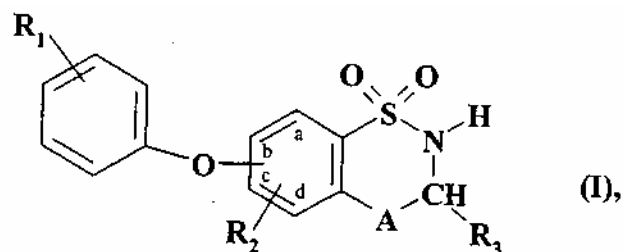


1. Сполука формули (I):

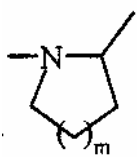


де:

R_1 являє собою гетероциклічну групу,

R_2 являє собою атом водню,

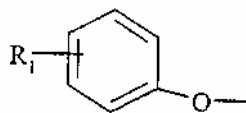
A являє собою атом азоту і, разом з розташованою поряд $-CHR_3$ -групою,



утворює кільце , де m являє собою 1,

R_3 являє собою атом водню, лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу або (C_3 - C_7)циклоалкільну групу,

а також її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою, при цьому гетероциклічна група означає моноциклічну, ароматичну або неароматичну групу, яка містить від одного до чотирьох однакових або різних гетероатомів, вибраних з азоту, кисню і сірки, необов'язково заміщену групою, вибраною з лінійного або розгалуженого (C_1 - C_6)алкілу, оксо і тіоксо.



2. Сполука формули (I) за п. 1, де група знаходиться у положенні b фенілу, який її містить.

3. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1 або 2, де R_1 являє собою моноциклічну гетероциклічну групу.

4. Сполука формули (I) за п. 3, де R_1 являє собою ароматичну моноциклічну гетероциклічну групу.

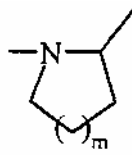
5. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-4, де R_1 являє собою тетразолільну, фурильну або оксазолільну групу.

6. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-5, де R_1 знаходиться у мета-положенні структури фенокси кільця, яке її містить.

7. Сполука формули (I) за будь-яким з пп. 1-5, де R_1 знаходиться у пара-

положенні структури феноксикільця, яке її містить.

8. Сполуки формули (I) за будь-яким з пп. 1-7, де А, разом з розташованою



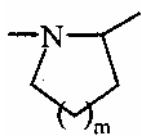
поряд -CHR₃-групою, утворює кільце , де m являє собою 1, 2 або 3, переважно 1.

9. Сполука формули (I), яка являє собою 7-[3-(1Н-тетразол-5-іл)фенокси]-2,3,3а,4-тетрагідро-1Н-піроло[2,1-с][1,2,4]бензотіадіазин 5,5-діоксид.

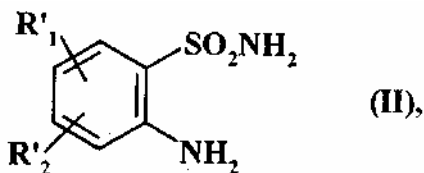
10. Сполука формули (I), яка являє собою 7-[3-(3-фурил)фенокси]-2,3,3а,4-тетрагідро-1Н-піроло[2,1-с][1,2,4]бензотіадіазин 5,5-діоксид.

11. Сполука формули (I), яка являє собою 7-[3-(1,3-оксазол-5-іл)фенокси]-2,3,3а,4-тетрагідро-1Н-піроло[2,1-с][1,2,4]бензотіадіазин.

12. Спосіб одержання сполук формули (I) за п. 1, де А являє собою NR₄ групу або А являє собою атом азоту і, разом з розташованою поряд -CHR₃-групою,



утворює кільце , де m являє собою 1, 2 або 3, який **відрізняється** тим, що як вихідну сполуку використовують сполуку формули (II):



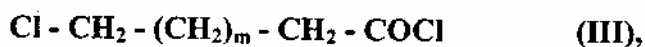
де:

R'₁ являє собою лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкоксигрупу,

R'₂ являє собою атом водню, атом галогену або лінійну або розгалужену (C₁-C₆)алкоксигрупу,

