

# Синтез N-сульфонамидинов, содержащих трифторметильную группу

Савельев Д.А., Галиева Н.А., М.Д. Безгина, Березкина Т.В., Бакулев В.А.

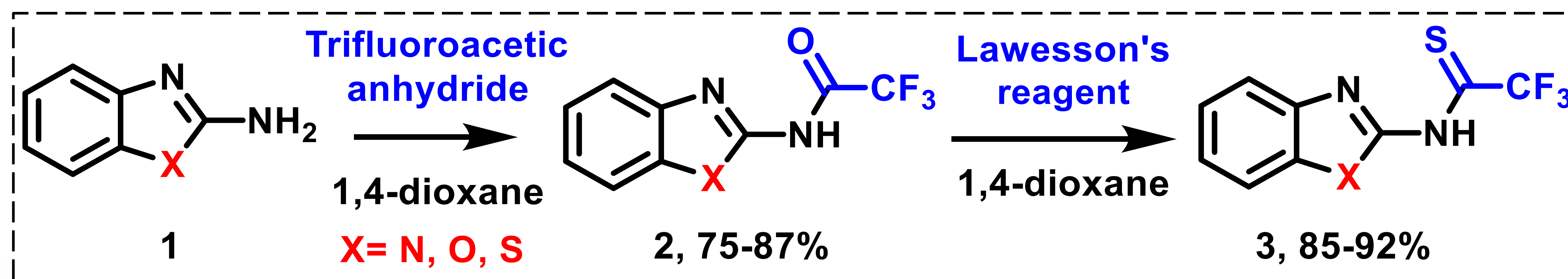
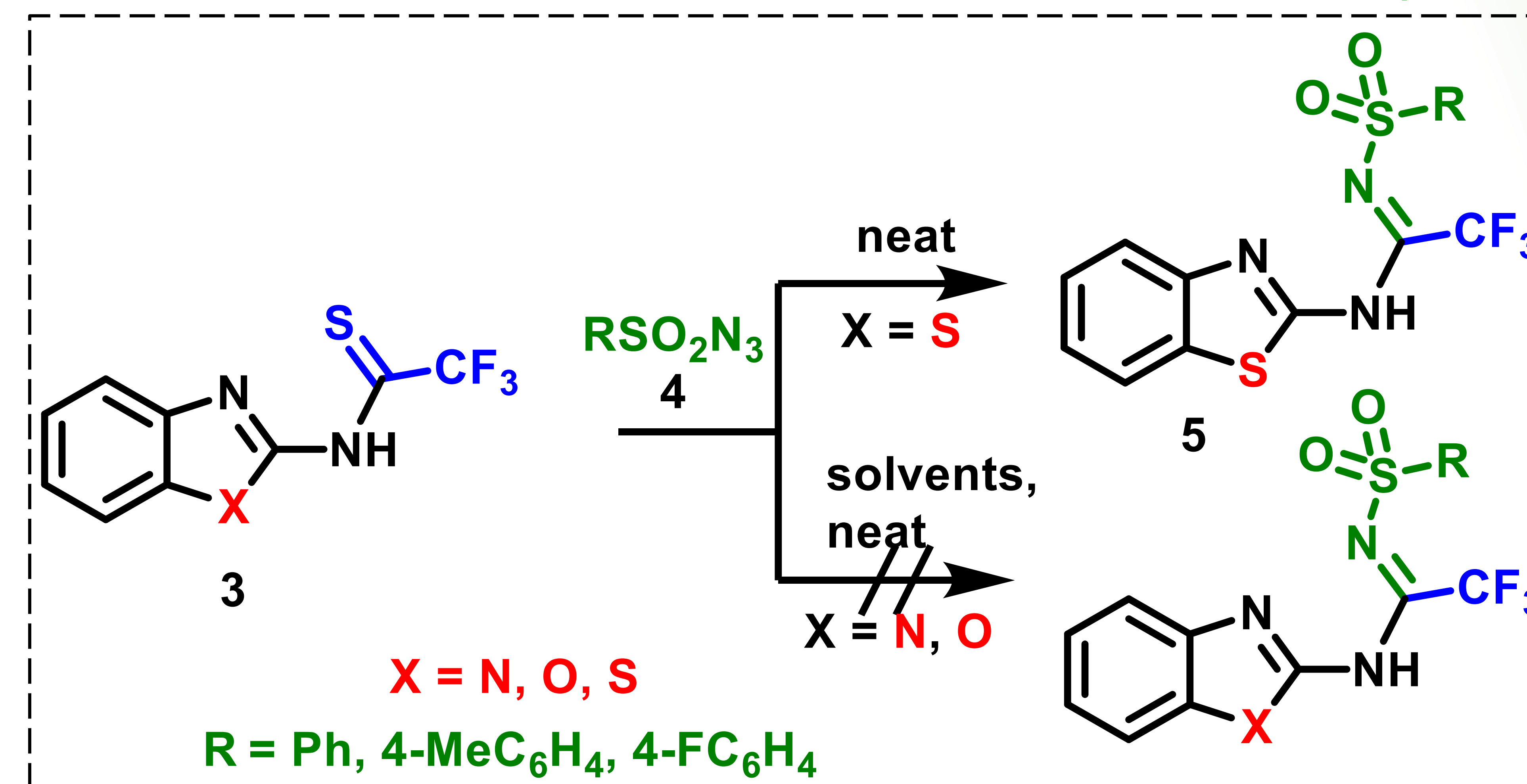
Уральский федеральный университет  
620002, г. Екатеринбург, ул. Мира, д. 19  
[dimaamid1418@gmail.com](mailto:dimaamid1418@gmail.com)

