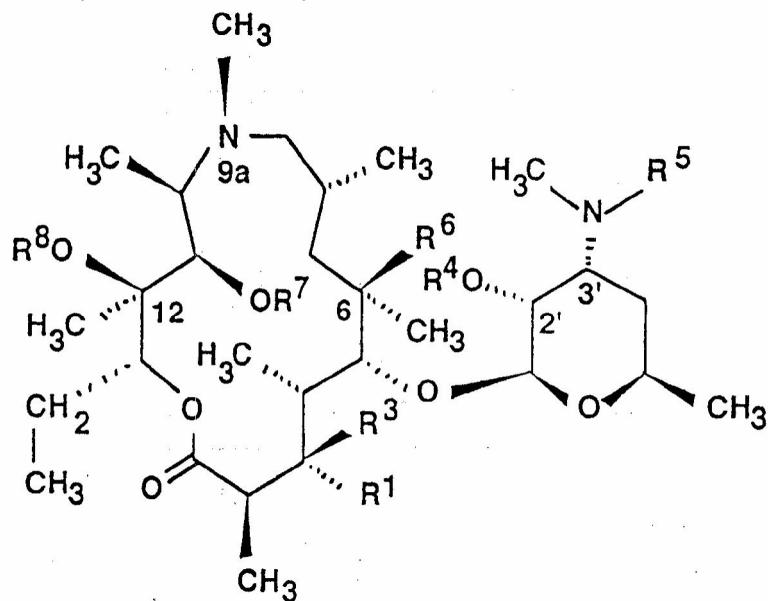
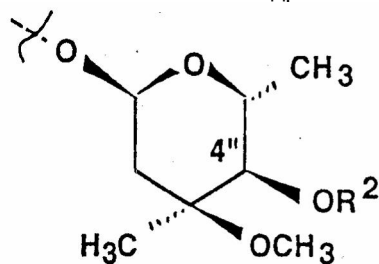


1. Сполука загальної формули (I)



(I)

де
R¹ сам по собі означає гідроксильну, L-кладинозильну групу формули (II)



(II)

за умови, що коли R¹ є гідроксильною групою, R³, R⁴ і R⁸ одночасно не є воднем та R⁷ не є воднем та метилом, коли R¹ є L-кладинозильною групою, R² і R⁸ не є воднем,

де
R² сам по собі означає водень або силільну групу,
R³ сам по собі означає водень або разом з R⁶ означає ефірну групу,
R⁴ сам по собі означає водень, (C₁-C₄)ацильну групу або -COO-(CH₂)_n-Ar групу, де n дорівнює 1-7, та Ar сам по собі означає незаміщену або заміщену арильну групу, що має аж до 18 атомів вуглецю,
R⁵ сам по собі означає водень, метильну групу або -COO-(CH₂)_n-Ar групу, де n дорівнює 1-7, та Ar сам по собі означає незаміщену або заміщену арильну групу, що має аж до 18 атомів вуглецю,
R⁶ сам по собі означає гідроксильну групу або разом з R³ означає ефірну групу,
R⁷ сам по собі означає водень, (C₁-C₁₂)алкільну групу, силільну групу або разом з R⁸ та C-11/C-12 атомами вуглецю означає циклічний карбонат,
R⁸ сам по собі означає водень, (C₁-C₁₂)алкільну групу, силільну групу або разом з R⁷ і C-11/C-12 атомами вуглецю означає циклічний карбонат,
за умови, що коли R¹ є L-кладинозильною групою та R⁴ є воднем, ацетилом та пропіонілом, R² не є воднем, та її фармацевтично прийнятні адитивні солі неорганічних або органічних кислот.

2. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R² та R⁷ однакові і означають триметилсилільну групу, R³ та R⁸ однакові і означають водень, R⁴ та R⁵ однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, та R⁶ є гідроксильною групою.

3. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R² означає триметилсилільну групу, R³, R⁷ та R⁸ однакові і означають водень, R⁴ та R⁵ однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, та R⁶ є гідроксильною групою.