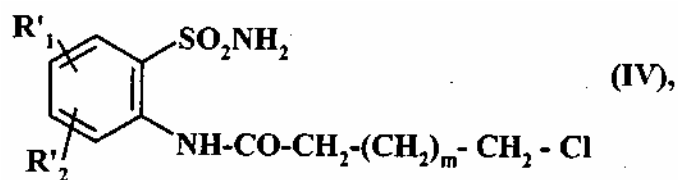
яку:

(а) або піддають реакції з кислотним хлоридом формули (III) у присутності основи, у середовищі тетрагідрофурану або ацетонітрилу:

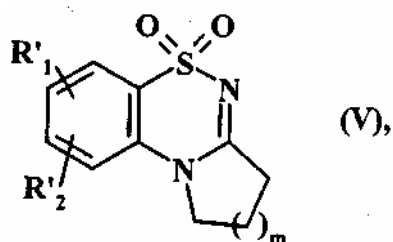


де m є таким, як визначено для формули (I),

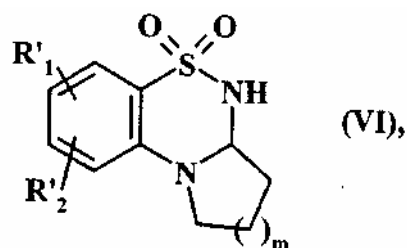
з одержанням сполуки формули (IV):



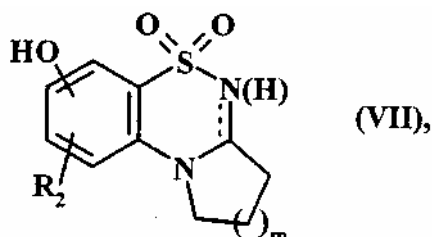
де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,
яку потім циклізують у середовищі основи з одержанням сполуки формули (V):



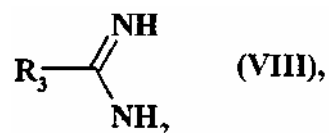
де R'_1 , R'_2 і m є такими, як визначено вище,
яку необов'язково піддають відновленню, у середовищі спирту або диметилформаміду, у присутності боргідриду натрію, з одержанням сполуки формули (VI):



де R'_1 , R'_2 і m є такими, як визначено вище,
де сполуку формули (V) або (VI) піддають дії триброміду бору з одержанням сполуки формули (VII):

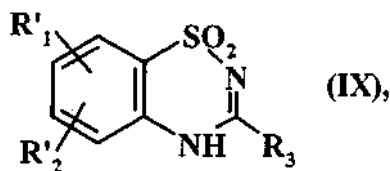


де R_2 є таким, як визначено для формули (I), і m є таким, як визначено вище,
(b) або циклізують:
- у присутності амідину формули (VIII):



де R_3 є таким, як визначено для формули (I),

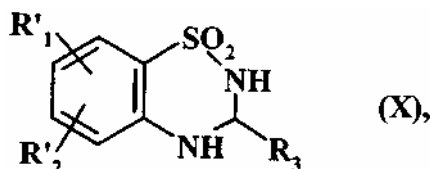
з одержанням сполуки формули (IX):



де R'_1 , R'_2 і R_3 є такими, як визначено вище,

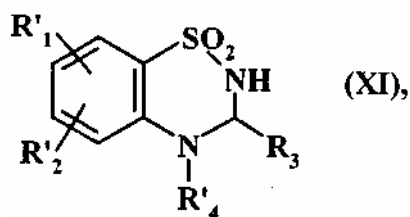
яку:

- або відновлюють, використовуючи металевий гідрид, з одержанням сполуки формули (X):



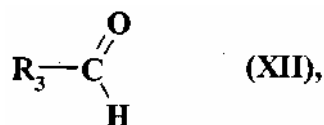
де R'_1 , R'_2 і R_3 є такими, як визначено вище,

- або алкілюють шляхом дії сильної основи у присутності алкілюючого агента $\text{R}'_4\text{X}$, де R'_4 являє собою лінійну або розгалужену ($\text{C}_1\text{--C}_6$)алкільну групу, а X являє собою атом галогену, і потім відновлюють з одержанням сполуки формули (XI):



де R'_1 , R'_2 , R_3 і R'_4 є такими, як визначено вище,

- у присутності альдегіду формули (XII):

