КАТАЛИТИЧЕСКИЙ СИНТЕЗ АМИДОВ И АМИДИНОВ РЯДА АДАМАНТАНА С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ ТРИХЛОРИДА ФОСФОРА

Т.Л.К. Во, Е.В. Шишкин

Кафедра ТОНС, Волгоградский государственный технический университет,
400005, Россия, г. Волгоград, пр. Ленина, д. 28.

DOI: 10.19163/MedChemRussia2021-2021-29

E-mail: voquyen249@gmail.com

В последнее время производные адамантана привлекают большое внимание в связи с их фармакологической активностью и теоретическим интересом для химиков-органиков. Включение адамантанового фрагмента в молекулы различных биологически активных соединений значительно изменяет их фармакологическое действие [1].

В большинстве методов амиды 1-адамантанкарбоновой кислоты получают из 1-адамантанкарбоновой кислоты в две стадии через хлорангидриды, которые легко гидролизуются в присутствии влаги [2]. Нами предложен новый метод синтеза амидов 1-адамантанкарбоновой кислоты в одну стадию с помощью PCl_3 в присутствии катализатора DMAP акцептора хлористого водорода триэтиламина при мольном соотношении $\text{AdCOOH} : \text{PCl}_3 : \text{амин} : \text{DMAP} : \text{Et}_3\text{N} = 1:1:1:1:1$ при температуре 80°C в течение 2ч. Амиды получены с высокими выходами 62-94%.

где $\text{R} = \text{Ph}, p\text{-BuPh}, m\text{-NO}_2\text{Ph}, p\text{-NO}_2\text{Ph}, p\text{-BrPh}, p\text{-ClPh}, o\text{-MePh}, m\text{-MePh}, p\text{-MePh}, p\text{-MeOPh}$

Также нами предложен новый одnoreакторный метод получения адамантитилсодержащих амидинов из 1-адамантанкарбоновой кислоты с помощью PCl_3 в присутствии катализатора DMAP при мольном соотношении $\text{AdCOOH} : \text{PCl}_3 : \text{амин} : \text{DMAP} : \text{Et}_3\text{N} = 1:1:5:1:5:3:1$ при температуре 80°C в течение 4ч. Амидины получены с высокими выходами 78-95%.

где $\text{R} = o\text{-MePh}, m\text{-MePh}, p\text{-MePh}, p\text{-ClPh}, p\text{-MeOPh}, o\text{-PrPh}$

Разработанный одnoreакторный метод синтез амидинов является более эффективным по сравнению с традиционными способами в четыре стадии, поскольку осуществляется без выделения промежуточных продуктов хлорангидридов карбоновых и имидовых кислот, которые легко гидролизуются в присутствии влаги.

Литература

- [1] Морозов И.С., Петров В.И., Сергеева С.А. Фармакология адамантанов, Волгоград: Волгоградская мед. Академия. 2001, – 320 с.
- [2] Zhong X., Guo J., Fu S., Zhu D., Peng J. Journal of Surfactants and Detergents. 2014, 17, 943–950.