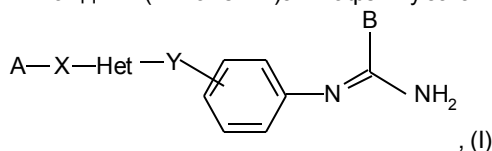
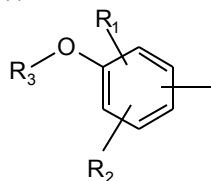


1. Похідні 2-(імінометил)амінофенілу загальної формули (I)

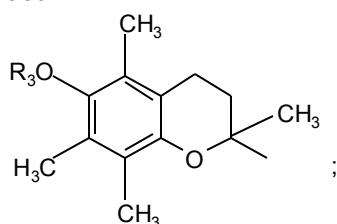


де А являє собою ароматичну сполуку, що відповідає структурам:



де R₁ та R₂ являють собою, незалежно, водень, галоген, групу OH, лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, лінійний або розгалужений алкокси-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

R₃ являє собою водень, лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або радикал -COR₄, R₄ являє собою алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або



В являє собою лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, феніл, піридиніл або 5-членний гетероцикл, котрий містить від 1 до 4 гетероатомів, що вибирають з O, S, N, і, більш конкретно, тіофен, фуран, пірол або тіазол, у яких вуглецеві атоми заміщені при необхідності однією або більшою кількістю груп, що вибирають з лінійного або розгалуженого алкіл-радикала з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-радикала з 1-6 атомами вуглецю або галогену,

Х являє собою -CO-N(R₃)-X', -NH-CO-X', -CH=, -CO- або один зв'язок,

X' являє собою -(CH₂)_n, де n дорівнює від 0 до 6,

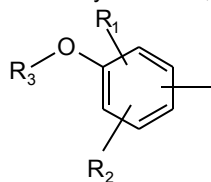
Y являє собою -Y', -CO-NH-Y', -Y'-NH-CO-, -CO-Y', -Y'-CO-, -N(R₃)-Y', -Y'-N(R₃)-, Y'-CH₂-N(R₃)-CO-, -O-Y', -Y'-O-, -S-Y', -Y'-S-, -Y'-O-Y', -Y'-N(R₃)-Y' або один зв'язок,

Y' являє собою -(CH₂)_n, де n дорівнює від 0 до 6,

Het являє собою гетероцикл, вибраний з групи, що містить оксетан, пірол, піролідін, фуран, тетрагідрофуран, тіофен, тетрагідротіофен, сульфолан, імідазол, імідазолін, дигідроімідазол-2-он, дигідроімідазол-2-тіон, оксазол, ізоксазол, оксазолін, ізоксазолін, оксазолідін, оксазолідінон, тіазол, тіазолін, тіазолідін, тіазолідінон, гідантоїн, 1,2,4-триазол, 1,3,4-оксадіазол, 1,3,4-тіадіазол, 1,1-діоксид-1,2,5-тіадіазолідін, 1,2,4-триазол-3-он, тетразол та тетрагідропіридин,

та адитивні солі з кислотами зазначеної сполуки загальної формули (I).

2. Сполука за п. 1, яка відрізняється тим, що А являє собою ароматичну сполуку, що відповідає структурі



де R₁ та R₂ являють собою, незалежно, лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або лінійний або розгалужений алкокси-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

R₃ являє собою водень або лінійний чи розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

В являє собою 5-членний гетероцикл, котрий містить від 1 до 4 гетероатомів, що вибирають з O, S, N, і, більш конкретно, тіофен, фуран, пірол або тіазол, у яких вуглецеві атоми заміщені при необхідності однією або більшою кількістю груп, що вибирають з лінійного або розгалуженого алкіл-радикала з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-радикала з 1-6 атомами вуглецю або галогену,

Х являє собою -NH-CO-X', -CH=, -CO- або один зв'язок,

X' являє собою -(CH₂)_n, де n дорівнює від 0 до 6,

Y являє собою -Y', -Y'-NH-CO-, -Y'-CO-, -Y'-O-, -Y'-O-Y', -Y'-N(R₃)-Y' або один зв'язок,

Y' являє собою -(CH₂)_n, де n дорівнює від 0 до 6,

Het являє собою гетероцикл, вибраний з групи, що містить оксетан, пірол, піролідін, фуран, тетрагідрофуран, тіофен, тетрагідротіофен, сульфолан, імідазол, імідазолін, дигідроімідазол-2-он, дигідроімідазол-2-тіон, оксазол, ізоксазол, оксазолін, ізоксазолін, оксазолідін, оксазолідінон, тіазол, тіазолін, тіазолідін, тіазолідінон, гідантоїн, 1,2,4-триазол, 1,3,4-оксадіазол, 1,3,4-тіадіазол, 1,1-діоксид-1,2,5-тіадіазолідін, 1,2,4-триазол-3-он, тетразол та тетрагідропіридин,

та адитивні солі з кислотами зазначеної сполуки загальної формули (I).