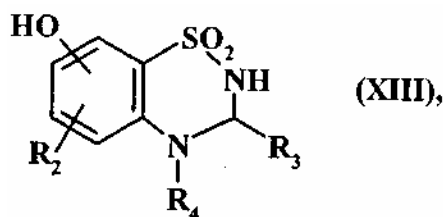


де R_3 є таким, як визначено для формули (I),

з одержанням сполуки формули (X), описаної вище,

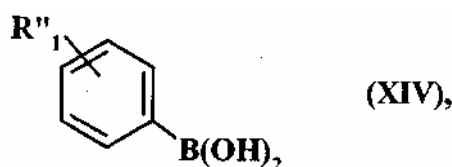
де у сполуці формули (X) або (XI) групу R'_1

та, коли група R'_2 являє собою лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксигрупу, групу R'_2 перетворюють на гідроксигрупи з одержанням сполуки формули (XIII):



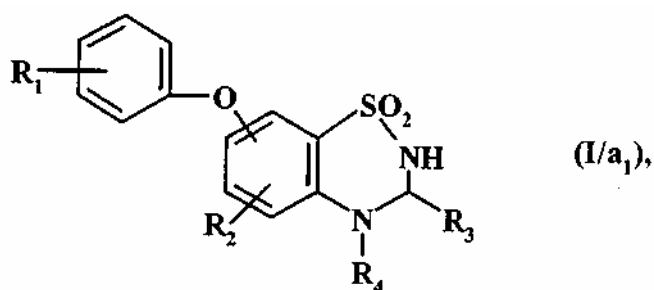
де R_2 , R_3 і R_4 є такими, як визначено для формули (I),

де сполуку формули (VII) або (XIII) піддають реакції з бороновою кислотою сполуки формули (XIV):

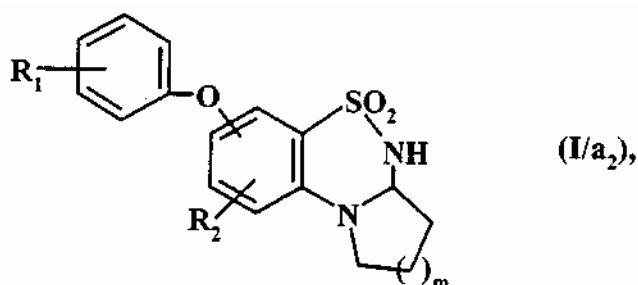


де R''_1 являє собою ціаногрупу або гетероцикл,

з одержанням (після необов'язкового перетворення групи R''_1 , коли остання являє собою ціаногрупу, у відповідну тетразолільну групу) сполуки формули (I/a₁) або (I/a₂), конкретних варіантів сполуки формули (I):



де R_1 , R_2 , R_3 і R_4 є такими, як визначено для формули (I),



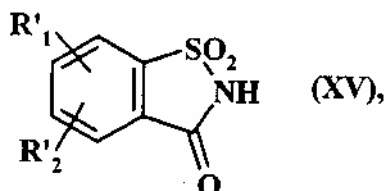
де R_1 , R_2 і m є такими, як визначено для формули (I),

де сполуки формул (I/a₁) і (I/a₂)

очищують, якщо необхідно, відповідно до звичайної техніки очищення,

розділяють, якщо бажано, на їх ізомери відповідно до звичайної техніки розділення і перетворюють, якщо бажано, у їх адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

13. Спосіб одержання сполук формули (I) за п. 1, де А являє собою CR_4R_5 групу, який **відрізняється** тим, що як вихідний матеріал використовують сполуку формули (XV):

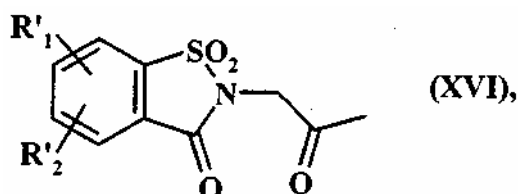


де:

R'_1 являє собою лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксигрупу,

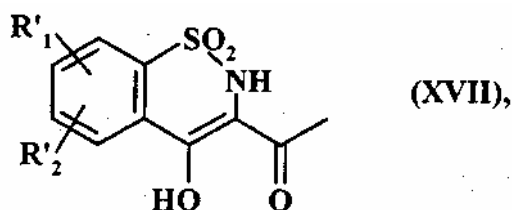
R'_2 являє собою атом водню, атом галогену або лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксигрупу,

