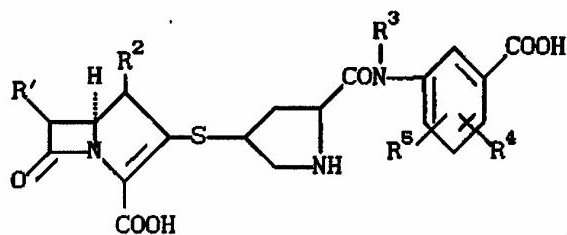


1. Производные карбапенема общей формулы I



в которой R¹ - оксиметил или 1-оксиэтил,

R² - водород или (C₁-C₄)-алкил,

R³ - водород или (C₁-C₄)-алкил,

R⁴ и R⁵, одинаковые или различные, представляют собой атом водорода, атом галогена, amino, цианогруппу, (C₁-C₄)-алкил, гидроксигруппу, карбоксигруппу, (C₁-C₄)алкоксигруппу, (C₁-C₄)алкоксикарбонил, карбамоил, (C₁-C₄)алкилкарбамоил, ди(C₁-C₄)алкилкарбамоил, трифторметил, сульфокислотную группу, (C₁-C₄)алкиламино, ди(C₁-C₄)алкиламиногруппу, (C₁-C₄)алканойламиногруппу, (C₁-C₄)алканойл [N-(C₁-C₄)алкил] аминогруппу, (C₁-C₄)алкансульфонамидогруппу, (C₁-C₄)алкилсульфинилгруппу, (C₁-C₄)алкилтиогруппу и (C₁-C₄)алкилсульфонилгруппу при условии, что в ортоположении к -N-R³ группе нет гидроксильного или карбоксильного заместителя, их фармацевтически приемлемые соли и гидролизующие in vivo эфиры.

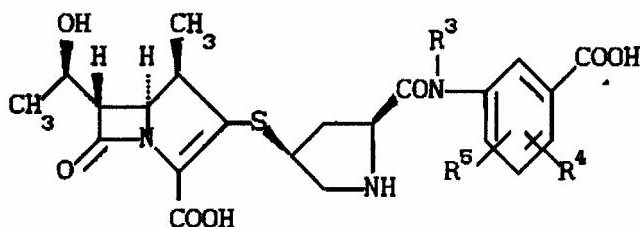
2. Соединение по п. 1, в котором R¹ - 1-оксиэтил.

3. Соединение по п. 1 или 2, в котором R² - водород или метил.

4. Соединение по п. 1 или 2, в котором R² - метил.

5. Соединение по любому из пп. 1 - 4, в котором R³ - водород.

6. Соединение по любому из пп. 1 - 5 общей формулы IV



в которой R³, R⁴ и R⁵ являются такими, как определено в п. 1.

7. Соединение по п. 6, в котором R⁴ и R⁵ одинаковые или разные и выбраны из водорода, фтора, хлора, гидроксила, карбоксила, цианогруппы, метила, этила, метоксигруппы, метоксикарбонила, карбамоила, метилкарбамоила, диметилкарбамоила, трифторметила, сульфокислотной группы, метилсульфинильной группы, метилсульфонильной группы, метансульфонамидогруппы или ацетамидогруппы.

8. Соединение по п. 6 или 7, в котором по крайней мере один из R⁴ и R⁵ является водородом.

9. Соединение по п. 6, в котором R⁴ - водород, карбоксил, фтор, хлор, метил, метоксигруппа, цианогруппа, сульфокислотная группа или метоксикарбонил, а R⁵ - водород.

10. Соединение по п. 1, представляющее собой одно из нижеперечисленных соединений:

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-5-оксифенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-4-хлорфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-6-хлорфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбоксифенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-6-метан-сульфонилфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-4-фторфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-6-фторфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-2,4-дифторфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3,4-дикарбоксифенилкарбамоил)-пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-4-оксифенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3,5-дикарбоксифенилкарбамоил)-пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(2-карбамоил-3-карбоксифенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

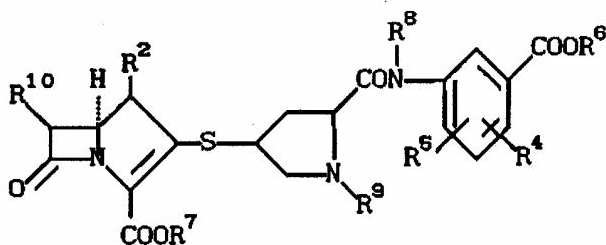
(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-4-карбамоилфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-5-карбамоилфенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота,

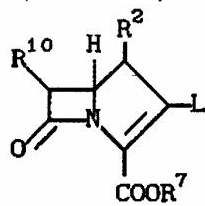
(1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбокси-5-ацетидафенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-

[illegible]

