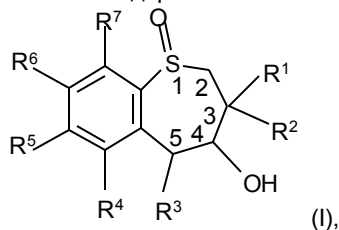


1. Спосіб одержання енантимерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду формули (I):



(I),

який відрізняється тим, що:

R^1 і R^2 нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил і гетероарил;
 R^3 належить до групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл, OR^{24} , SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} і SO_3R^{15} ,
де алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл і четвертинний гетероарил може бути заміщено однією або кількома замісними групами, які нарізно вибрано з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, арилалкіл, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, галоген, оксо, OR^{19} , $NR^{19,20}$, SR^{19} , $S(O)R^{19}$, SO_2R^{19} , SO_3R^{19} , $NR^{19}OR^{20}$, $NR^{19}NR^{20,21}$, NO_2 , CO_2R^{19} , CN , OM , SO_2OM , $SO_2NR^{19,20}$, $C(O)NR^{19,20}$, $C(O)OM$, COR^{19} , $P(O)R^{19,20}$, $P^+R^{19,20,21}A^-$, $P(OR^{19})OR^{20}$, $S^+R^{19,20}A^-$ і $N^+R^{15}R^{17}R^{18}A^-$,

де:

A^- означає застосовний у фармацевтиці аніон і M^+ - застосовний у фармацевтиці катіон; вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл може бути далі заміщено однією або кількома замісними групами з OR^{13} , $NR^{13,14}$, SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , SO_3R^{13} , CO_2R^{13} , CN , оксо, $CONR^{13,14}$, $N^+R^{13,14}R^{15}A^-$, алкілу, алкенілу, алкінілу, арилу, циклоалкілу, гетероциклу, арилалкілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарила, $P(O)R^{13,14}$, $P^+R^{13,14}R^{15}A^-$ і $P(O)(OR^{13})OR^{14}$, і

де вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл можуть мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O, NR^{13} , $N^+R^{13,14}A^-$, S, SO, SO_2 , $S^+R^{13}A^-$, PR^{13} , $P(O)R^{13}$, $P^+R^{13,14}A^-$ або фенолом;

R^{19} , R^{20} і R^{21} нарізно вибрано з групи, до якої належать водень, алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, арил, арилалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, гетероарил, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, полієфір, алкіларилалкіл, алкілгетероарилалкіл, алкілгетероциклалкіл, гетероциклалкіл, гетероарилалкіл, четвертинний гетероциклалкіл, алкіламонійалкіл, карбоксіалкіламінокарбоніалкіл і четвертинний гетероарилалкіл, де алкіл, алкеніл, алкініл, арилалкіл, гетероцикл і поліалкіл можуть мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O, NR^{15} , $N^+R^{15}R^{16}A^-$, S, SO, SO_2 , $S^+R^{15}A^-$, PR^{15} , $P^+R^{15}R^{16}A^-$, $P(O)R^{15}$, фенолом, вуглеводом, амінокислотою, пептидом або поліпептидом, і

R^{19} , R^{20} і R^{21} може бути заміщено однією або кількома групами з гідрокси, аміно, сульфо, карбокси, сульфоалкілу, карбоксіалкілу, алкілу, гетероциклу, гетероарила, четвертинного гетероциклалкілу, четвертинного гетероарилалкілу, гуанідинілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарила, OR^{15} , $NR^{15,16}$, $N^+R^{15}R^{17}R^{18}A^-$, SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , оксо, CO_2R^{15} , CN , галогену, $CONR^{15,16}$, SO_2OM , $SO_2NR^{15,16}$, $PO(OR^{22})OR^{23}$, $P^+R^{15}R^{16}R^{17}A^-$, $S^+R^{15}R^{16}A^-$ і $C(O)OM$,

де R^{22} і R^{23} нарізно вибрано із замісників R^{15} і M або

R^{20} і R^{21} разом із атомом азоту, з яким вони зв'язуються, утворюють циклічне кільце;

R^{24} належить до групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, алкіламонійалкіл і арилалкіл;

R^{13} і R^{14} нарізно вибрано з групи, що включає водень і алкіл;

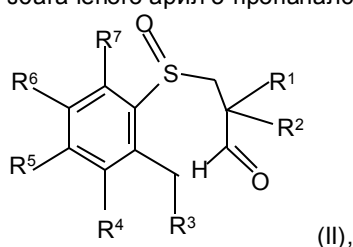
R^{15} і R^{16} нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, арилалкіл, карбоксіалкіл, карбоксигетероарил, карбоксигетероцикл, карбоалкоксіалкіл, карбоалкіламіно, гетероарилалкіл, гетероциклалкіл і алкіламонійалкіл; і