яку піддають дії хлорацетону у присутності диметилформаміду з одержанням сполуки формули (XVI):



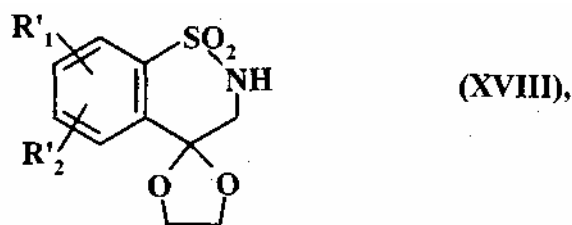
де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,

яку піддають перегрупуванню у середовищі основи з одержанням сполуки формули (XVII):

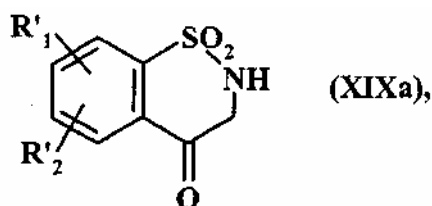


де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,

яку деацетилюють шляхом нагрівання зі зворотним холодильником у середовищі бензолу у присутності надлишку етиленгліколю і каталітичної кількості р-толуолсульфонової кислоти з одержанням сполуки формули (XVIII):



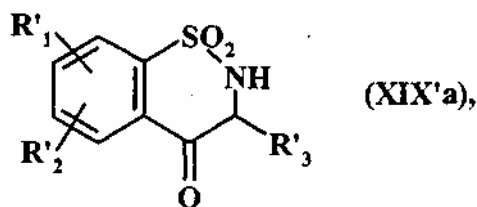
де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,
яку піддають гідролізу у середовищі кислоти з одержанням сполуки формули (XIXa):



де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,
атом азоту якої необов'язково, в залежності від природи групи R_3 , що є бажаною, захищають захисною групою і яку потім, після обробки сильною основою, обробляють сполукою формули R'_3 -P,

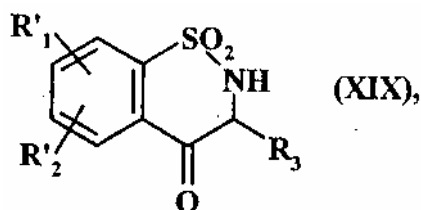
де R'_3 являє собою лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкільну групу або (C_3 - C_7)циклоалкільну групу і P являє собою відхідну групу,

з одержанням, після зняття захисту атома азоту, сполуки формули (XIX'a)



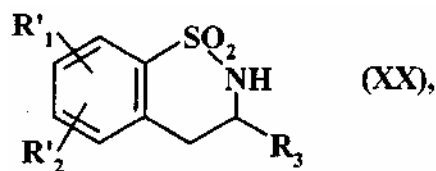
де R'_1 , R'_2 і R'_3 є такими, як визначено вище,

де сполуку формули (XIXa) або (XIX'a), представлену формулою (XIX):



де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище, і R_3 є таким, як визначено для формули (I):

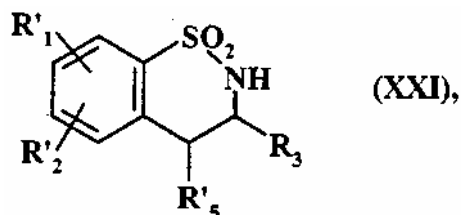
- або піддають каталітичному відновленню з одержанням сполуки формули (XX):



де R'_1 і R'_2 є такими, як визначено вище,

- або перетворюють дією гідриду у спирт, гідроксигрупу якої перетворюють в атом галогену дією відповідного реагенту

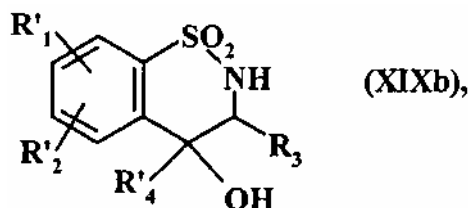
з одержанням сполуки формули (XXI):



де R'_1 , R'_2 і R_3 є такими, як визначено вище, і R'_5 являє собою атом галогену,

