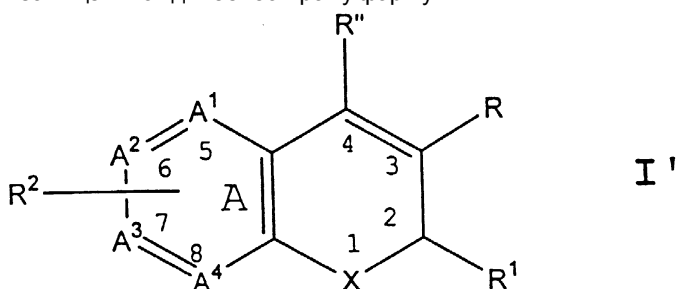


1. Заміщені похідні бензопірану формули I'



де Х вибраний із групи, що складається з О, S, CR^cR^b і NR^a;

R^a вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₃-алкіл, феніл-C₁-C₃-алкіл, (заміщений феніл)-C₁-C₃-алкіл, де фенільна група несе від 1 до 3 замісників, вибраних із групи, що включає C₁-C₆-алкіл, гідроксил, галоїд, галоїдний алкіл, нітрогрупу, ціан, алкоксигрупу і C₁-C₆-алкіламіногрупу, ацил і карбокси-C₁-C₆-алкіл;

кожний із R^b і R^c незалежно вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₃-алкіл, феніл-C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-перфторалкіл, хлор, C₁-C₆-алкілтіо-, C₁-C₆-алкокси-, нітрогрупу, ціан і ціан-C₁-C₃-алкіл;

R вибраний із групи, що включає карбоксил, амінокарбоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніламінокарбоніл і C₁-C₆-алкоксикарбоніл;

R'' вибраний із групи, що включає водень, феніл, тіснел і C₂-C₆-алкеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає C₁-C₃-перфторалкіл, хлор, C₁-C₆-алкілтіо-, C₁-C₆-алкокси-, нітрогрупу, ціан і ціан-C₁-C₃-алкіл;

R² - один або декілька радикалів, вибраних незалежно один від одного з групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, галоїд-C₂-C₆-алкініл, арил-C₁-C₃-алкіл, арил-C₂-C₆-алкініл, арил-C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкокси-, метилендіокси-, C₁-C₆-алкілтіогрупу, C₁-C₆-алкілсульфініл, арилокси-, арилтіогрупу, арилсульфініл, гетероарилоксигрупу, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, арил-C₁-C₆-алкілокси-, гетероарил-C₁-C₆-алкілоксигрупу, арил-C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалкокси-, C₁-C₆-галоїдалкілтіогрупу, C₁-C₆-галоїдалкілсульфініл, C₁-C₆-галоїдалкілсульфоніл, C₁-C₃-галоїдалкіл-C₁-C₃-гідроксіалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, гідроксііміно-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкіламіно-, ариламино-, арил-C₁-C₆-алкіламіно-, гетероариламіно-, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносульфоніл, C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, ариламиносульфоніл, гетероариламіносульфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероциклілсульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, арил-C₁-C₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, арилкарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, форміл, C₁-C₆-галоїдалкілкарбоніл і C₁-C₆-алкілкарбоніл;

атоми циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - незалежно один від одного вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше двох з атомів А¹, А², А³ і А⁴ є атомами вуглецю;

або R² разом із циклом А утворює радикал, вибраний із групи, що включає нафтил, хіноліл, ізохіноліл, хінолізініл, хіноксалініл і дибензофурил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

2. Заміщені похідні бензопірану за п. 1, де Х вибраний із групи, що складається з О, S, CR^cR^b і NR^a, де

R^a вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₃-алкіл, феніл-C₁-C₃-алкіл, (заміщений феніл)-C₁-C₃-алкіл, де фенільна група несе від 1 до 3 замісників, вибраних із групи, що включає C₁-C₆-алкіл, гідроксил, галоїд, галоїдний алкіл, нітрогрупу, ціан, алкоксигрупу і C₁-C₆-алкіламіногрупу, ацил і карбокси-C₁-C₆-алкіл;

кожний із R^b і R^c незалежно вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₃-алкіл, феніл-C₁-C₃-алкіл, C₁-C₃-перфторалкіл, хлор, C₁-C₆-алкілтіо-, C₁-C₆-алкокси-, нітрогрупу, ціан і ціан-C₁-C₃-алкіл;

R вибраний із групи, що включає карбоксил, амінокарбоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніламінокарбоніл і C₁-C₆-алкоксикарбоніл;

R'' вибраний із групи, що включає водень, феніл, тіснел і C₂-C₆-алкеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає C₁-C₃-перфторалкіл, хлор, C₁-C₆-алкілтіо-, C₁-C₆-алкокси-, нітрогрупу, ціан і ціан-C₁-C₃-алкіл;

R² - один або декілька радикалів, вибраних незалежно один від одного з групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₂-C₆-алкеніл, C₂-C₆-алкініл, галоїд-C₂-C₆-алкініл, арил-C₁-C₃-алкіл, арил-C₂-C₆-алкініл, арил-C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкокси-, метилендіокси-, C₁-C₆-алкілтіогрупу, C₁-C₆-алкілсульфініл, арилокси-, арилтіогрупу, арилсульфініл, гетероарилоксигрупу, C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, арил-C₁-C₆-алкілокси-, гетероарил-C₁-C₆-алкілоксигрупу, арил-C₁-C₆-алкокси-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалкокси-, C₁-C₆-галоїдалкілтіогрупу, C₁-C₆-галоїдалкілсульфініл, C₁-C₆-галоїдалкілсульфоніл, C₁-C₃-галоїдалкіл-C₁-C₃-гідроксіалкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, гідроксііміно-C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкіламіно-, ариламино-, арил-C₁-C₆-алкіламіно-, гетероариламіно-, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносульфоніл, C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, ариламиносульфоніл, гетероариламіносульфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероциклілсульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, арил-C₁-C₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, арилкарбоніл, амінокарбоніл, C₁-C₆-алкоксикарбоніл, форміл, C₁-C₆-галоїдалкілкарбоніл і C₁-C₆-алкілкарбоніл;

атоми циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів А¹, А², А³ і А⁴ є атомами вуглецю;
 або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил або хіноліл,
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