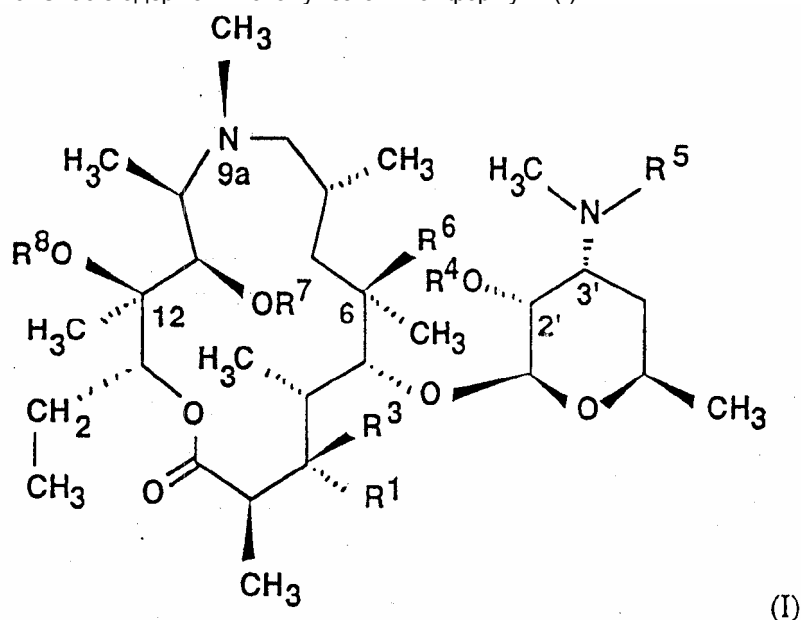
4. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R² та R⁷ однакові і означають триметилсилільну групу, R³ означає водень, R⁴ та R⁵ однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R⁶ є гідроксильною групою, та R⁸ є метилом.

5. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R² означає триметилсилільну групу, R³ та R⁸ однакові і означають водень, R⁴ та R⁵ однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R⁶ означає гідроксильну групу, та R⁷ є метилом.

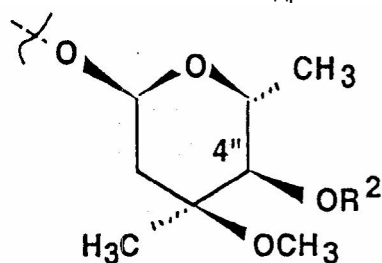
6. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R² означає триметилсилільну групу, R³ та R⁷ однакові і означають водень, R⁴ та R⁵ однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R⁶ є гідроксильною групою, та R⁸ є метилом.

7. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R¹ означає L-кладинозильну групу, R², R³, R⁴, R⁵ та R⁷ однакові і означають водень, R⁸ є метилом, та R⁶ є гідроксильною групою.

8. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає L-кладинозильну групу, R^2 , R^3 , R^4 та R^7 однакові і означають водень, R^5 та R^6 однакові і означають метил, та R^6 означає гідроксильну групу.
9. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^4 та R^7 однакові і означають водень, та R^5 і R^8 однакові та означають метил.
10. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 є метилом.
11. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 та R^8 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 і R^7 однакові та означають метил.
12. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 та R^7 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 і R^8 однакові та означають метил.
13. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 є метилом, R^7 та R^8 однакові і означають водень.
14. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 та R^7 однакові і означають метил, та R^8 є воднем.
15. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 та R^8 однакові і означають метил, та R^7 є воднем.
16. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 є метилом.
17. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 і R^7 однакові та означають метил.
18. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 та R^7 однакові і означають водень, та R^5 і R^8 однакові та означають метил.
19. Сполука за п. 1, **яка відрізняється тим, що** R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є воднем, R^5 є метилом, та R^7 і R^8 разом з C-11/C-12 атомами вуглецю означають циклічний карбонат.
20. Спосіб одержання сполук загальної формули (I)



де
 R^1 сам по собі означає гідроксильну, L-кладинозильну групу формули (II)

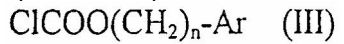


за умови, що коли R^1 є гідроксильною групою, R^3 , R^4 і R^8 одночасно не є воднем, та R^7 не є воднем та метилом, коли R^1 є L-кладинозильною групою, R^2 і R^8 не є воднем,

де
 R^2 сам по собі означає водень або силільну групу,
 R^3 сам по собі означає водень або разом з R^6 означає ефірну групу,
 R^4 сам по собі означає водень, (C_1-C_4) ацильну групу або $-COO-(CH_2)_n-Ar$ групу, де n дорівнює 1-7, та Ar сам по собі означає незаміщену або заміщену арильну групу, що має аж до 18 атомів вуглецю,
 R^5 сам по собі означає водень, метильну групу або $-COO-(CH_2)_n-Ar$ групу, де n дорівнює 1-7, та Ar сам по собі означає незаміщену або заміщену арильну групу, що має аж до 18 атомів вуглецю,
 R^6 сам по собі означає гідроксильну групу або разом з R^3 означає ефірну групу,