R^{17} і R^{18} нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, алкеніалкіл, алкінілалкіл, гетероцикл, карбоксіалкіл, карбоалкоксіалкіл, циклоалкіл, ціаноалкіл, OR^{15} , $NR^{15,16}$, SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , CO_3R^{15} , CN , галоген, оксо і $CONR^{15,16}$, де R^{15} і R^{16} мають вищенаведені значення, або

R^{17} і R^{18} разом із атомом азоту або вуглецю, з яким вони зв'язуються, утворюють циклічне кільце; і

R^4 , R^5 , R^6 і R^7 нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гало, алкокси, арилокси, $-NO_2$ і $-NR^9R^{10}$,

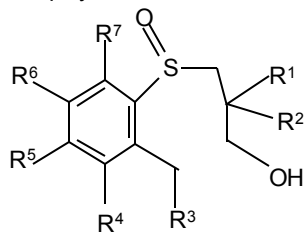
R^9 і R^{10} нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, бутоксикарбоніл і карбобензилокси;
змінна R^3 і гідроксильна група в 4-положенні енантимерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду знаходяться у син-конформаційному стані по відношенню одна до одної; алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, алкокси й арилокси може бути заміщено однією або кількома частками алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу, арилу, гетероарила, алкокси, арилокси, $-NO_2$ і гало; і сірка в 1-положенні й атоми вуглецю в 4- і 5-положеннях семичленного кільця являють собою хіральні центри; де спосіб включає циклізацію енантимерно збагаченого арил-3-пропаналсульфоксиду формули (II):



(II),

де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають вищенаведені значення, а сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр, що уможливорює одержання енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду формули (I).

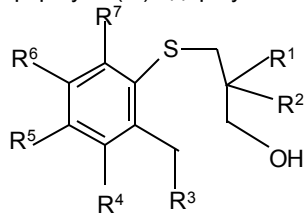
2. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що енантімерно збагачений арил-3-пропаналсульфоксид формули (II) одержують окисненням енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду формули (III):



де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 (III),

мають значення за п. 1, а сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр, що уможливорює одержання енантімерно збагаченого арил-3-пропаналсульфоксиду формули (II).

3. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що енантімерно збагачений арил-3-гідроксипропілсульфоксид формули (III) одержують окисненням за умов енантіоселективності арил-3-гідроксипропілсульфіду формули (IV):



де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 (IV),

мають значення за п. 2, що уможливорює одержання енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду формули (III).

4. Спосіб за п. 1, який **відрізняється** тим, що вищенаведений процес циклізації здійснюють в присутності основи.

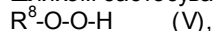
5. Спосіб за п. 4, який **відрізняється** тим, що вищенаведена основа являє собою t-бутоксид калію.

6. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що окиснення енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду здійснюють в присутності піридинового комплексу триоксиду сірки.

7. Спосіб за п. 2, який **відрізняється** тим, що окиснення енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду здійснюють в присутності комплексу піридин-хрому.

8. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення здійснюють із застосуванням алкоголяту титану (IV) і діалкілтартрату.

9. Спосіб за п. 8, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення далі забезпечують шляхом застосування сполуки гідропероксиду формули (V):



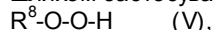
де R^8 являє собою частку H, алкілу, карбоалкілу, бензилу, бензоїлу або кумілу.

10. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що R^8 означає куміл.

11. Спосіб за п. 9, який **відрізняється** тим, що R^8 означає трет-бутил.

12. Спосіб за п. 8, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення здійснюють із застосуванням ізопропоксиду титану (IV) і діетил-D-тартрату.

13. Спосіб за п. 12, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення далі забезпечують шляхом застосування сполуки гідропероксиду формули (V):



де R^8 являє собою частку H, алкілу, карбоалкілу, бензилу, бензоїлу або кумілу.

14. Спосіб за п. 13, який **відрізняється** тим, що R^8 означає куміл.

15. Спосіб за п. 13, який **відрізняється** тим, що R^8 означає трет-бутил.

16. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення далі забезпечують шляхом застосування хірального (сален)металевого комплексу й окисника.

17. Спосіб за п. 16, який **відрізняється** тим, що окисник являє собою йодобензолдіацетат.

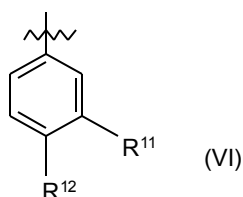
18. Спосіб за п. 16, який **відрізняється** тим, що хіральний (сален)металевий комплекс являє собою хлорид (S,S-(+)-N,N'-біс(3,5-ди-трет-бутилсаліцикліден)-1,2-циклогексадіаміномангану (III).

19. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення здійснюють із застосуванням хірального оксазиридину.

20. Спосіб за п. 19, який **відрізняється** тим, що хіральний оксазиридин являє собою (1R)-(-)-(8,8-дихлоро-10-камфор-сульфоніл)оксазиридин.

21. Спосіб за п. 19, який **відрізняється** тим, що хіральний оксазиридин являє собою (1S)-(+)-(8,8-дихлоро-10-камфор-сульфоніл)оксазиридин.