3. Заміщені похідні бензопірану за п. 2, де Х вибраний із групи, що складається з О, S і NR^a, де
 R^a вибраний із групи, що включає водень, С₁-С₃-алкіл, фенілметил і (необов'язково заміщений феніл)метил, де фенільна група несе від 1 до 3 замісників, вибраних із групи, що включає С₁-С₆-алкіл, гідроксил, галоїд, галоїдний алкіл, нітрогрупу, ціан, алкокси- і С₁-С₆-алкіламіногрупу;
 R - карбоксил;
 R" вибраний із групи, що включає водень і С₂-С₆-алкеніл;
 R¹ - вибраний із групи, що включає С₁-С₃-перфторалкілі;
 R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, галоїд, С₁-С₆-алкіл, С₂-С₆-алкеніл, С₂-С₆-алкініл, галоїд-С₂-С₆-алкініл, феніл-С₁-С₆-алкіл, феніл-С₂-С₆-алкініл, феніл-С₂-С₆-алкеніл, С₁-С₃-алкокси-, метилендіоксигрупу, С₁-С₃-алкокси-С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-алкілтіогрупу, С₁-С₃-алкілсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, С₁-С₃-галоїдалкіл-С₁-С₃-гідроксіалкіл, феніл-С₁-С₃-алкілокси-С₁-С₃-алкіл, С₁-С₃-галоїдний алкіл, С₁-С₃-галоїдалкокси-, С₁-С₃-галоїдалкілтіогрупу, С₁-С₃-гідроксіалкіл, гідроксіміно-С₁-С₃-алкіл, С₁-С₆-алкіламіно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносальфоніл, N-алкіламіносальфоніл, N-ариламіносальфоніл, N-гетероариламіносальфоніл, N-(феніл-С₁-С₆-алкіл)аміносальфоніл, N-(гетероарил-С₁-С₆-алкіл)аміносальфоніл, феніл-С₁-С₃-алкілсульфоніл, гетероциклілсульфоніл із кількістю членів від 5 до 8, С₁-С₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений гетероарил із кількістю членів від 5 до 9, феніл-С₁-С₆-алкілкарбоніл, фенілкарбоніл, 4-хлорфенілкарбоніл, 4-гідроксифенілкарбоніл, 4-трифторметилфенілкарбоніл, 4-метоксифенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і С₁-С₆-алкілкарбоніл;

атоми циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів А¹, А², А³ і А⁴ є атомами вуглецю;
 або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил, бензофурилфеніл або хіноліл;
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

4. Заміщені похідні бензопірану за п. 3, де Х вибраний із групи, що складається з О, S і NR^a, де
 R^a вибраний із групи, що включає водень, метил, етил, (4-трифторметил)бензил, (4-хлорметил)бензил, (4-метокси)бензил, (4-ціан)бензил і (4-нітро)бензил;
 R - карбоксил;
 R" вибраний із групи, що включає водень і етеніл;
 R¹ вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;
 R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, хлор, бром, фтор, йод, метил, трет-бутил, етеніл, етиніл, 5-хлор-1-пентиніл, 1-пентиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, бензил, фенілетил, фенілетиніл, 4-хлорфенілетиніл, 4-метоксифенілетиніл, фенілетеніл, метокси-, метилтіогрупу, метилсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, метилендіоксигрупу, бензилоксиметил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметокси-, трифторметилтіогрупу, гідроксиметил, гідрокситрифторетил, метоксиметил, гідроксімінометил, N-метиламіно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносальфоніл, N-метиламіносальфоніл, N-феніламіносальфоніл, N-фуриламіносальфоніл, N-(бензил)аміносальфоніл, N-(фурилметил)аміносальфоніл, бензилсульфоніл, фенілетиламіносальфоніл, фурилсульфоніл, метилсульфоніл, феніл, феніл, заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає хлор, фтор, бром, метокси-, метилтіогрупу і метилсульфоніл, бензimidазоліл, тієніл, хлорзаміщений тієніл, фурил, хлорзаміщений фурил, бензилкарбоніл, необов'язково заміщений фенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і метилкарбоніл;

атоми циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - незалежно один від одного вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів А¹, А², А³ і А⁴ є атомами вуглецю;
 або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил або хіноліл;
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

5. Сполука за п. 4, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:

- (1) 6-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (2) 7-етил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (3) 7-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (4) 2,7-біс(трифторметил)-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (5) 7-бром-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (6) 6-хлор-7-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (7) 8-(1-метилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (8) 6-хлор-7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (9) 6-хлор-8-(1-метилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (10) 2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (11) 8-етокси-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (12) 7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (13) 6-бром-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (14) 8-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (15) 8-бром-6-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;

- [illegible]

- [illegible]

(144) 6-хлор-7-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
 (145) 7-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
 (146) 6,7-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
 (147) 2-трифторметил-6-[(трифторметил)тіо]-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
 (148) 6,8-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
 (149) 6-хлор-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (150) 6,8-дихлор-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (151) 6,7-дифтор-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (152) 6-йод-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (153) 6-бром-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (154) 1,2-дигідро-6-трифторметокси-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (155) 6-трифторметил-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (156) 6-ціан-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (157) 6-хлор-1,2-дигідро-1-метил-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (158) 6-хлор-1,2-дигідро-2-трифторметил-1-[[4-(трифторметил)феніл]метил]-3-хінолінкарбонова кислота;
 (159) 6-хлор-1-[(4-хлорфеніл)метил]-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (160) 6-хлор-1,2-дигідро-2-трифторметил-1-[[4-(метокси)феніл]метил]-3-хінолінкарбонова кислота;
 (161) 6-хлор-1-[(4-ціанфеніл)метил]-1,2-дигідро-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (162) 6-хлор-1,2-дигідро-1-[(4-нітрофеніл)метил]-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (163) 6-хлор-1,2-дигідро-1-етил-2-трифторметил-3-хінолінкарбонова кислота;
 (164) 6-хлор-2-трифторметил-1,2-дигідро[1,8]нафтиридин-3-карбонова кислота;
 (165) 2-трифторметил-2Н-нафто[1,2-b]піран-3-карбонова кислота;
 (166) 2-трифторметил-3Н-нафто[1,2-b]піран-3-карбонова кислота;
 (167) 2-трифторметил-2Н-нафто[2,3-b]піран-3-карбонова кислота;
 (168) 5-гідроксиметил-8-метил-2-трифторметил-2Н-пірано[2,3-с]піридин-3-карбонова кислота;
 (169) 6-трифторметил-6Н-1,3-діоксо[4,5-г][1]бензопіран-7-карбонова кислота; і
 (170) 3-трифторметил-3Н-бензофу[3,2-г][1]бензопіран-2-карбонова кислота.