R^7 сам по собі означає водень, (C_1-C_{12}) алкільну групу, силільну групу або разом з R^8 та C-11/C-12 атомами вуглецю означає циклічний карбонат,
 R^8 сам по собі означає водень, (C_1-C_{12}) алкільну групу, силільну групу або разом з R^7 і C-11/C-12 атомами вуглецю означає циклічний карбонат,
за умови, що коли R^1 є L-кладинозильною групою та R^4 є воднем, ацетилом та пропіонілом, R^2 не є воднем, та їх фармацевтично прийнятних адитивних солей неорганічних або органічних кислот, **який відрізняється тим, що**

(I) азитроміцин загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^4 , R^7 і R^8 однакові і означають водень, R^5 є метилом, та R^6 є гідроксильною групою, піддають реакції з хлоридами органічних карбонових кислот формули (III)



де n дорівнює 1-7 та Ar сам по собі означає незаміщену або заміщену арильну групу, що має аж до 18 атомів вуглецю, більш прийнятно, з бензилоксикарбонільхлоридом, у присутності основ, більш прийнятно гідрокарбонату натрію, в інертному до реакції розчиннику, більш прийнятно, в бензолі чи толуолі, з одержанням сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, R^4 та R^5 однакові та означають бензилоксикарбонільну групу, та R^6 є гідроксильною групою, яку потім піддають вибірково силілуванню гідроксильних груп у

A/ 4"- та 11-положеннях 2-5-еквімолярним надлишком силілувального агента, більш прийнятно сумішшю триметилсилілхлориду та триметилсилілімідазолу, в органічному інертному розчиннику, такому як піридин, етилацетат, N,N-диметилформамід або метиленхлорид, більш прийнятно, в піридині, при температурі 0-5°C протягом 5-8 годин, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 і R^7 однакові і означають триметилсилільну групу, R^3 та R^6 однакові і означають водень, R^4 та R^5 однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, і R^6 є гідроксильною групою, або у

B/ 4"-положенні 1,1-2-еквімолярним надлишком силілувального агента в органічному інертному розчиннику, більш прийнятно, в піридині, при температурі 0-5°C протягом 1 години, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 означає триметилсилільну групу, R^3 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, R^4 та R^5 однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, і R^6 означає гідроксильну групу, яку потім піддають O-алкілюванню 1,3-10-мольним надлишком відповідного алкілувального агента, більш прийнятно, метилувального агента, більш прийнятно, метиліодиду, у присутності 1,1-8,5 молів підходящої основи, такої як гідриди лужних металів, більш прийнятно, гідриду натрію, в реакційно-інертному розчиннику, такому як диметилсульфоксид, тетрагідрофуран, N,N-диметилформамід або в їх суміші, при температурі від -15°C до кімнатної температури, більш прийнятно, при 0-5°C, з одержанням у випадку:

A/ сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 та R^7 однакові і означають триметилсилільну групу, R^3 означає водень, R^4 та R^5 однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R^6 є гідроксильною групою, та R^8 є метилом, або у випадку

B/ суміші сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 означає триметилсилільну групу, R^3 та R^8 однакові і означають водень, R^4 та R^5 однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R^6 означає гідроксильну групу, та R^7 є метилом, та сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 означає триметилсилільну групу, R^3 та R^7 однакові і означають водень, R^4 та R^5 однакові і означають бензилоксикарбонільну групу, R^6 означає гідроксильну групу, та R^8 є метилом,

яку потім піддають зняттю захисту захисних груп у 2'- та 3'-положеннях в розчині нижчих спиртів, більш прийнятно, етанолі, в присутності NaOAc/HOAc буфера (pH 5) і каталізатора в атмосфері водню при тиску 1-20 бар і потім, після виділення, десилілуванню в 4"- і 11-положеннях в нижчих спиртах, більш прийнятно, ізопропанолі, в присутності мурашиної кислоти, одержуючи у випадку

A/ сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^4 , R^5 та R^7 однакові і означають водень, R^6 є гідроксильною групою, та R^8 є метилом, або у випадку

B/ суміші сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^4 , R^5 та R^8 однакові і означають водень, R^6 є гідроксильною групою, та R^7 є метилом, і сполуки загальної формули (I), де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^7 та R^8 мають значення, подані для зняття захисту у випадку **A/**,