22. Спосіб за п. 3, який **відрізняється** тим, що R^3 має формулу (VI):



де:

R^{11} і R^{12} незалежно вибрано з групи, що включає алкіл, полієфір, фторид, хлорид, бромід, йодид, $NR^{19}R^{20}$, $NR^{20}C(O)R^{19}$ і OR^{19} , де:

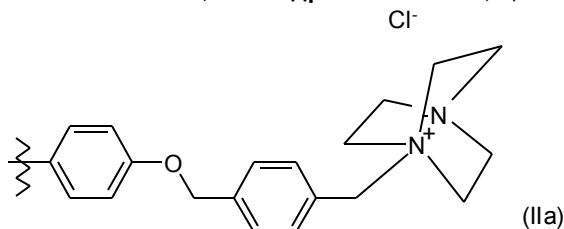
вищенаведені алкіл і полієфір може бути далі заміщено SO_3R^{15} , $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{17}\text{R}^{18}\text{A}^-$ і четвертинним гетероарилом; R^{19} належить до групи, що включає водень, алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, арил, арилалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, гетероарил, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, полієфір, алкіларилалкіл, алкілгетероарилалкіл, алкілгетероциклалкіл, гетероциклалкіл, гетероарилалкіл, четвертинний гетероциклалкіл, алкіламонійалкіл, карбоксіалкіламінокарбоніалкіл і четвертинний гетероарилалкіл; вищенаведена змінна R^{19} як алкіл, алкеніл, алкініл, арилалкіл, гетероцикл або поліалкіл може мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O , NR^{15} , $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{A}^-$, S , SO , SO_2 , $\text{S}^+\text{R}^{15}\text{A}^-$, PR^{15} , $\text{P}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{A}^-$, $\text{P}(\text{O})\text{R}^{15}$, феніленом, вуглеводом, амінокислотою, пептидом або поліпептидом; R^{19} може бути заміщено однією або кількома групами з гідрокси, аміно, сульфо, карбокси, сульфоалкілу, карбоксіалкілу, алкілу, гетероциклу, гетероарилу, четвертинного гетероциклалкілу, четвертинного гетероарилалкілу, гуанідинілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарилу, OR^{15} , $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$, $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{17}\text{R}^{18}\text{A}^-$, SR^{15} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , оксо, CO_2R^{15} , CN , галогену, $\text{CONR}^{15}\text{R}^{16}$, SO_2OM , $\text{SO}_2\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$, $\text{PO}(\text{OR}^{22})\text{OR}^{23}$, $\text{P}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{R}^{17}\text{A}^-$, $\text{S}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{A}^-$ і $\text{C}(\text{O})\text{OM}$,

де A^- означає застосовний у фармацевтиці аніон, а M^+ - застосовний у фармацевтиці катіон, R^{15} і R^{16} нарізно вибрано з групи, до якої належать H , алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амоніалкіл, арилалкіл, карбоксіалкіл, карбоксигетероарил, карбоксигетероцикл, карбоалкоксіалкіл, карбоалкіламіно, гетероарилалкіл, гетероциклалкіл і алкіламонійалкіл;

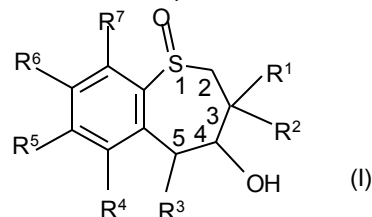
R^{17} і R^{18} нарізно вибрано з групи, що включає H , алкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, алкеніалкіл, алкінілалкіл, гетероцикл, карбоксіалкіл, карбоалкоксіалкіл, циклоалкіл, ціаноалкіл, OR^{15} , $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$, SR^{15} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , CO_3R^{15} , CN , галоген, оксо і $\text{CONR}^{15}\text{R}^{16}$, де R^{15} і R^{16} мають вищенаведені значення, або R^{17} і R^{18} разом із атомом азоту або вуглецю, з яким вони зв'язуються, утворюють циклічне кільце; і R^{22} і R^{23} нарізно вибрано із замісників R^{15} і M ; і R^{13} і R^{14} означають водень.

23. Спосіб за п. 22, який **відрізняється** тим, що R^3 означає 4-метоксифеніл.