3. Сполука за п. 2, яка відрізняється тим, що В являє собою тіофеновий цикл, у якому вуглецеві атоми заміщені при необхідності однією або більшою кількістю груп, що вибирають із лінійного або розгалуженого алкілу з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-радикала з 1-6 атомами вуглецю або галогену.

4. Сполука за пп. 1-3, яка відрізняється тим, що вона є однією з наступних сполук:

- гідройодид N-(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)-5-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-2-фуранкарбоксаміду;
- гідрохлорид 3-(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)-1-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-2,5-імідазолідиндіону;
- гідрохлорид 2-(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)-3-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-4-тіазолідинону;
- фумарат 5-[(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)метилен]-1-метил-3-[4-{іміно(2-тієніл) метиламіно}феніл]-2,4-імідазолідиндіону;
- гідрохлорид 2-(S)-4-(S)-N-[4-гідрокси-3,5-біс-(1,1-диметилетил)-феніл]-4-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-пролінамід;
- фумарат N-[4-гідрокси-3,5-біс-(1,1-диметилетил)-феніл]-2-(R,S)-{4-[(іміно(2-тієніл) метил)аміно]феніл}-4-(R)-тіазолідин карбоксаміду;
- гідройодид N-[4-(4-феніл-1,2,3,6-тетрагідропіридин-1-іл)-феніл]-2-тіофен карбоксимідамід;
- гідрохлорид N-[4-гідрокси-3,5-біс-(1,1-диметил)етилфеніл]-2-{4-[(іміно(2-тієніл)метил) аміно]феніл}-4-тіазолкарбоксаміду;
- гідрохлорид метил 1-[(3,4-дигідро-6-гідрокси-2,5,7,8-тетраметил-2-Н-[1]-бензопіран-2-іл)карбоніл]-4-(S)-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-піролідин-2-(S)-карбоксилату;
- гідрохлорид 1-[(3,4-дигідро-6-гідрокси-2,5,7,8-тетраметил-2-Н-[1]-бензопіран-2-іл)карбоніл]-3-(S)-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-піролідину;
- 3-[(3,4-дигідро-6-гідрокси-2,5,7,8-тетраметил-2Н-[1]-бензопіран-2-іл)карбоніл]аміно-1-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}піролідин;
- гідрохлорид 4-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-N-{4[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]бензоїл}-N-метил-1Н-імідазол-2-метанамін;
- гідройодид N-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-1-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}-1Н-пірол-2-карбоксамід;
- гідройодид 1-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-3-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}карбоніл]-2-імідазолідинону;
- гідройодид 3-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-4,5-дигідро-N-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}-5-ізоксазолацетамід;
- гідрохлорид 4-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-N-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}-N-метил-2-тіазолметанамін;
- гідрохлорид 4-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-N-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}-N-метил-1Н-імідазол-2-метанамін;
- 3-[3,5-біс-(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл]-4,5-дигідро-5-{2-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}етил}-ізоксазол;
- гідрохлорид 1-[(3,5-біс(1,1-диметилетил)-4-гідроксифеніл)аміно]карбоніл]-3-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-азетидину;
- гідрохлорид 1-(2-гідрокси-5-метоксибензоїл)-3-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-азетидину;
- гідрохлорид 1-[(3,4-дигідро-6-гідрокси-2,5,7,8-тетраметил-2Н-[1]-бензопіран-2-іл)карбоніл]-4-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-піперидину;
- гідрохлорид 1-[(3,4-дигідро-6-гідрокси-2,5,7,8-тетраметил-2Н-[1]-бензопіран-2-іл)карбоніл]-3-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-азетидину;

або їх солі чи енантіомери.

