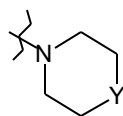
# 1. Сполука формули



або



та її фармацевтично прийнятні кислотно- або основно-адитивні солі, її четвертинні аміни, її стерехімічно ізомерні форми, її таутомерні форми та її 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, р означає ціле число, рівне 1, 2, 3 або 4;  $R^2$  являє собою водень, гідрокси, тію, алкілокси, алкілоксіалкілокси, алкілтію,



моно- або ді(алкіл)аміно або радикал формули або N-алкіл;

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

$R^4$  являє собою водень, алкіл або бензил;

$R^5$  являє собою водень, галоген, галогеналкіл, гідрокси, Ar, алкіл, алкілокси, алкілтію, алкілоксіалкіл, алкілтіюалкіл, Ar-алкіл або ді(Ar)алкіл; або два сусідні радикали  $R^5$  можуть бути взяті разом з фенільним кільцем, до якого вони приєднані, утворюючи нафтил;

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

$R^6$  являє собою водень, алкіл, Ar або Het;

$R^7$  являє собою водень або алкіл;

$R^8$  являє собою оксо; або

$R^7$  та  $R^8$  разом утворюють радикал  $-CH=CH-N=$ ;

Z являє собою  $CH_2$  або  $C(=O)$ ;

алкіл являє собою лінійний 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; або циклічний насичений вуглеводневий радикал, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, зв'язаний з лінійним або розгалуженим насиченим вуглеводневим радикалом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю; де кожен атом вуглецю може бути необов'язково заміщений галогеном, гідрокси, алкілокси або оксо;

Ar являє собою гомоцикл, вибраний із групи, що включає феніл, нафтил, аценафтил, тетрагідронафтил, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, при цьому кожен замісник незалежно вибраний із групи, що включає гідрокси, галоген, ціано, нітро, аміно, моно- або діалкіламіно, алкіл, галогеналкіл, алкілокси, галогеналкілокси, карбоксил, алкілоксикарбоніл, аміно карбоніл, морфолініл та моно- або діалкіламінокарбоніл;

Het являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає N-феноксипіперидиніл, піроліл, піразоліл, імідазоліл, фураніл, тієніл, оксазоліл, ізоксазоліл, тiazоліл, ізотiazоліл, піридиніл, піримідиніл, піразиніл та піридазиніл;

або біциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає хінолініл, хіноксалініл, індоліл, бензімідазоліл, бензоксазоліл, бензізоксазоліл, бензотiazоліл, бензізотiazоліл, бензофураніл, бензотієніл, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксиніл або бензо[1,3]діоксоліл; при цьому кожен моноциклічний та біциклічний гетероцикл може бути необов'язково заміщений на атомі вуглецю 1, 2 або 3 замісниками, вибраними з групи, що включає галоген, гідрокси, алкіл або алкілокси;

галоген являє собою замісник, вибраний із групи, що включає фтор, хлор, бром та йод, а галогеналкіл являє собою лінійний 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, в якому один або більше атомів вуглецю заміщені одним або більше атомами галогену.

2. Сполука за п. 1, в якій Z являє собою  $\text{CH}_2$ .

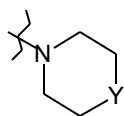
3. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, в якій  $\text{R}^3$  являє собою водень, галоген, галогеналкіл, гідрокси, Ar, алкіл, алкілокси, алкілтію, алкілоксіалкіл, алкілтіюалкіл, Ar-алкіл або ді(Ar)алкіл.

4. Сполука за п. 1 або 2, в якій

$\text{R}^1$  являє собою водень, галоген, ціано, Ar, Het, алкіл та алкілокси;

p означає ціле число, рівне 1, 2, 3 або 4;

$\text{R}^2$  являє собою водень, гідрокси, алкілокси, алкілоксіалкілокси, алкілтію або



радикал формули , де Y являє собою O;

$\text{R}^3$  являє собою алкіл, Ar, Ar-алкіл або Het;

$\text{R}^4$  являє собою водень, алкіл або бензил;

$\text{R}^5$  являє собою водень, галоген або алкіл; або

два сусідні радикали  $\text{R}^5$  можуть бути взяті разом з фенільним кільцем, до якого вони приєднані, утворюючи нафтил;

г означає ціле число, рівне 1; та

$\text{R}^6$  являє собою водень;