6. Заміщені похідні бензопірану за п. 2, де Х - О;

R - карбоксил;

Rⁿ вибраний із групи, що включає водень і С₂-С₆-алкеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає С₁-С₃-перфторалкілі;

R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, галоїд, С₁-С₆-алкіл, феніл-С₁-С₆-алкіл, феніл-С₂-С₆-алкініл, феніл-С₂-С₆-алкеніл, С₁-С₆-алкокси-, фенілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероариллоксигрупу, феніл-С₁-С₆-алкілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероарил-С₁-С₆-алкілоксигрупу, С₁-С₆-галоїдний алкіл, С₁-С₆-галоїдалкокси-, N-(С₁-С₆-алкіл)аміно-, N,N-ді-(С₁-С₆-алкіл)аміно-, N-феніламіно-, N-(феніл-С₁-С₆-алкіл)аміно-, N-гетероариламіно-, N-(гетероарил-С₁-С₆-алкіл)аміно-, нітро-, аміногрупу, аміносульфоніл, N-(С₁-С₆-алкіл)аміносульфоніл, N,N-ді-(С₁-С₆-алкіл)аміносульфоніл, N-ариламіносульфоніл, N-гетероариламіносульфоніл, N-(феніл-С₁-С₆-алкіл)аміносульфоніл, N-(гетероарил-С₁-С₆-алкіл)аміносульфоніл, гетероциклісультфоніл із кількістю членів від 5 до 8, С₁-С₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений 5- або 6-членний гетероарил, феніл-С₁-С₆-алкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл і С₁-С₆-алкілкарбоніл;

атоми циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - незалежно один від одного вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів А¹, А², А³ і А⁴ є атомами вуглецю;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

7. Заміщені похідні бензопірану за п. 6, де Х - О;

R - карбоксил;

Rⁿ вибраний із групи, що включає водень і етеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;

R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, хлор, бром, фтор, йод, метил, трет-бутил, етеніл, етиніл, 5-хлор-1-пентиніл, 1-пентиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, бензил, фенілетил, фенілетиніл, 4-хлорфенілетиніл, 4-метоксифенілетиніл, фенілетеніл, метокси-, метилтіогрупу, метилсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, піридилокси-, тієнілокси-, фурилокси-, фенілметокси-, метилєндіоксигрупу, бензиллоксиметил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметокси-, трифторметилтіогрупу, гідроксиметил, гідрокситрифторетил, метоксиметил, гідроксіімінометил, N-метиламіно-, N-феніламіно-, N-(бензил)аміно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносульфоніл, N-метиламіносульфоніл, N-феніламіносульфоніл, N-фуриламіносульфоніл, N-(бензил)аміносульфоніл, N-(фурилметил)аміносульфоніл, бензилсульфоніл, фенілетиламіносульфоніл, фурилсульфоніл, метилсульфоніл, феніл, феніл, заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає хлор, фтор, бром, метокси-, метилтіогрупу і метилсульфоніл, бензімідазоліл, тієніл, хлорзаміщений тієніл, фурил, хлорзаміщений фурил, бензилкарбоніл, фурилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і метилкарбоніл;

один з атомів циклу А - А¹, А², А³ і А⁴ - є атом азоту, а інші три - атоми вуглецю;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

8. Заміщені похідні бензопірану за п. 7, де Х - О;

R - карбоксил;

R" вибраний із групи, що включає водень і етеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;

R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, хлор, бром, фтор, йод, метил, трет-бутил, етеніл, етиніл, 5-хлор-1-пентиніл, 1-пентиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, бензил, фенілетил, фенілетиніл, 4-хлорфенілетиніл, 4-метоксифенілетиніл, фенілетеніл, метокси-, метилтіогрупу, метилсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, піридилокси-, тієнілокси-, фурилокси-, фенілметокси-, метилєндіоксигрупу, бензилоксиметил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметокси-, трифторметилтіогрупу, гідроксिमетил, гідрокситрифторетил, метоксिमетил, гідроксіімінетил, N-метиламіно-, N-феніламіно-, N-(бензил)аміно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносальфоніл, N-метиламіносальфоніл, N-феніламіносальфоніл, N-фуриламіносальфоніл, N-(бензил)аміносальфоніл, N-(фурилметил)аміносальфоніл, бензилсульфоніл, фенілетиламіносальфоніл, фурилсульфоніл, метилсульфоніл, феніл, феніл, заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає хлор, фтор, бром, метокси-, метилтіогрупу і метилсульфоніл, бензімідазоліл, тієніл, хлорзаміщений тієніл, фурил, хлорзаміщений фурил, бензилкарбоніл, фурилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і метилкарбоніл; атоми циклу A - A¹, A², A³ і A⁴ - є атомами вуглецю;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

9. Сполука за п. 8, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:

- (1) 6-хлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (2) (S)-6-хлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (3) 6-хлор-7-метил-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (4) 6-хлор-7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (5) (S)-6-хлор-7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (6) 6-хлор-8-(1-метилетил)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (7) 7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (8) 6-трифторметокси-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (9) (S)-6-трифторметокси-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (10) 6,7-дихлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (11) 6,8-дихлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (12) (S)-6,8-дихлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (13) 6,8-дихлор-7-метокси-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (14) 6-хлор-2-трифторметил-2H-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (15) (S)-6-хлор-2-трифторметил-2H-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (16) 6-ціан-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (17) (S)-6-ціан-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (18) 6-гідроксиметил-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (19) 6-дифторметил-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (20) 2,6-біс(трифторметил)-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (21) 5,6,7-трихлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (22) 6,7,8-трихлор-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (23) 6-метилтіо-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (24) 6-пентафторетил-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (25) 2-трифторметил-6-трифторметилтіо-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (26) 6,8-дихлор-7-метил-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (27) 6-бензоїл-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (28) 6-(4-хлорбензоїл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (29) 6-(4-гідроксибензоїл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (30) 6-фенокси-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (31) 2-трифторметил-6-[4-(трифторметил)фенокси]-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (32) (S)-2-трифторметил-6-[4-(трифторметил)фенокси]-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (33) 6-(4-метоксифенокси)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (34) 6-(3-хлор-4-метоксифенокси)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (35) 6-(4-хлорфенокси)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (36) 8-хлор-2-трифторметил-6-[4-(трифторметил)фенокси]-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (37) 6-хлор-8-ціан-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (38) 6-хлор-8-(2-тієніл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (39) 6-хлор-8-(фенілетиніл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (40) 6-хлор-8-[(4-хлорфеніл)етиніл]-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (41) 6-хлор-8-[(4-метоксифеніл)етиніл]-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (42) (S)-6-хлор-8-[(4-метоксифеніл)етиніл]-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (43) 6-фенілетиніл-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (44) 6-хлор-8-(4-хлорфеніл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (45) 6-хлор-8-феніл-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (46) 6-(4-бромфеніл)-2-трифторметил-2H-1-бензопіран-3-карбонова кислота;

(47) 6-хлор-8-(4-метоксифеніл)-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота; і
(48) 6-(2,2,2-трифтор-1-гідроксietил)-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота.

