

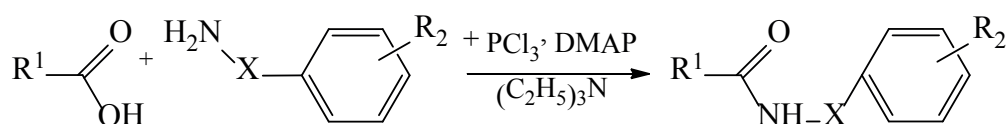
СИНТЕЗ АМИДОВ КАРБОНОВЫХ КИСЛОТ С ИСПОЛЬЗОВАНИЕМ ТРИХЛОРИДА ФОСФОРА

Шишкин Е.В., Во Т.Л.К., Попов Ю.В.

Волгоградский государственный технический университет,
400005, Волгоград, проспект Ленина, 28, e-mail: shishkin@vstu.ru

Амиды карбоновых кислот являются важным сырьём для производства различных фармацевтических и агрохимических средств. Амиды адамантилкарбоновых кислот не только являются интермедиатами синтеза соединений с противовирусной и противосудорожной активностью, но и сами являются биологически активными соединениями¹.

Нами разработан новый способ получения амидов карбоновых кислот из карбоновой кислоты и амина с использованием PCl_3 в присутствии катализатора 4-(N,N-диметиламино)пиридина (DMAP) и акцептора хлористого водорода триэтиламина (ТЭА) в одну стадию без выделения промежуточных хлорангидридов, которые легко гидролизуются в присутствии влаги.



где $\text{R}^1 = \text{Ph}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{X} = \text{связь}$; $\text{R}^1 = \text{Ad}$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $p\text{-C}_4\text{H}_9$, $m\text{-NO}_2$, $p\text{-NO}_2$, $p\text{-Br}$, $p\text{-Cl}$, $o\text{-CH}_3$, $m\text{-CH}_3$, $p\text{-CH}_3$, $\text{X} = \text{CH}_2$, связь ; $\text{R}^1 = \text{AdCH}_2$, $\text{R}^2 = \text{H}$, $\text{X} = \text{связь}$

Амиды получены с высоким выходом в среде абсолютного ацетонитрила при мольном соотношении карбоновая кислота: амин: PCl_3 : DMAP: ТЭА = 1:1:1:1:1 при температуре 800С в течение 2 – 8 часов.

Таблица. Выходы амидов карбоновых кислот:

Вещество	Выход, %	Вещество	Выход, %
$\text{PhC(O)NHC}_6\text{H}_5$	81	$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{Cl-}p$	67
$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_5$	78	$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{CH}_3\text{-}o$	88
$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{C}_4\text{H}_9\text{-}p$	85	$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{CH}_3\text{-}m$	82
$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{NO}_2\text{-}m$	77	$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{CH}_3\text{-}p$	87
$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{NO}_2\text{-}p$	84	$\text{AdC(O)NHCH}_2\text{C}_6\text{H}_5$	70
$\text{AdC(O)NHC}_6\text{H}_4\text{Br-}p$	79	$\text{AdCH}_2\text{C(O)NHC}_6\text{H}_5$	69

Таким образом, разработан удобный способ одностадийного получения амидов карбоновых кислот, протекающий в относительно мягких условиях с высоким выходом целевых продуктов.

Литература

1. Фармакология адамантанов/ И.С. Морозов, В.И. Петров, С.А. Сергеева, 2001. - 320 с.