$\text{R}^7$  являє собою водень або алкіл;

$\text{R}^8$  являє собою оксо; або

$\text{R}^7$  та  $\text{R}^8$  разом утворюють радикал  $-\text{CH}=\text{CH}-\text{N}=\text{}$ ;

алкіл являє собою лінійний 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; або циклічний насичений вуглеводневий радикал, що містить від 3 до 6 атомів вуглецю, зв'язаний з лінійним або розгалуженим насиченим вуглеводневим радикалом, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю; де кожен атом вуглецю може бути необов'язково заміщений галогеном або гідрокси;

Ar являє собою гомоцикл, вибраний із групи, що включає феніл, нафтил, аценафтил, тетрагідронафтил, кожний з яких необов'язково заміщений 1, 2 або 3 замісниками, при цьому кожен замісник незалежно вибраний із групи, що включає галоген, галогеналкіл, ціано, алкілокси та морфолініл;

Het являє собою моноциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає N-феноксипіперидиніл, фураніл, тієніл, піридиніл, піримідиніл; або біциклічний гетероцикл, вибраний із групи, що включає бензотієніл, 2,3-дигідробензо[1,4]діоксиніл або бензо[1,3]діоксоліл; при цьому кожен моноциклічний та біциклічний гетероцикл може бути необов'язково заміщений на атомі вуглецю 1, 2 або 3 алкільними замісниками; а

галоген являє собою замісник, вибраний із групи, що включає фтор, хлор та бром.

5. Сполука за будь-яким з попередніх пунктів, що являє собою сполуку формули (Ia) та де  $\text{R}^1$  являє собою водень, галоген, Ar, Het, алкіл або алкілокси;  $p = 1$ ;  $\text{R}^2$  являє собою водень,

алкілокси або алкілтію;  $R^3$  являє собою нафтил, феніл або Het, кожний з яких необов'язково заміщений 1 або 2 замісниками, вибраними з групи, що включає галоген та галогеналкіл;  $R^4$  являє собою водень або алкіл;  $R^5$  являє собою водень, алкіл або галоген;  $r$  дорівнює 1; а  $R^6$  являє собою водень.

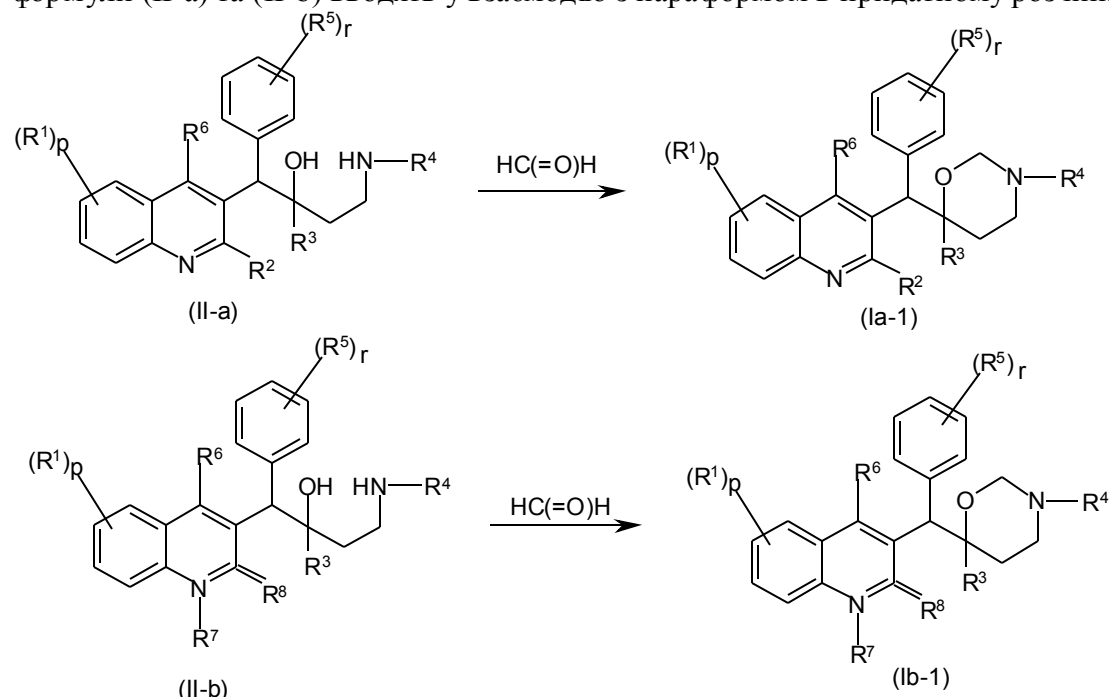
6. Сполука за будь-яким з пп. 1, 3, 4 або 5, що являє собою сполуку формули (Ia), де  $R^1$  являє собою водень, галоген, алкіл або Het;  $R^2$  являє собою алкілокси;  $R^3$  являє собою нафтил, феніл або Het, кожний з яких необов'язково заміщений галогеном;  $R^4$  являє собою алкіл;  $R^5$  являє собою водень або галоген;  $R^6$  являє собою водень;  $Z$  являє собою  $CH_2$  або  $C(=O)$ .