10. Заміщені похідні бензотіопірану за п. 2, де X - S;

R - карбоксил;

R¹ вибраний із групи, що включає C₁-C₃-перфторалкілі;

R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, феніл-C₁-C₆-алкіл, феніл-C₂-C₆-алкініл, феніл-C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкокси-, фенілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероариллоксигрупу, феніл-C₁-C₆-алкілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероарил-C₁-C₆-алкілоксигрупу, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалкоксигрупу, C₁-C₆-алкіламіно-, N-феніламіно-, N-(феніл-C₁-C₆-алкіл)аміно-, N-гетероариламіно-, N-(гетероарил-C₁-C₆-алкіл)аміно-, нітро-, аміногрупу, аміносульфоніл, N-алкіламіносульфоніл, N-ариламіносульфоніл, N-гетероариламіносульфоніл, N-(феніл-C₁-C₆-алкіл)аміносульфоніл, N-(гетероарил-C₁-C₆-алкіл)аміносульфоніл, гетероциклісульфоніл із кількістю членів від 5 до 8, C₁-C₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений 5- або 6-членний гетероарил, феніл-C₁-C₆-алкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл і C₁-C₆-алкілкарбоніл;

атоми циклу A - A¹, A², A³ і A⁴ - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів A¹, A², A³ і A⁴ є атомами вуглецю;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

11. Заміщені похідні бензотіопірану за п. 10, де X - S;

R - карбоксил;

Rⁿ вибраний із групи, що включає водень і етеніл;

R¹ вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;

R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, хлор, бром, фтор, йод, метил, трет-бутил, етеніл, етиніл, 5-хлор-1-пентиніл, 1-пентиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, бензил, фенілетил, фенілетиніл, 4-хлорфенілетиніл, 4-метоксифенілетиніл, фенілетеніл, метокси-, метилтіогрупу, метилсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, піридилокси-, тієнілокси-, фурилокси-, фенілметокси-, метилєндіоксигрупу, бензилоксиметил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметокси-, трифторметилтіогрупу, гідроксиметил, гідрокситрифторетил, метоксиметил, гідроксіімінетил, N-метиламіно-, N-феніламіно-, N-бензиламіно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносульфоніл, N-метиламіносульфоніл, N-феніламіносульфоніл, N-фуриламіносульфоніл, N-(бензил)аміносульфоніл, N-(фурилметил)аміносульфоніл, бензилсульфоніл, фенілетиламіносульфоніл, фурилсульфоніл, метилсульфоніл, феніл, феніл, заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає хлор, фтор, бром, метокси-, метилтіогрупу і метилсульфоніл, бензимидазоліл, тієніл, хлорзаміщений тієніл, фурил, хлорзаміщений фурил, бензилкарбоніл, фурилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і метилкарбоніл;

атоми циклу A - A¹, A², A³ і A⁴ - є атомами вуглецю;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

12. Сполука за п. 11, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:

- (1) 6-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (2) 6-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (3) 6,8-диметил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (4) 6-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (5) 7-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (6) 6,7-диметил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (7) 8-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (8) 2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (9) 6-хлор-7-метил-2-(трифторметил)-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (10) 7-хлор-2-(трифторметил)-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (11) 6,7-дихлор-2-(трифторметил)-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота;
- (12) 2-трифторметил-6-[(трифторметил)тіо]-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота; і
- (13) 6,8-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота.

13. Заміщені похідні бензотіопірану за п. 2, де X - NR^a;

R^a вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₃-алкіл, феніл-C₁-C₃-алкіл, ацил і карбокси-C₁-C₃-алкіл;

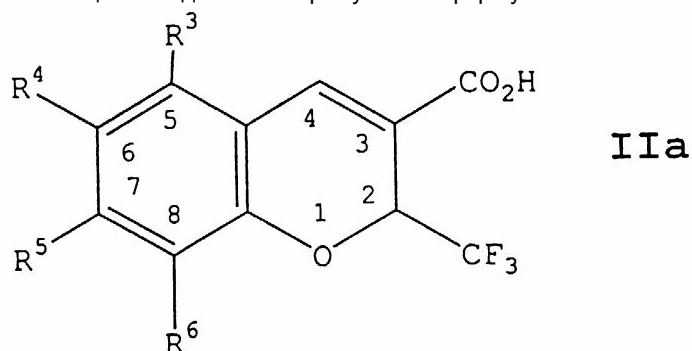
R - карбоксил;

R¹ вибраний із групи, що включає C₁-C₃-перфторалкілі;

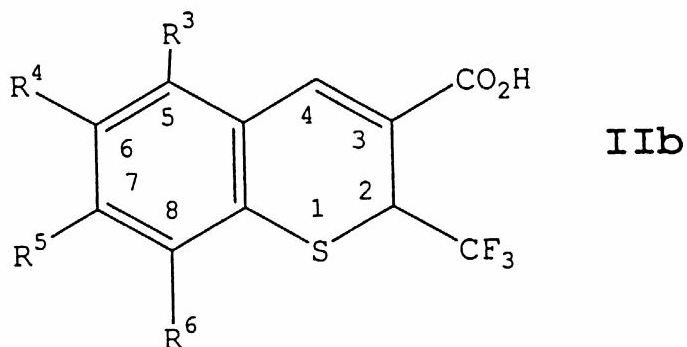
R² - один або декілька радикалів, незалежно вибраних із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, феніл-C₁-C₆-алкіл, феніл-C₂-C₆-алкініл, феніл-C₂-C₆-алкеніл, C₁-C₆-алкокси-, фенілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероариллоксигрупу, феніл-C₁-C₆-алкілоксигрупу, 5- або 6-членну гетероарил-C₁-C₆-алкілоксигрупу, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалкокси-, C₁-C₆-алкіламіно-, N-феніламіно-, N-(феніл-C₁-C₆-алкіл)аміно-, N-гетероариламіно-, N-(гетероарил-C₁-C₆-алкіл)аміно-, нітрогрупу, аміногрупу, аміносульфоніл, N-алкіламіносульфоніл, N-ариламіносульфоніл, N-гетероариламіносульфоніл, N-(феніл-C₁-C₆-алкіл)аміносульфоніл, N-(гетероарил-C₁-C₆-алкіл)аміносульфоніл, гетероциклісульфоніл із кількістю членів від 5 до 8, C₁-C₆-алкілсульфоніл, необов'язково заміщений феніл, необов'язково заміщений 5- або 6-членний