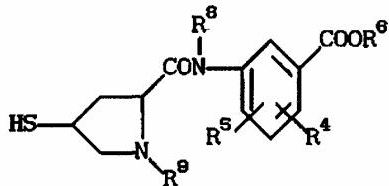
12. Соединение по п. 1, представляющее собой (1R, 5S, 6S, 8R, 2'S, 4'S)-2-(2-(3-карбоксифенилкарбамоил)пирролидин-4-илтио)-6-(1-оксиэтил)-1-метилкарбапенем-3-карбоновая кислота, или ее фармацевтически приемлемая соль, или гидролизуемый *in vivo* эфир.
13. Соединение по п. 12 в форме карбоновой кислоты.
14. Соединение по п. 12 в форме моноватриевой соли.
15. Соединение по п. 12 в форме динатриевой соли.
16. Соединение по п. 12, представляющее собой смесь моноватриевой соли и динатриевой соли.
17. Фармацевтическая композиция, обладающая антибактериальной активностью, содержащая активное начало - производное 2-(пирролидин-4-ил)тио-замещенного карбапенема и фармацевтически приемлемый носитель, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит эффективное количество соединения общей формулы I по любому из пп. 1 - 16, или его фармацевтически приемлемой соли, или его гидролизуемого *in vivo* эфира.
18. Фармацевтическая композиция по п. 17, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит соединение по п. 12, или его фармацевтически приемлемую соль, или гидролизуемый *in vivo* эфир.
19. Фармацевтическая композиция по п. 17, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит соединение по п. 13, или его фармацевтически приемлемую соль, или гидролизуемый *in vivo* эфир.
20. Фармацевтическая композиция по п. 17, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит соединение по п. 14.
21. Фармацевтическая композиция по п. 17, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит соединение по п. 15.
22. Фармацевтическая композиция по п. 17, **отличающаяся** тем, что в качестве активного начала она содержит смесь солей по п. 16.
23. Способ получения соединений общей формулы I, охарактеризованных в п. 1, их фармацевтически приемлемых солей и эфиров, гидролизуемых *in vivo*, **отличающийся** тем, что соединение общей формулы V



- где R^4 , R^5 и R^6 являются такими, как определено в п. 1, причем R^4 и R^5 при необходимости могут быть защищены,
- $-COOR^6$ и $-COOR^7$ представляют собой карбоксильные группы или защищенные карбоксильные группы,
- R^8 представляют собой R^3 , определенный в п. 1, или аминозащищенную группу,
- R^9 - атом водорода или аминозащищающая группа,
- R^{10} представляет собой R^1 , определенный в п. 1, защищенный оксиметил или защищенный 1-оксиэтил, причем в соединении присутствует по крайней мере одна защитная группа, подвергают удалению защитных групп и, в случае необходимости, полученный целевой продукт переводят в его фармацевтически приемлемую соль и/или этерифицируют с образованием эфира, гидролизуемого *in vivo*.
24. Защищенные производные карбапенема общей формуле V, определенной в п. 23.
25. Соединение общей формулы V по п. 24, где R^2 - метил, R^{10} - 1-оксиэтил, R^4 и R^5 - водород и гидроксильная группа в 1-оксиэтильной группе является незащищенной или защищенной.
26. Способ получения соединений общей формулы I, определенной в п. 1, их производных, содержащих по крайней мере одну защитную группу, их фармацевтически приемлемых солей и их эфиров гидролизуемых *in vivo*, **отличающийся** тем, что соединение общей формулы VI



- где R^2 имеет значения, определенные в п. 1,
- R^{10} представляет собой R^1 , определенный в п. 1, защищенный оксиметил или защищенный 1-оксиэтил,
- $-COOR^7$ - карбоксильная группа или защищенная карбоксильная группа,
- L - уходящая группа,
- подвергают взаимодействию с соединением общей формулы VII



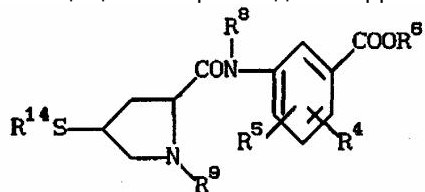
- где R^4 и R^5 такие, как в п. 1 и при необходимости могут быть защищены,
- $-COOR^6$ - карбоксильная группа или защищенная карбоксильная группа,
- R^8 представляет собой R^3 , определенный в п. 1, или аминозащищающую группу,
- R^9 - атом водорода или аминозащищающая группа,

при условии, что по крайней мере одно из взаимодействующих соединений содержит по крайней мере одну из защитных групп с последующим удалением защитных групп и, в случае необходимости, полученный целевой продукт переводят в фармацевтически приемлемые соли и/или этерифицируют с образованием эфира, гидролизуемого *in vivo*.

27. Производные пирролидин-4-ил-тиола общей формулы VII, определенной в п. 26.

28. Производные пирролидин-4-ил-тиола общей формулы VII по п. 27, где R^4 и R^5 представляют собой водород.

29. Защищенные производные пирролидин-4-ил-тиола общей формулы IX



где R^{14} - защитная группа, а R^4 , R^5 , R^6 , R^8 и R^9 такие, как в п. 26.

30. Соединение общей формулы IX по п. 29, где R^4 и R^5 представляют собой водород.