24. Спосіб за п. 22, який **відрізняється** тим, що R^3 означає групу зі структурою формули (IIa):



25. Спосіб одержання енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду формули (I):



який **відрізняється** тим, що:

R^1 і R^2 нарізно вибрано з групи, до якої належать H , алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил і гетероарил;

R^3 належить до групи, що включає H , алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл, OR^{24} , SR^{15} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$, SO_2R^{15} і SO_3R^{15} ,

де алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл і четвертинний гетероарил може бути заміщено однією або кількома замісними групами, які нарізно вибрано з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, арилалкіл, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, галоген, оксо, OR^{19} , $\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$, SR^{19} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{19}$, SO_2R^{19} , SO_3R^{19} , $\text{NR}^{19}\text{OR}^{20}$, $\text{NR}^{19}\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$, NO_2 , CO_2R^{19} , CN , OM , SO_2OM , $\text{SO}_2\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$, $\text{C}(\text{O})\text{NR}^{19}\text{R}^{20}$, $\text{C}(\text{O})\text{OM}$, COR^{19} , $\text{P}(\text{O})\text{R}^{19}\text{R}^{20}$, $\text{P}^+\text{R}^{19}\text{R}^{20}\text{R}^{21}\text{A}^-$, $\text{P}(\text{OR}^{19})\text{OR}^{20}$, $\text{S}^+\text{R}^{19}\text{R}^{20}\text{A}^-$ і $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{17}\text{R}^{18}\text{A}^-$;

де:

A^- означає застосовний у фармацевтиці аніон, а M^+ - застосовний у фармацевтиці катіон;

вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл може бути далі заміщено однією або кількома замісними групами з OR^{13} , $\text{NR}^{13}\text{R}^{14}$, SR^{13} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{13}$, SO_2R^{13} , SO_3R^{13} , CO_2R^{13} , CN , оксо, $\text{CONR}^{13}\text{R}^{14}$, $\text{N}^+\text{R}^{13}\text{R}^{14}\text{R}^{15}\text{A}^-$, алкілу, алкенілу, алкінілу, арилу, циклоалкілу, гетероциклу, арилалкілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарилу, $\text{P}(\text{O})\text{R}^{13}\text{R}^{14}$, $\text{P}^+\text{R}^{13}\text{R}^{14}\text{R}^{15}\text{A}^-$ і $\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{13})\text{OR}^{14}$, і

де вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл можуть мати один або кілька атомів

вуглецю, заміщених O , NR^{13} , $\text{N}^+\text{R}^{13}\text{R}^{14}\text{A}^-$, S , SO , SO_2 , $\text{S}^+\text{R}^{13}\text{A}^-$, PR^{13} , $\text{P}(\text{O})\text{R}^{13}$, $\text{P}^+\text{R}^{13}\text{R}^{14}\text{A}^-$ або феніленом;

R^{19} , R^{20} і R^{21} нарізно вибрано з групи, що включає водень, алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, арил, арилалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, гетероарил, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, полієфір, алкіларилалкіл, алкілгетероарилалкіл, алкілгетероциклалкіл, гетероциклалкіл, гетероарилалкіл, четвертинний гетероциклалкіл, алкіламонійалкіл, карбоксіалкіламінокарбоніалкіл і четвертинний гетероарилалкіл,

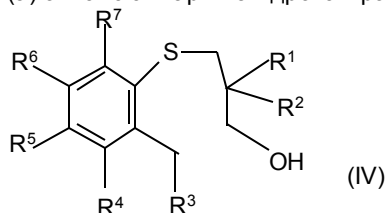
де алкіл, алкеніл, алкініл, арилалкіл, гетероцикл і поліалкіл можуть мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O , NR^{15} , $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{A}^-$, S , SO , SO_2 , $\text{S}^+\text{R}^{15}\text{A}^-$, PR^{15} , $\text{P}^+\text{R}^{15}\text{R}^{16}\text{A}^-$, $\text{P}(\text{O})\text{R}^{15}$, феніленом, вуглеводом, амінокислотою, пептидом або поліпептидом, і

R^{19} , R^{20} , і R^{21} може бути заміщено однією або кількома групами з гідрокси, аміно, сульфо, карбокси, сульфоалкілу, карбоксіалкілу, алкілу,

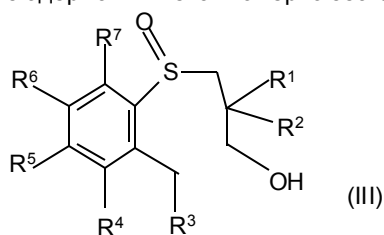
гетероциклу, гетероарилу, четвертинного гетероциклалкілу, четвертинного гетероарилалкілу, гуанідинілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарилу, OR^{15} , $\text{NR}^{15}\text{R}^{16}$, $\text{N}^+\text{R}^{15}\text{R}^{17}\text{R}^{18}\text{A}^-$, SR^{15} , $\text{S}(\text{O})\text{R}^{15}$, SO_2R^{15} ,