гетероарил, феніл- C_1-C_6 -алкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл і C_1-C_6 -алкілкарбоніл;
атоми циклу А - A^1, A^2, A^3 і A^4 - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів A^1, A^2, A^3 і A^4 є атомами вуглецю;
або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
14. Заміщені похідні бензопірану за п. 13, де X - NR^a ;
 R^a вибраний із групи, що включає водень, метил, етил, (4-трифторметил)бензил, (4-хлорметил)бензил, (4-метокси)бензил, (4-ціан)бензил і (4-нітро)бензил;
R - карбоксил;
 R'' вибраний із групи, що включає водень і етеніл;
 R^1 вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;
 R^2 - один або декілька радикалів, вибраних незалежно один від одного з групи, що включає водень, хлор, бром, фтор, йод, метил, трет-бутил, етеніл, етиніл, 5-хлор-1-пентиніл, 1-пентиніл, 3,3-диметил-1-бутиніл, бензил, фенілетил, фенілетиніл, 4-хлорфенілетиніл, 4-метоксифенілетиніл, фенілетеніл, метокси-, метилтіогрупу, метилсульфініл, фенілокси-, фенілтіогрупу, фенілсульфініл, піридилокси-, тієнілокси-, фурилокси-, фенілметокси-, метилєндіоксигрупу, бензилоксиметил, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметокси-, трифторметилтіогрупу, гідроксиметил, гідрокситрифторетил, метоксиметил, гідроксіімінметил, N-метиламіно-, N-феніламіно-, N-(бензил)аміно-, нітрогрупу, ціан, аміногрупу, аміносальфоніл, N-метиламіносальфоніл, N-феніламіносальфоніл, N-фуриламіносальфоніл, N-(бензил)аміносальфоніл, N-(фурилметил)аміносальфоніл, бензилсульфоніл, фенілетиламіносальфоніл, фурилсульфоніл, метилсульфоніл, феніл, феніл, заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає хлор, фтор, бром, метокси-, метилтіогрупу і метилсульфоніл, бензімідазоліл, тієніл, хлорзаміщений тієніл, фурил, хлорзаміщений фурил, бензилкарбоніл, фурилкарбоніл, фенілкарбоніл, амінокарбоніл, форміл і метилкарбоніл;
атоми циклу А - A^1, A^2, A^3 і A^4 - є атомами вуглецю;
або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
15. Сполука за п. 14, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:
(1) 6-хлор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(2) 6,8-дихлор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(3) 6,7-дифтор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(4) 6-йод-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(5) 6-бром-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(6) 1,2-дигідро-6-(трифторметокси)-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(7) 6-(трифторметил)-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(8) 6-ціан-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(9) 6-хлор-1,2-дигідро-1-метил-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(10) 6-хлор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-1-[[4-(трифторметил)феніл]метил]-3-хінолінкарбонова кислота;
(11) 6-хлор-1-[(4-хлорфеніл)метил]-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(12) 6-хлор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-1-[[4-(метокси)феніл]метил]-3-хінолінкарбонова кислота;
(13) 6-хлор-1-[(4-ціанфеніл)метил]-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(14) 6-хлор-1,2-дигідро-1-[(4-нітрофеніл)метил]-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота;
(15) 6-хлор-1,2-дигідро-1-етил-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота; і
(16) (S)-6-хлор-1,2-дигідро-2-(трифторметил)-3-хінолінкарбонова кислота.
16. Заміщені похідні бензопірану за п. 2, де X вибраний із групи, що складається з O, S і NR^a , де
 R^a вибраний із групи, що включає водень, C_1-C_3 -алкіл, феніл- C_1-C_3 -алкіл, ацил і карбокси- C_1-C_3 -алкіл;
R - карбоксил;
 R^1 вибраний із групи, що включає C_1-C_3 -перфторалкілі;
атоми циклу А - A^1, A^2, A^3 і A^4 - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів A^1, A^2, A^3 і A^4 є атомами вуглецю;
або R^2 разом із циклом А утворює радикал нафтил або хіноліл;
або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
17. Заміщені похідні бензопірану за п. 16, де X вибраний із групи, що складається з O, S і NR^a , де
 R^a вибраний із групи, що включає водень, метил, етил, (4-трифторметил)бензил, (4-хлорметил)бензил, (4-метокси)бензил, (4-ціан)бензил і (4-нітро)бензил;
R - карбоксил;
 R'' вибраний із групи, що включає водень і етеніл;
 R^1 вибраний із групи, що включає трифторметил і пентафторетил;
атоми циклу А - A^1, A^2, A^3 і A^4 - незалежно вибрані з групи, що включає вуглець і азот, за умови, що не менше трьох з атомів A^1, A^2, A^3 і A^4 є атомами вуглецю;
або R^2 разом із циклом А утворює радикал нафтил або хіноліл;
або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
18. Сполука за п. 17, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:
(1) 2-трифторметил-2H-нафто[1,2-b]піран-3-карбонова кислота;

- (2) 2-трифторметил-3Н-нафто[2,1-b]піран-3-карбонова кислота;
 (3) 2-трифторметил-2Н-нафто[2,3-b]піран-3-карбонова кислота;
 (4) 5-(гідроксиметил)-8-метил-2-трифторметил-2Н-пірано[2,3-с]піридин-3-карбонова кислота;
 (5) 6-(трифторметил)-6Н-1,3-діоксоло[4,5-г][1]бензопіран-7-карбонова кислота; і
 (6) 3-(трифторметил)-3Н-бензофуоро[3,2-г][1]бензопіран-2-карбонова кислота.
 19. Заміщені похідні бензопірану за п. 1 формули IIa:



- де R³ вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу і галоїд;
 R⁴ вибраний із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкілтіогрупу, C₁-C₆-галоїдний алкіл, аміногрупу, аміносульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфініл, C₁-C₆-алкоксіалкіл, C₁-C₆-алкілкарбоніл, форміл, ціан, C₁-C₆-галоїдалкілтіогрупу, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл, C₁-C₆-галоїдалкокси-, C₁-C₆-алкоксигрупу, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, ді-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, 5- або 6-членний гетероарил, C₁-C₆-гідроксіалкіл, необов'язково заміщений феніл і 5- або 6-членний азотвмісний гетероциклосульфоніл;
 R⁵ вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, галоїд, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу і феніл; і
 R⁶ вибраний із групи, що включає водень, галоїд, ціан, гідроксімінометил, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₂-C₆-алкініл, фенілакініл, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу, форміл і феніл;
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
 20. Заміщені похідні бензопірану за п. 19, де R³ вибраний із групи, що включає водень і хлор;
 R⁴ вибраний із групи, що включає хлор, метил, трет-бутил, метилтіогрупу, трифторметил, дифторметил, пентафторметил, трифторметилсульфід, трифторметоксигрупу, ціан, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл і заміщений або незаміщений феніл;
 R⁵ вибраний із групи, що включає водень, метил, трет-бутил і хлор;
 R⁶ вибраний із групи, що включає водень, хлор, тісніл, гідроксімінометил, заміщений або незаміщений фенілетиніл і заміщений або незаміщений феніл;
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
 21. Заміщені похідні бензопірану за п. 1 формули IIb:



- де R³ вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу і галоїд;
 R⁴ вибраний із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкілтіогрупу, C₁-C₆-галоїдний алкіл, аміногрупу, аміносульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфоніл, C₁-C₆-алкілсульфініл, C₁-C₆-алкоксіалкіл, C₁-C₆-алкілкарбоніл, форміл, ціан, C₁-C₆-галоїдалкілтіогрупу, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл, C₁-C₆-галоїдалкокси-, C₁-C₆-алкоксигрупу, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, ді-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіносульфоніл, 5- або 6-членний гетероарил, C₁-C₆-гідроксіалкіл, необов'язково заміщений феніл і 5- або 6-членний азотвмісний гетероциклосульфоніл;
 R⁵ вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, галоїд, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу і феніл; і
 R⁶ вибраний із групи, що включає водень, галоїд, ціан, гідроксімінометил, C₁-C₆-гідроксіалкіл, C₂-C₆-алкініл, фенілакініл, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу, форміл і феніл;
 або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.
 22. Заміщені похідні бензопірану за п. 21, де R³ вибраний із групи, що включає водень і хлор;

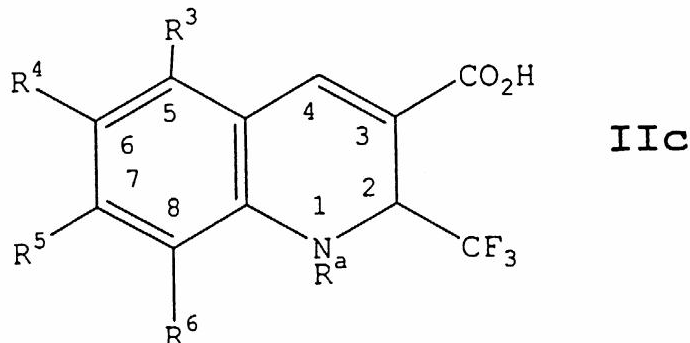
R^4 вибраний із групи, що включає хлор, метил, трет-бутил, метилтіогрупу, трифторметил, дифторметил, пентафторетил, трифторметилсульфід, трифторметоксигрупу, ціан, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл і заміщений або незаміщений феніл;

R^5 вибраний із групи, що включає водень, метил, трет-бутил і хлор;

R^6 вибраний із групи, що включає водень, хлор, тієніл, гідроксіімінометил, заміщений або незаміщений фенілетиніл і заміщений або незаміщений феніл;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

23. Заміщені похідні бензопірану за п. 1 формули IIc:



де R^a вибраний із групи, що включає водень і арил- C_1-C_6 -алкіл;

R^3 вибраний із групи, що включає водень, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -гідроксіалкіл, C_1-C_6 -алкоксигрупу і галоїд;

R^4 вибраний із групи, що включає водень, галоїд, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -алкілтіогрупу, C_1-C_6 -галоїдний алкіл, аміногрупу, аміносальфоніл, C_1-C_6 -алкілсульфоніл, C_1-C_6 -алкілсульфініл, C_1-C_6 -алкоксіалкіл, C_1-C_6 -алкілкарбоніл, форміл, ціан, C_1-C_6 -галоїдалкілтіогрупу, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл, C_1-C_6 -галоїдалкокси-, C_1-C_6 -алкоксигрупу, арил- C_1-C_6 -алкілкарбоніл, ді- C_1-C_6 -алкіламіносальфоніл, C_1-C_6 -алкіламіносальфоніл, арил- C_1-C_6 -алкіламіносальфоніл, гетероарил- C_1-C_6 -алкіламіносальфоніл, 5- або 6-членний гетероарил, C_1-C_6 -гідроксіалкіл, необов'язково заміщений феніл і 5- або 6-членний азотвмісний гетероциклосальфоніл;

R^5 вибраний із групи, що включає водень, C_1-C_6 -алкіл, галоїд, C_1-C_6 -галоїдний алкіл, C_1-C_6 -алкоксигрупу і феніл; і

R^6 вибраний із групи, що включає водень, галоїд, ціан, гідроксіімінометил, C_1-C_6 -гідроксіалкіл, C_2-C_6 -алкініл, фенілакініл, C_1-C_6 -алкіл, C_1-C_6 -алкоксигрупу, форміл і феніл;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

24. Заміщені похідні бензопірану за п. 23, де R^a - водень;

R^3 вибраний із групи, що включає водень і хлор;

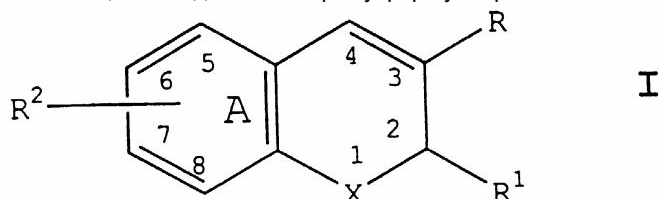
R^4 вибраний із групи, що включає хлор, метил, трет-бутил, метилтіогрупу, трифторметил, дифторметил, пентафторметил, трифторметилсульфід, трифторметоксигрупу, ціан, заміщений або незаміщений фенілкарбоніл і заміщений або незаміщений феніл;

R^5 вибраний із групи, що включає водень, метил, трет-бутил і хлор;

R^6 вибраний із групи, що включає водень, хлор, тієніл, гідроксіімінометил, заміщений або незаміщений фенілетиніл і заміщений або незаміщений феніл;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

25. Заміщені похідні бензопірану формули Ip:



де X вибраний із групи, що складається з O, S і NR^a ;

R^a - алкіл;

R вибраний із групи, що включає карбоксил, амінокарбоніл, алкілсульфоніламінокарбоніл і алкоксикарбоніл;

R^1 вибраний із групи, що включає галоїдний алкіл, алкіл, аралкіл, циклоалкіл і арил, необов'язково заміщений одним або декількома радикалами, вибраними з групи, що включає алкілтіо-, нітрогрупу й алкілсульфоніл; і