яку потім піддають відновлюванню 3'-N-метилуванню з 1-3 еквівалентами формальдегіду (37%) у присутності еквівалентної або подвійної кількості мурашиної кислоти (98-100%) та каталізатора гідрогенізації або якогось іншого джерела водню, в інертному щодо реакції розчиннику, більш прийнятно, в хлороформі, при підвищеній температурі, більш прийнятно, при температурі флегми, з одержанням у випадку

A/ сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^4 та R^7 однакові і означають водень, R^5 та R^8 однакові і означають метил, та R^6 є гідроксильною групою, або у випадку

B/ суміші сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу формули (II), R^2 , R^3 , R^4 та R^8 однакові і означають водень, R^5 та R^7 однакові і означають метил, та R^6 є гідроксильною групою, та сполуки загальної формули (I), де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^7 та R^8 мають значення, наведені для 3'-N-метилування у випадку **A/**, яку потім необов'язково піддають поділу на силікагельній колонці з одержанням хроматографічно однорідної сполуки загальної формули (I), де R^1 означає L-кладинозильну групу, R^2 , R^3 , R^4 та R^8 однакові і означають водень, R^5 і R^7 однакові і означають метил, та R^6 є гідроксильною групою (11-O-метил-азитроміцин) або сполуки загальної формули (I), де R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 та R^8 мають значення, наведені для 3'-N-метилування у випадку **A/** (12-O-метил-азитроміцин), або тим, що

(II) азитроміцин або його 11-O-метил і 12-O-метил-похідні, одержані згідно з способом (I), необов'язково піддають реакції гідролізу з розбавленими неорганічними кислотами, більш прийнятно з 0,25 N соляною кислотою, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^4 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 є метилом, або сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^4 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 і R^7 однакові і означають метил,

або сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^4 та R^7 однакові і означають водень, та R^5 і R^8 однакові і означають метил,

яку потім необов'язково піддають реакції вибіркового ацилювання гідроксильної групи в 2'-положенні з хлоридами або ангідридами карбонових кислот, що мають аж до 4 атомів вуглецю, більш прийнятно з ангідридом оцтової кислоти, у інертному до реакції органічному розчиннику, більш прийнятно, в метиленхлориді, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 є метилом, або сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 та R^8 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 і R^7 однакові і означають метил, або сполуку загальної формули (I), де R^1 та R^6 однакові і означають гідроксильну групу, R^3 та R^7 однакові і означають водень, R^4 є ацетилом, та R^5 і R^8 однакові та означають метил,

яку потім необов'язково піддають окисленню реагентом Джонса або відповідно до модифікованого способу Моффата-Пфіцнера, більш прийнятно N,N-диметиламінопропілетилкарбодіімідом, у присутності диметилсульфоксиду або піридиніуму трифторацетату як каталізатора, у інертному органічному розчиннику, більш прийнятно, метиленхлориді, при температурі від 10°C до кімнатної температури, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 є метилом, та R^7 і R^8 однакові та означають водень, або сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 та R^7 однакові і означають метил, та R^8 є воднем, або сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є ацетилом, R^5 та R^8 однакові і означають метил, та R^7 є воднем,

яку потім піддають реакції деацилювання в 2'-положенні шляхом сольволізу в нижчих спиртах, більш прийнятно, в метанолі, при кімнатній температурі, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 є метилом, або сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 і R^7 однакові та означають метил, або сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 та R^7 однакові і означають водень, та R^5 і R^8 однакові і означають метил,

а потім сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 , R^7 та R^8 однакові і означають водень, та R^5 є метилом, необов'язково піддають реакції з етиленкарбонатом у присутності неорганічних або органічних основ, більш прийнятно, карбонату калію, в інертному щодо реакції розчиннику, більш прийнятно, етилацетаті, одержуючи сполуку загальної формули (I), де R^1 означає гідроксильну групу, R^3 разом з R^6 означає ефірну групу, R^4 є воднем, R^5 є метилом, та R^7 і R^8 разом з C-11 та C-12 атомами вуглецю означають циклічний карбонат.

21. Фармацевтична композиція, корисна у лікуванні бактеріальних інфекцій у людей та тварин, яка містить антибактеріально ефективні кількості сполуки загальної формули (I) або її фармацевтично прийнятних адитивних солей за п. 1 у поєднанні з фармацевтично прийнятним носієм.

22. Спосіб лікування бактеріальних інфекцій у людей та тварин, при якому здійснюють введення людям або тваринам антибактеріально ефективної кількості сполуки загальної формули (I) або її фармацевтично прийнятних солей неорганічних чи органічних кислот за п. 1 у поєднанні з фармацевтично прийнятним носієм.