SO₃R¹⁵, оксо, CO₂R¹⁵, CN, галогену, CONR¹⁵R¹⁶, SO₂OM, SO₂NR¹⁵R¹⁶, PO(OR²²)OR²³, P⁺R¹⁵R¹⁶R¹⁷A⁻, S⁺R¹⁵R¹⁶A⁻ і C(O)OM, де R²² і R²³ нарізно вибрано із замісників R¹⁵ і M, або R²⁰ і R²¹ разом із атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють циклічне кільце; R²⁴ належить до групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, алкіламонійалкіл і арилалкіл; R¹³ і R¹⁴ нарізно вибрано з групи, що включає водень і алкіл; R¹⁵ і R¹⁶ нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, арилалкіл, карбоксіалкіл, карбоксигетероарил, карбоксигетероцикл, карбоалкоксіалкіл, карбоалкіламіно, гетероарилалкіл, гетероциклалкіл і алкіламонійалкіл, і R¹⁷ і R¹⁸ нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, алкенілакіл, алкінілакіл, гетероцикл, карбоксіалкіл, карбоалкоксіалкіл, циклоалкіл, ціаноалкіл, OR¹⁵, NR¹⁵R¹⁶, SR¹⁵, S(O)R¹⁵, SO₂R¹⁵, SO₃R¹⁵, CO₃R¹⁵, CN, галоген, оксо і CONR¹⁵R¹⁶, де R¹⁵ і R¹⁶ мають вищенаведені значення, або R¹⁷ і R¹⁸ разом із атомом азоту або вуглецю, з яким вони зв'язані, утворюють циклічне кільце; і R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гало, алкокси, арилокси, -NO₂ і -NR⁹R¹⁰, R⁹ і R¹⁰ нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, бутоксикарбоніл і карбобензилокси; змінна R³ і гідроксильна група в 4-положенні енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду знаходяться у син-конформаційному стані по відношенню одна до одної; алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, алкокси й арилокси може бути заміщено однією або кількома частками алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу, алкокси, арилокси, -NO₂ і гало; і сірка у 1-положенні й атоми вуглецю у 4- і 5-положеннях семичленного кільця являють собою хіральні центри; а також тим, що:

(а) окиснюють арил-3-гідроксипропілсульфід формули (IV):

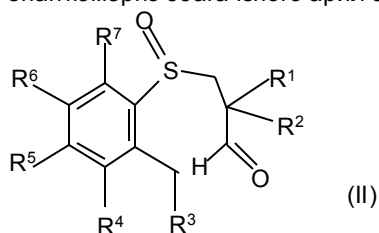


де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вищенаведені значення й окиснення здійснюють за умов енантіоселективності з одержанням енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду формули (III):



де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вищенаведені значення і сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр;

(б) окиснюють 3-гідроксильну групу енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду з одержанням енантімерно збагаченого арил-3-пропаналсульфоксиду формули (II):



де R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ і R⁷ мають вищенаведені значення, а сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр; і

(в) циклізують енантімерно збагачений арил-3-пропаналсульфоксид з одержанням енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду формули (I).

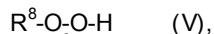
26. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення забезпечують шляхом застосування хірального оксазиридину.

27. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що хіральний оксазиридин являє собою (1R)-(-)-(8,8-дихлоро-10-камфор-сульфоніл)оксазиридин.

28. Спосіб за п. 26, який **відрізняється** тим, що хіральний оксазиридин являє собою (1S)-(+)-(8,8-дихлоро-10-камфор-сульфоніл)оксазиридин.

29. Спосіб за п. 26, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення здійснюють із застосуванням алкогляту титану (IV) і діалкілтартрату.

30. Спосіб за п. 28, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення далі забезпечують шляхом застосування сполуки гідропероксиду формули (V):



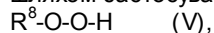
де R^8 означає частку H, алкілу, карбоалкілу, бензилу, бензоїлу і кумілу.

31. Спосіб за п. 30, який **відрізняється** тим, що R^8 означає куміл.

32. Спосіб за п. 30, який **відрізняється** тим, що R^8 означає трет-бутил.

33. Спосіб за п. 29, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення стадії (а) здійснюють із застосуванням ізопропоксиду титану (IV) і діетил-D-тартрату.

34. Спосіб за п. 33, який **відрізняється** тим, що умови енантіоселективності під час окиснення далі забезпечують шляхом застосування сполуки гідропероксиду формули (V):



де R^8 означає частку H, алкілу, карбоалкілу, бензилу, бензоїлу або кумілу.

35. Спосіб за п. 34, який **відрізняється** тим, що R^8 означає куміл.

36. Спосіб за п. 34, який **відрізняється** тим, що R^8 означає трет-бутил.

37. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що утворення умов енантіоселективності під час окиснення на стадії (а) здійснюють із застосуванням хірального (сален)металевого комплексу й окисника.

38. Спосіб за п. 37, який **відрізняється** тим, що окисник являє собою йодобензолдіацетат.

39. Спосіб за п. 38, який **відрізняється** тим, що хіральний (сален)металевий комплекс являє собою хлорид (S,S)-(+)-N,N'-біс(3,5-ди-трет-бутилсаліцикліден)-1,2-циклогександіаміномангану (III).

40. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що окиснення енантіомерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду на стадії (б) здійснюють в присутності піридинового комплексу триоксиду сірки.

41. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що окиснення енантіомерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду на стадії (б) здійснюють в присутності комплексу піридин-хром.