7. Сполука, визначена в будь-якому з попередніх пунктів, для застосування як лікарський засіб.

8. Фармацевтична композиція, що містить фармацевтично прийнятний носій та, як активний інгредієнт, терапевтично ефективну кількість сполуки, визначеної за будь-яким з пп. 1-6.

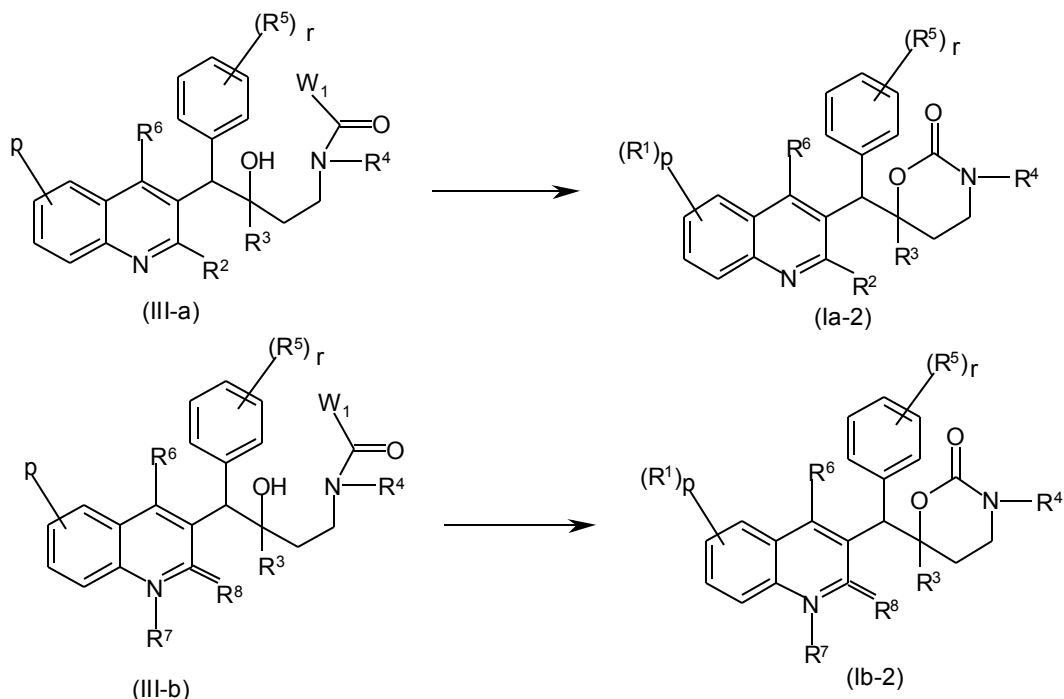
9. Застосування сполуки за будь-яким з пп. 1-6 або композиції за п. 8 для одержання лікарського засобу для лікування мікобактеріальних захворювань.

10. Спосіб одержання сполуки за п. 1, який відрізняється тим, що а) проміжну сполуку формули (II-a) та (II-b) вводять у взаємодію з параформом в придатному розчиннику



при цьому  $R^1-R^8$ ,  $p$  та  $r$  визначені в п. 1;

б) проміжну сполуку формули (III-a) та (III-b) вводять у взаємодію з придатною основою в придатному розчиннику



при цьому  $R^1$ - $R^8$ ,  $p$  та  $r$  визначені в п. 1, а  $W_1$  являє собою придатну групу, що відходить;  
 або, при бажанні, сполуки формули (Ia) або (Ib) перетворюють одну 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-оксиди.