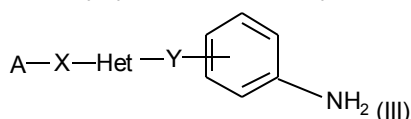
5. Сполука за будь-яким з пп. 1-4, яка відрізняється тим, що вона є однією з наступних сполук:

- гідрохлорид 3-(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)-1-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-2,5-імідазолідиндіону;
- гідрохлорид 2-(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)-3-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-4-тіазолідинону;
- фумарат 5-[(3,5-ди-*t*-бутил-4-гідроксифеніл)метилен]-1-метил-3-[4-{іміно(2-тієніл)метиламіно}феніл]-2,4-імідазолідиндіону;
- гідрохлорид 2-(S)-4-(S)-N-[4-гідрокси-3,5-біс-(1,1-диметилетил)-феніл]-4-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]фенокси}-пролінамід;
- гідрохлорид N-[4-гідрокси-3,5-біс-(1,1-диметил)етил-феніл]-2-{4-[(іміно(2-тієніл)метил)аміно]феніл}-4-тіазол карбоксамід;

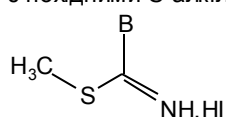
або їх солі чи енантіомери.

6. Спосіб одержання сполук загальної формули (I) за п.1, який відрізняється тим, що включає конденсацію,

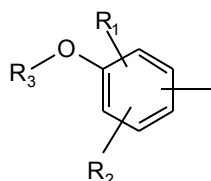
краще у суміші ізопропанолу та DMF при кімнатній температурі, похідних аніліну загальної формули (III)



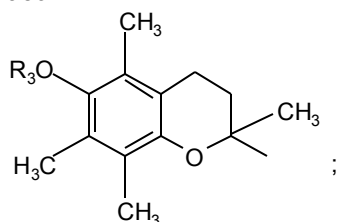
з похідними S-алкілтіоїмідату загальної формули (IV)



з одержанням кінцевих сполук загальної формули (I), причому сполуки загальних формул (I), (III) та (IV) є такими, де А являє собою ароматичну сполуку, що відповідає структурам



або



В являє собою лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, феніл, піридиніл або 5-членний гетероцикл, котрий містить від 1 до 4 гетероатомів, що вибирають із O, S, N, і, більш конкретно, тіофен, фуран, пірол або тіазол, у яких вуглецеві атоми заміщені при необхідності однією або більшою кількістю груп, що вибирають із лінійного або розгалуженого алкілу з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-радикала з 1-6 атомами вуглецю або галогену,

X являє собою $-\text{CO}-\text{N}(\text{R}_3)-\text{X}'$ -, $-\text{NH}-\text{CO}-\text{X}'$ -, $-\text{CH}=\text{}$, $-\text{CO}-$ або один зв'язок,

X' являє собою $-(\text{CH}_2)_n$ -, де n дорівнює від 0 до 6,

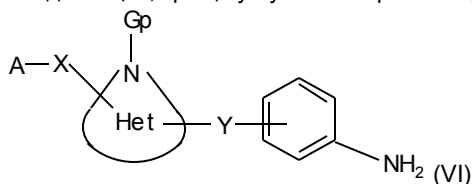
Y являє собою $-\text{Y}'$ -, $-\text{CO}-\text{NH}-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{NH}-\text{CO}-$, $-\text{CO}-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{CO}-$, $-\text{N}(\text{R}_3)-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{N}(\text{R}_3)-$, $\text{Y}'-\text{CH}_2-\text{N}(\text{R}_3)-\text{CO}-$, $-\text{O}-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{O}-$, $-\text{S}-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{S}-$, $-\text{Y}'-\text{O}-\text{Y}'$ -, $-\text{Y}'-\text{N}(\text{R}_3)-\text{Y}'$ або один зв'язок,

Y' являє собою $-(\text{CH}_2)_n$ -, де n дорівнює від 0 до 6,

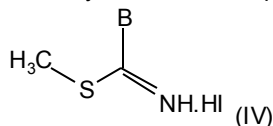
Het являє собою гетероцикл, вибраний з групи, що містить оксетан, пірол, піролідін, фуран, тетрагідрофуран, тіофен, тетрагідротіофен, сульфолан, імідазол, імідазолін, дигідроімідазол-2-он, дигідроімідазол-2-тіон, оксазол, ізоксазол, оксазолін, ізоксазолін, оксазолідін, оксазолідинон, тіазол, тіазолін, тіазолідін, тіазолідинон, підантоїн, 1,2,4-триазол, 1,3,4-оксадіазол, 1,3,4-тіадіазол, 1,1-діоксид-1,2,5-тіадіазолідін, 1,2,4-триазол-3-он, тетразол, тетрагідропіридин.