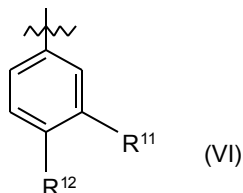
42. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що циклізацію на стадії (в) здійснюють в присутності основи.

43. Спосіб за п. 42, який **відрізняється** тим, що основа являє собою трет-бутоксид калію.

44. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що R^1 і R^2 означають частки, нарізно вибрані з групи, що включає етил і n-бутил.

45. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що як R^1 , так і R^2 означають n-бутил.

46. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що R^3 має формулу (VI) :



де:

R^{11} і R^{12} нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкокси, $-NO_2$, $-NR^9R^{10}$ і $-OR^{10}$; і

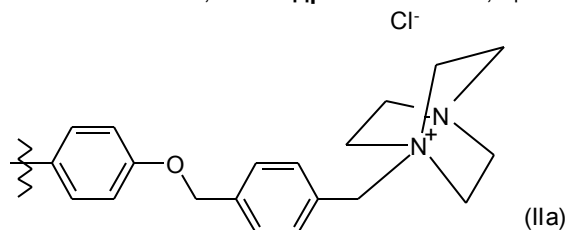
R^9 і R^{10} нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, бутоксикарбоніл і карбобензилокси, де арил і гетероарил може бути заміщено однією або кількома частками алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу, алкокси, арилокси і гало.

47. Спосіб за п. 46, який **відрізняється** тим, що R^1 і R^2 означають частки, нарізно вибрані з групи, що включає етил і n-бутил.

48. Спосіб за п. 46, який **відрізняється** тим, що як R^1 , так і R^2 означають n-бутил.

49. Спосіб за п. 48, який **відрізняється** тим, що R^{11} означає H, а R^{12} - метокси.

50. Спосіб за п. 48, який **відрізняється** тим, що R^3 означає групу зі структурою формули (IIa):



51. Спосіб за п. 25, який **відрізняється** тим, що R^4 , R^5 , R^6 і R^7 означають частки, нарізно вибрані з групи, що включає H, $-NO_2$ і $-NR^9R^{10}$.

52. Спосіб за п. 51, який **відрізняється** тим, що кожна зі змінних R^4 , R^6 і R^7 означає H і R^5 означає частку $-NO_2$ або $-NR^9R^{10}$.

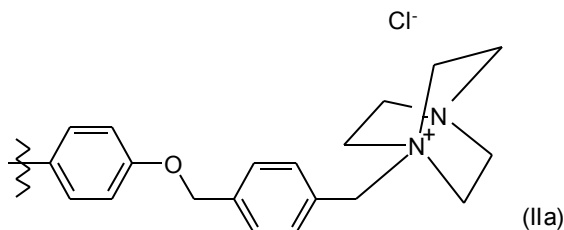
53. Спосіб за п. 46, який **відрізняється** тим, що R^4 , R^5 , R^6 і R^7 означають частки, нарізно вибрані з групи, що включає H, $-NO_2$ і $-NR^9R^{10}$.

54. Спосіб за п. 53, який **відрізняється** тим, що кожна зі змінних R^4 , R^6 і R^7 означає H і R^5 означає частку $-NO_2$ або $-NR^9R^{10}$.

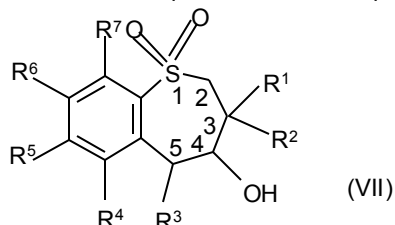
55. Спосіб за п. 53, який **відрізняється** тим, що R^5 означає диметиламіно.

56. Спосіб за п. 55, який **відрізняється** тим, що R^{11} означає H, а R^{12} - метокси.

57. Спосіб за п. 55, який **відрізняється** тим, що R^3 означає групу зі структурою формули (IIa):



58. Спосіб одержання енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1,1-діоксиду формули (VII):



який відрізняється тим, що:

R^1 і R^2 нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил і гетероарил;
 R^3 належить до групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл, OR^{24} , SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} і SO_3R^{15} , де алкіл, алкеніл, алкініл, арил, циклоалкіл, гетероцикл, четвертинний гетероцикл і четвертинний гетероарил може бути заміщено однією або кількома замісними групами, які нарізно вибрано з групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, арилалкіл, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, галоген, оксо, OR^{19} , $NR^{19,20}$, SR^{19} , $S(O)R^{19}$, SO_2R^{19} , SO_3R^{19} , $NR^{19}OR^{20}$, $NR^{19}NR^{20}R^{21}$, NO_2 , CO_2R^{19} , CN, OM, SO_2OM , $SO_2NR^{19,20}$, $C(O)NR^{19,20}$, $C(O)OM$, COR^{19} , $P(O)R^{19,20}$, $P^+R^{19,20}R^{21}A^-$, $P(OR^{19})OR^{20}$, $S^+R^{19}R^{20}A^-$ і $N^+R^{15}R^{18}A^-$;