Амидины входят в состав многих биологически активных натуральных продуктов и являются важными фармакофорами. В отличие от амидинов в целом, N-сульфонацетиамидины слабо представлены в литературе, их химические и биологические свойства изучены плохо.

Трифторметильная группа входит в состав соединений, обладающих разнообразной активностью, например: гербицидная, противорвотная, также наличие данной группы усиливает противораковую активность некоторых препаратов.

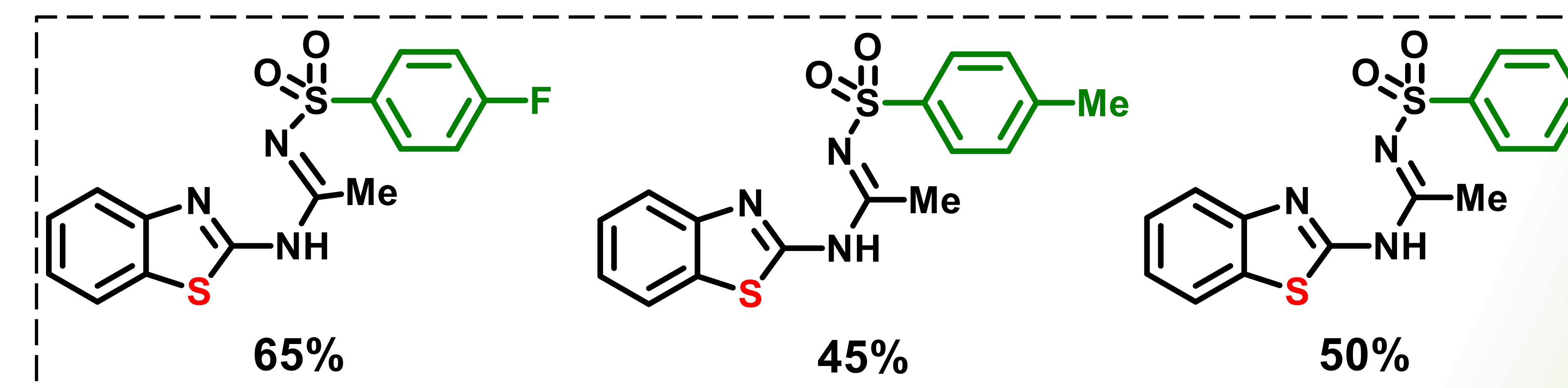
Производные бенз[d]имида(окса или тиа)зола также обладают различными видами биологической активности, поэтому получение новых сульфонамидинов данных рядов, содержащих трифторметильную группу, представляет интерес.

Мы разработали препаративно удобный метод синтеза новых *тиоамидов* **3** из 2-амино-1H-бензо[d]имида(окса или тиа)золов **1**.



Тиоамиды безимидазольного и бензоксазольного рядов **3**, вопреки ожиданиям, не вступают в реакцию с сульфоназидами **4** в растворителях (спирты, ДМФА, диоксан) и при сплавлении. Целевые N-сульфонамидины **5** удалось получить только из тиоамидов бенз[d]тиазольного ряда, проводя реакцию при нагревании без растворителя.

N-трифторацетилимида(окса или тиа)золы **2** были получены реакцией ацилирования соответствующих аминов ангидридом трифторуксусной кислоты. Полученные соединения **2** тионировали реактивом Лоусона.



Реакции идут по механизму 1,3-диполярногоциклоприсоединения  
Строение всех соединений подтверждено данными <sup>1</sup>H, <sup>13</sup>C, 2D HSQC и HMBC (<sup>1</sup>H-<sup>13</sup>C) спектроскопии и ИК, масс-спектрометрии.