R^2 - один або декілька радикалів, вибраних із групи, що включає водень, галоїд, алкіл, аралкіл, алкокси-, арилокси-, гетероарилокси-, аралкілокси-, гетероаралкілоксигрупу, галоїдний алкіл, галоїдалкокси-, алкіламіно-, ариламино-, аралкіламіно-, гетероариламіно-, гетероарилалкіламіно-, нітро-, аміногрупу, аміносальфоніл, алкіламіносальфоніл, ариламиносальфоніл, гетероариламіносальфоніл, аралкіламіносальфоніл, гетероаралкіламіносальфоніл, гетероциклосальфоніл, алкілсульфоніл, необов'язково заміщений арил, необов'язково заміщений гетероарил, аралкілкарбоніл, гетероарилкарбоніл, арилкарбоніл, амінокарбоніл і алкілкарбоніл;

або R^2 разом із циклом A утворює радикал нафтил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

26. Заміщені похідні бензопірану за п. 25, де X - кисень або сірка;

R - вибраний із групи, що включає карбоксил, C₁-C₆-алкіл, арил-C₁-C₆-алкіл і C₁-C₆-алкоксикарбоніл;

R¹ - вибраний із групи, що включає C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₃-C₇-циклоалкіл і феніл;

R² - один або декілька радикалів, вибраних із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалкоксигрупу, C₁-C₆-алкіламіногрупу, нітрогрупу, аміногрупу, аміносальфоніл, C₁-C₆-алкіламіносальфоніл, 5- або 6-членний гетероарилалкіламіносальфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносальфоніл, 5- або 6-членний азотвмісний гетероциклосальфоніл, C₁-C₆-алкілсальфоніл, необов'язково заміщений феніл, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл і C₁-C₆- алкілкарбоніл;

або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

27. Заміщені похідні бензопірану за п. 26, де X - кисень або сірка;

R - карбоксил;

R¹ - C₁-C₆-галоїдний алкіл;

R² - один або декілька радикалів, вибраних із групи, що включає водень, галоїд, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галоїдний алкіл, C₁-C₆-галоїдалокси-, C₁-C₆-алкіламіно-, аміногрупу, аміносальфоніл, C₁-C₆-алкіламіносальфоніл, 5- або 6-членний гетероарилалкіламіносальфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносальфоніл, C₁-C₆-алкілсальфоніл, 6-членний азотвмісний гетероциклосальфоніл, необов'язково заміщений феніл, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл і C₁-C₆- алкілкарбоніл;

або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

28. Заміщені похідні бензопірану за п. 27, де R - карбоксил;

R¹ - вибраний із групи, що включає фторметил, хлорметил, дихлорметил, трихлорметил, пентафторетил, гептафторпропіл, дифторетил, дифторпропіл, дихлоретил, дихлорпропіл, дифторметил і трифторметил; і

R² - один або декілька радикалів, вибраних із групи, що включає водень, хлор, фтор, бром, йод, метил, етил, ізопропіл, трет-бутил, бутіл, ізобутіл, пентил, гексил, метокси-, етокси-, ізопропілокси-, трет-бутилоксигрупу, трифторметил, дифторметил, трифторметокси-, аміно-, N,N-диметиламіно-, N,N-діетиламіногрупу, N-фенілметиламіносальфоніл, N-фенілетиламіносальфоніл, N-(2-фурилметил)аміносальфоніл, нітрогрупу, N,N-диметиламіносальфоніл, аміносальфоніл, N-метиламіносальфоніл, N-етилсальфоніл, 2,2-диметилетиламіносальфоніл, N-(2-метилпропіл)аміносальфоніл, N-морфоліносальфоніл, метилсальфоніл, бензилкарбоніл, 2,2-диметилпропілкарбоніл, фенілацетил і феніл;

або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

29. Заміщені похідні бензопірану за п. 28, де R - карбоксил;

R¹ - трифторметил або пентафторетил; і

R² - один або декілька радикалів, вибраних із групи, що включає водень, хлор, фтор, бром, йод, метил, етил, ізопропіл, трет-бутил, метоксигрупу, трифторметил, трифторметоксигрупу, N-фенілметиламіносальфоніл, N-фенілетиламіносальфоніл, N-(2-фурилметил)аміносальфоніл, N,N-диметиламіносальфоніл, N-метиламіносальфоніл, N-(2,2-диметилетил)аміносальфоніл, диметиламіносальфоніл, 2-метилпропіламіносальфоніл, N-морфоліносальфоніл, метилсальфоніл, бензилкарбоніл і феніл;

або R² разом із циклом А утворює радикал нафтил;

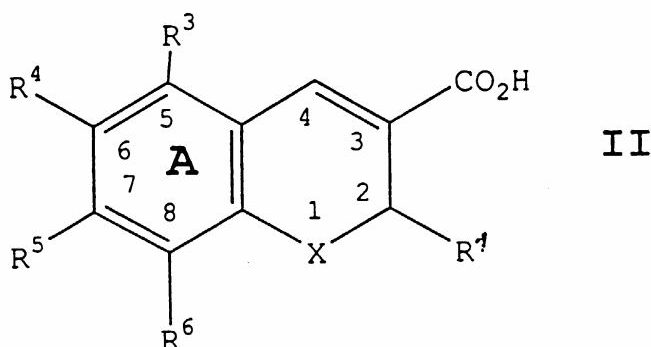
або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

30. Сполука за п. 29, вибрана з групи, що складається з нижчеперелічених сполук, а також їхніх ізомерів і фармацевтично прийнятних солей:

- (1) 6-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (2) 6-хлор-7-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (3) 8-(1-метилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (4) 6-хлор-7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (5) 6-хлор-8-(1-метилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (6) 2-трифторметил-3Н-нафтопіран-3-карбонова кислота;
- (7) 7-(1,1-диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (8) 6-бром-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (9) 8-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (10) 6-трифторметокси-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (11) 5,7-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (12) 8-феніл-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (13) 7,8-диметил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (14) 6,8-біс(диметилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (15) 7-(1-метилетил)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (16) 7-феніл-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (17) 6-хлор-7-етил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (18) 6-хлор-8-етил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (19) 6-хлор-7-феніл-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (20) 6,7-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
- (21) 6,8-дихлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;

- (22) 2-трифторметил-3Н-нафто[2,1-b]піран-3-карбонова кислота;
 (23) 6-хлор-8-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (24) 8-хлор-6-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (25) 8-хлор-6-метокси-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (26) 6-бром-8-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (27) 8-бром-6-фтор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (28) 8-бром-6-метил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (29) 8-бром-5-фтор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (30) 6-хлор-8-фтор-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (31) 6-бром-8-метокси-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (32) 6-[[фенілметил)аміно]сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (33) 6-[(диметиламіно)сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (34) 6-[(метиламіно)сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (35) 6-[(4-морфоліно)сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (36) 6-[(1,1-диметилетил)аміносурьфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (37) 6-[(2-метилпропіл)аміносурьфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (38) 6-метилсульфоніл-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (39) 8-хлор-6-[[фенілметил)аміно]сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (40) 6-фенілацетил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (41) 6,8-дибром-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (42) 8-хлор-5,6-диметил-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (43) 6,8-дихлор-(S)-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (44) 6-бензилсульфоніл-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (45) 6-[[N-(2-фурилметил)аміно]сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (46) 6-[[N-(2-фенілетил)аміно]сульфоніл]-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (47) 6-йод-2-трифторметил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота;
 (48) 7-(1,1-диметилетил)-2-пентафторетил-2Н-1-бензопіран-3-карбонова кислота; і
 (49) 6-хлор-2-трифторметил-2Н-1-бензотіопіран-3-карбонова кислота.

31. Заміщені похідні бензопірану за п. 25 формули II:



де X - O або S;

R¹ - C₁-C₆-галогідний алкіл;

R³ вибраний із групи, що включає водень і галогід;

R⁴ вибраний із групи, що включає водень, галогід, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-галогідалкокси-, C₁-C₆-алкоксигрупу, арил-C₁-C₆-алкілкарбоніл, ді-C₁-C₆-алкіламіносурьфоніл, C₁-C₆-алкіламіносурьфоніл, арил-C₁-C₆-алкіламіносурьфоніл, гетероарил-C₁-C₆-алкіламіносурьфоніл і 5- або 6-членний азотвмісний гетероциклосурьфоніл;

R⁵ вибраний із групи, що включає водень, C₁-C₆-алкіл, галогід, C₁-C₆-алкоксигрупу й арил; і

R⁶ вибраний із групи, що включає водень, галогід, C₁-C₆-алкіл, C₁-C₆-алкоксигрупу й арил;

або ізомери або фармацевтично прийнятні солі таких сполук.

32. Активний інгредієнт лікарського засобу для лікування розладу, опосередкованого циклооксигеназою-2, який являє собою сполуку за будь-яким з пп. 1-31 або її фармацевтично прийнятну сіль.

33. Активний інгредієнт за п. 32, де згаданий лікарський засіб є лікарським засобом для лікування запалення.

34. Активний інгредієнт за п. 32, де згаданий лікарський засіб є лікарським засобом для лікування артриту.

35. Активний інгредієнт за п. 32, де згаданий лікарський засіб є лікарським засобом для вгамування болю.

36. Активний інгредієнт за п. 32, де згаданий лікарський засіб є лікарським засобом для лікування гарячки.

37. Фармацевтична композиція, що містить терапевтично ефективну кількість сполуки, вибраної з-посеред сполук за будь-яким з пп. 1-31, або її фармацевтично прийнятної солі.

38. Спосіб одержання сполук за п. 19, який включає:

(а) конденсацію похідного орто-гідроксибензальдегіду з похідним акрилату у присутності основи для одержання заміщеного складного ефіру 2Н-1-бензопірану; і

(б) гідроліз складного ефіру для одержання відповідної кислоти.

39. Спосіб за п. 38, який відрізняється тим, що основу вибирають з групи, що включає карбонат калію й органічну основу.

40. Спосіб за п. 39, який відрізняється тим, що основу вибирають з групи, що включає карбонат калію і триетиламін.
41. Спосіб одержання сполук за п. 19, який включає:
- (а) дію на заміщений орто-гідроксіацетофенон двома або більше еквівалентами сильної основи з подальшою реакцією з діетилкарбонатом з одержанням складного бета-кетоефіру;
 - (b) конденсацію складного бета-кетоефіру з хлорангідридом або ангідридом кислоти у присутності основи при нагріванні з одержанням заміщеного 4-оксо-4Н-1-бензопірану;
 - (с) відновлення 4-оксо-4Н-1-бензопірану з одержанням складного бета-кетоефіру;
 - (d) ацилювання складного бета-кетоефіру в основі з одержанням енолтрифлату;
 - (е) відновлення трифлату з одержанням заміщеного складного ефіру 2Н-1-бензопірану; і
 - (f) омилювання складного ефіру з одержанням заміщеної 2Н-1-бензопіран-3-карбонової кислоти.
42. Спосіб за п. 41, який відрізняється тим, що сильною основою є біс(триметилсиліл)амід літію.
43. Спосіб за п. 41, який відрізняється тим, що відновлення виконують за допомогою відновника, вибраного з групи, що включає боргідрид натрію (NaBH_4) і триетилсилан, шляхом здійснення каталітичного відновлення.
44. Спосіб за п. 41, який відрізняється тим, що ацилювальним агентом є ангідрид трифторметансульфо кислоти.
45. Спосіб за п. 41, у якому трифлат відновлюють реагентом, вибраним із групи, що включає гідрид три-п-бутилолова, хлорид літію і каталізатор на основі паладію (0).
46. Спосіб одержання сполук за п. 21, який включає:
- (а) дію основи на заміщений тіофенол із подальшою обробкою диметилформамідом з одержанням заміщеного 2-меркаптобензальдегіду;
 - (b) конденсацію 2-меркаптобензальдегіду з акрилатом у присутності основи з одержанням складного ефіру 2Н-1-бензотіопірану; і
 - (с) омилювання складного ефіру з одержанням заміщеної 2Н-1-бензотіопіран-3-карбонової кислоти.
47. Спосіб за п. 46, який відрізняється тим, що на тіофенол діють п-бутиллітієм із використанням ТМЕДА (N,N,N',N' -тетраметилетилендіаміну).
48. Спосіб одержання сполук за п. 23, який включає:
- (а) конденсацію похідної 2-амінобензальдегіду з похідною акрилату з одержанням складного ефіру дигідрохінолін-3-карбонової кислоти; і
 - (b) омилювання складного ефіру з одержанням відповідної дигідрохінолін-3-карбонової кислоти.
49. Спосіб одержання сполук за п. 23, який включає:
- (а) ацилювання заміщеного аніліну з одержанням аміду;
 - (b) дію на амід літійорганічною основою, а потім диметилформамідом з одержанням ацильованого 2-амінобензальдегіду;
 - (с) проведення реакції бензальдегіду з акрилатом у присутності основи з одержанням складного ефіру; і
 - (d) обробку складного ефіру водним розчином основи з одержанням дигідрохінолін-3-карбонової кислоти.