де:

A^- означає застосовний у фармацевтиці аніон, а M^+ - застосовний у фармацевтиці катіон;
 вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл може бути далі заміщено однією або кількома замісними групами з OR^{13} , $NR^{13,14}$, SR^{13} , $S(O)R^{13}$, SO_2R^{13} , SO_3R^{13} , CO_2R^{13} , CN, оксо, $CONR^{13,14}$, $N^+R^{13}R^{14}A^-$, алкілу, алкенілу, алкінілу, арилу, циклоалкілу, гетероциклу, арилалкілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарилу, $P(O)R^{13,14}$, $P^+R^{13}R^{14}R^{15}A^-$ і $P(O)(OR^{13})OR^{14}$, і де вищенаведені алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, полієфір, арил, галоалкіл, циклоалкіл і гетероцикл можуть мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O, NR^{13} , $N^+R^{13}R^{14}A^-$, S, SO, SO_2 , $S^+R^{13}A^-$, PR^{13} , $P(O)R^{13}$, $P^+R^{13}R^{14}A^-$ або фенолом;

R^{19} , R^{20} і R^{21} нарізно вибрано з групи, що включає водень, алкіл, алкеніл, алкініл, поліалкіл, арил, арилалкіл, циклоалкіл, гетероцикл, гетероарил, четвертинний гетероцикл, четвертинний гетероарил, полієфір, алкіларилалкіл, алкілгетероарилалкіл, алкілгетероциклалкіл, гетероциклалкіл, гетероарилалкіл, четвертинний гетероциклалкіл, алкіламонійалкіл, карбоксилалкіламінокарбоніалкіл і четвертинний гетероарилалкіл, де алкіл, алкеніл, алкініл, арилалкіл, гетероцикл і поліалкіл можуть мати один або кілька атомів вуглецю, заміщених O, NR^{15} , $N^+R^{15}R^{16}A^-$, S, SO, SO_2 , $S^+R^{15}A^-$, PR^{15} , $P^+R^{15}R^{16}A^-$, $P(O)R^{15}$, фенолом, вуглеводом, амінокислотою, пептидом або поліпептидом, і

R^{19} , R^{20} і R^{21} може бути заміщено однією або кількома групами з гідрокси, аміно, сульфо, карбокси, сульфоалкілу, карбоксилалкілу, алкілу, гетероциклу, гетероарилу, четвертинного гетероциклалкілу, четвертинного гетероарилалкілу, гуанідинілу, четвертинного гетероциклу, четвертинного гетероарилу, OR^{15} , $NR^{15}R^{16}$, $N^+R^{15}R^{16}A^-$, SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , оксо, CO_2R^{15} , CN, галогену, $CONR^{15}R^{16}$, SO_2OM , $SO_2NR^{15}R^{16}$, $PO(OR^{22})OR^{23}$, $P^+R^{15}R^{16}R^{17}A^-$, $S^+R^{15}R^{16}A^-$ і $C(O)OM$,

де R^{22} і R^{23} нарізно вибрано з замісників R^{15} і M, або

R^{20} і R^{21} разом із атомом азоту, з яким вони зв'язані, утворюють циклічне кільце;

R^{24} належить до групи, що включає алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, алкіламонійалкіл і арилалкіл;

R^{13} і R^{14} нарізно вибрано з групи, що включає водень і алкіл;

R^{15} і R^{16} нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, ацил, гетероцикл, амонійалкіл, арилалкіл, карбоксилалкіл, карбоксигетероарил, карбоксигетероцикл, карбоалкоксилалкіл, карбоалкіламіно, гетероарилалкіл, гетероциклалкіл і алкіламонійалкіл, і

R^{17} і R^{18} нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, арил, арилалкіл, алкеніалкіл, алкінілалкіл, гетероцикл, карбоксилалкіл, карбоалкоксилалкіл, циклоалкіл, ціаноалкіл, OR^{15} , $NR^{15}R^{16}$, SR^{15} , $S(O)R^{15}$, SO_2R^{15} , SO_3R^{15} , CO_3R^{15} , CN, галоген, оксо і $CONR^{15}R^{16}$, де R^{15} і R^{16} мають вищенаведені значення, або R^{17} і R^{18} разом із атомом азоту або вуглецю, з яким вони зв'язані, утворюють циклічне кільце;

R^4 , R^5 , R^6 і R^7 нарізно вибрано з групи, до якої належать H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, гало, алкокси, арилокси, $-NO_2$ і $-NR^9R^{10}$;

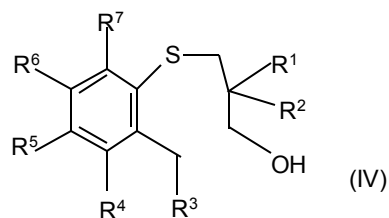
R^9 і R^{10} нарізно вибрано з групи, що включає H, алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, бутоксикарбоніл і карбобензилокси;