7. Спосіб одержання сполук загальної формули (I) за п.1, у яких гетероцикл Het містить принаймні один атом азоту, який відрізняється тим, що включає дві наступні стадії:

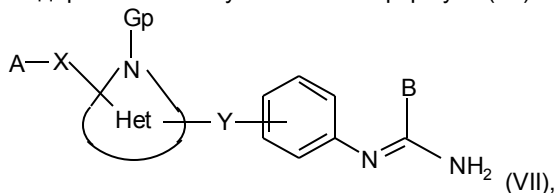
конденсацію, краще у суміші ізопропанолу та DMF при кімнатній температурі, сполуки загальної формули (VI)



зі сполукою загальної формули (IV)



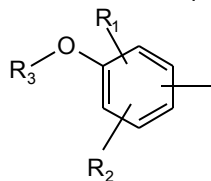
з одержанням сполуки загальної формули (VII)



відщеплення захисної групи Gp сполуки загальної формули (VII), що визначена вище, з одержанням сполуки загальної формули (I),

причому сполуки загальних формул (I), (IV), (VI) та (VII) є такими, де

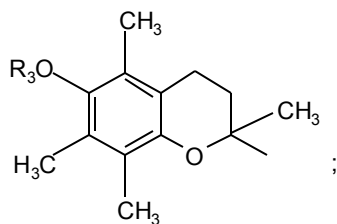
A являє собою ароматичну сполуку, що відповідає структурам



де R1 та R2 являють собою, незалежно, водень, галоген, групу OH, лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, лінійний або розгалужений алкокси-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю,

R₃ являє собою водень, лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або радикал -COR₄,

R₄ являє собою алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, або



V являє собою лінійний або розгалужений алкіл-радикал, що містить від 1 до 6 атомів вуглецю, феніл, піридиніл або 5-членний гетероцикл, котрий містить від 1 до 4 гетероатомів, що вибирають із O, S, N, і, більш конкретно, тіофен, фуран, пірол або тіазол, у яких вуглецеві атоми заміщені при необхідності однією або більшою кількістю груп, що вибирають із лінійного або розгалуженого алкілу з 1-6 атомами вуглецю, алкокси-радикала з 1-6 атомами вуглецю або галогену,

X являє собою -CO-N(R₃)-X'-, -NH-CO-X'-, -CH=, -CO- або один зв'язок,

X' являє собою -(CH₂)_n-, де n дорівнює від 0 до 6,

Y являє собою -Y'-, -CO-NH-Y', -Y'-NH-CO-, -CO-Y'-, -Y'-CO-, -N(R₃)-Y'-, -Y'-N(R₃)-, Y'-CH₂-N(R₃)-CO-, -O-Y'-, -Y'-O-, -S-Y'-, -Y'-S-, -Y'-O-Y'-, -Y'-N(R₃)-Y' або один зв'язок,

Y' являє собою -(CH₂)_n-, де n дорівнює від 0 до 6,

Het являє собою гетероцикл, вибраний з групи, що містить пірол, піролідін, імідазол, імідазолін, дигідроімідазол-2-он, дигідроімідазол-2-тіон, оксазол, ізоксазол, оксазолін, ізоксазолін, оксазолідін, оксазолідинон, тіазол, тіазолін, тіазолідін, тіазолідинон, пидантоїн, 1,2,4-триазол, 1,3,4-оксадіазол, 1,3,4-тіадіазол, 1,1-діоксид-1,2,5-тіадіазолідін, 1,2,4-триазол-3-он, тетразол, тетрагідропіридин,

G_p являє собою захисну групу аміної функції, котра, переважно, розщеплюється у кислому безводному середовищі, таку, наприклад, як карбамати t-бутилу, трихлоретила або триметилсилілетилу, або додатково тритильну групу.

8. Сполука загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка відрізняється тим, що використовується як медикамент.

9. Фармацевтична композиція, що містить як активний інгредієнт принаймні одну сполуку за п. 8.

10. Сполука загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка відрізняється тим, що використовується для виготовлення медикаменту, призначеного для інгібування NO-синтази.

11. Сполука загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка відрізняється тим, що використовується для виготовлення медикаменту, призначеного для інгібування ліпідного переокислення.

12. Сполука загальної формули (I) за будь-яким з пп. 1-5 або її фармацевтично прийнятна сіль, яка відрізняється тим, що використовується для виготовлення медикаменту, що водночас виявляє інгібуючу активність щодо NO-синтази та інгібуючу активність щодо ліпідного переокислення.