- або піддають дії магнійорганічної сполуки R'_4MgBr , де R'_4 являє собою лінійну або розгалужену (C_1 - C_6) алкільну групу,

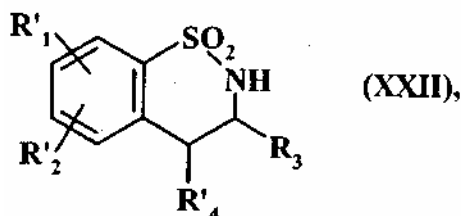
з одержанням сполуки формули (XIXb):



де R'_1 , R'_2 , R_3 і R'_4 є такими, як визначено вище,

де сполуку формули (XIXb)

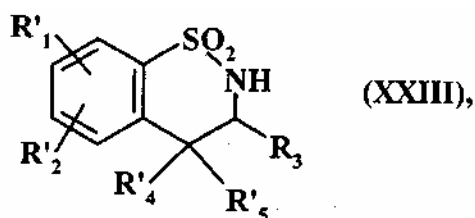
- або піддають каталітичному відновленню з одержанням сполуки формули (XXII):



де R'_1 , R'_2 , R_3 і R'_4 є такими, як визначено вище,

- або її гідроксигрупу перетворюють в атом галогену дією відповідного реагенту

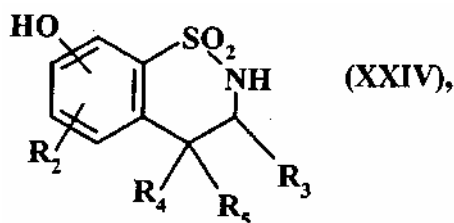
з одержанням сполуки формули (XXIII):



де R'_1 , R'_2 , R_3 і R'_4 є такими, як визначено вище, і R'_5 являє собою атом галогену,

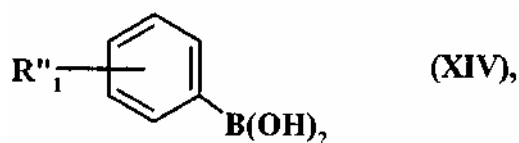
де сполуки формул (XX) - (XXIII), групу R'_1 і, коли група R'_2 являє собою лінійну або розгалужену (C_1 - C_6)алкоксигрупу, групу R'_2 перетворюють у гідроксигрупи

з одержанням сполуки формули (XXIV):



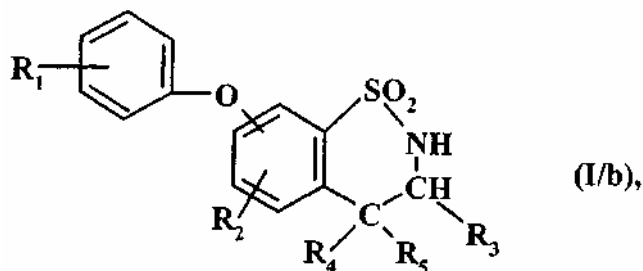
де R_2 , R_3 , R_4 і R_5 є такими, як визначено для формули (I),

де сполуку формули (XXIV) піддають реакції з бороною кислотою сполуки формули (XIV):



де R''_1 являє собою ціаногрупу або гетероцикл,

з одержанням (після необов'язкового перетворення групи R''_1 , коли остання являє собою ціаногрупу, у відповідну тетразолільну групу) сполуки формули (I/b), конкретного варіанта сполуки формули (I):



де R_1 , R_2 , R_3 , R_4 і R_5 є такими, як визначено для формули (I),

де сполуку формули (I/b) очищують, якщо необхідно, відповідно до звичайної техніки очищення, розділяють, якщо бажано, на її ізомери відповідно до звичайної

техніки розділення і перетворюють, якщо бажано, у її адитивні солі з фармацевтично прийнятною кислотою або основою.

14. Фармацевтична композиція, яка містить як активний інгредієнт сполуку за будь-яким з пп. 1-11 у поєднанні з одним або більше інертними, нетоксичними, фармацевтично прийнятними ексципієнтами або носіями.

15. Фармацевтична композиція за п. 14, яка містить як активний інгредієнт сполуку за будь-яким з пп. 1-11, для застосування як лікарських засобів - модуляторів АМРА.