змінна R^3 і гідроксильна група в 4-положенні енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду знаходяться у син-конформаційному стані по відношенню одна до одної;

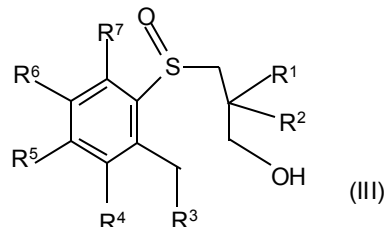
алкіл, алкеніл, алкініл, циклоалкіл, арил, гетероарил, алкокси й арилокси може бути заміщено однією або кількома частками алкілу, алкенілу, алкінілу, циклоалкілу, арилу, гетероарилу, алкокси, арилокси, $-NO_2$ і гало; і атоми вуглецю в 4- і 5-положеннях семичленного кільця являють собою хіральні центри;

а також тим, що:

(а) окиснюють арил-3-гідроксипропілсульфід формули (IV):

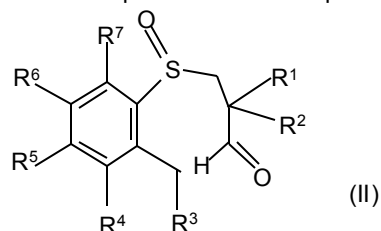


де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають вищенаведені значення й окиснення здійснюють в умовах енантіоселективності з одержанням енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду формули (III):



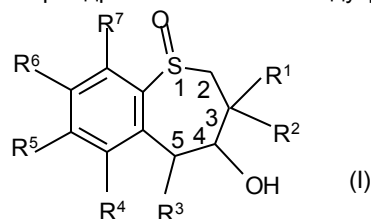
де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають вищенаведені значення, а сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр;

(б) окиснюють 3-гідроксильну групу енантімерно збагаченого арил-3-гідроксипропілсульфоксиду з одержанням енантімерно збагаченого арил-3-пропаналсульфоксиду формули (II):



де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають вищенаведені значення, а сірка являє собою енантімерно збагачений хіральний центр;

(в) циклізують енантімерно збагачений арил-3-пропаналсульфоксид з одержанням енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду формули (I):



де $R^1, R^2, R^3, R^4, R^5, R^6$ і R^7 мають вищенаведені значення і змінна R^3 та гідроксильна група в 4-положенні енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1-оксиду знаходяться у син-конформаційному стані по відношенню одна до одної, а сірка в 1-положенні й атоми вуглецю в 4- і 5-положеннях семичленного кільця являють собою енантімерно збагачені хіральні центри; та

(г) окиснюють енантімерно збагачений тетрагідробензотієпін-1-оксид до енантімерно збагаченого тетрагідробензотієпін-1,1-діоксиду формули (VII).

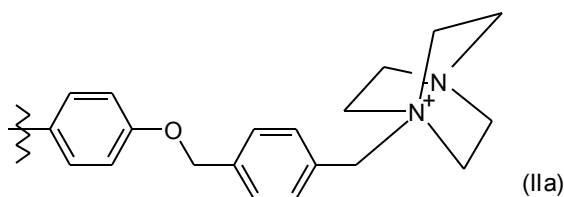
59. Спосіб за п. 58, який **відрізняється** тим, що окиснення стадії (г) здійснюють в присутності пероксикарбоксильної кислоти.

60. Спосіб за п. 59, який **відрізняється** тим, що пероксикарбоксильна кислота являє собою m-хлоропероксибензойну кислоту.

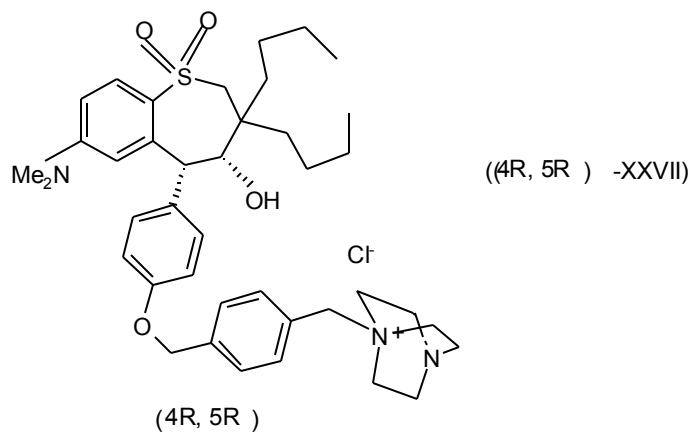
61. Спосіб за п. 58, який **відрізняється** тим, що R^{11} означає H і R^{12} - метокси.

62. Спосіб за п. 58, який **відрізняється** тим, що R^3 означає групу зі структурою формули (IIa):

Cl^-



63. Сполука, яка **відрізняється** тим, що має формулу:



64. Сполука, яка **відрізняється** тим, що має формулу:

