

НОВЫЕ ПОДХОДЫ К СИНТЕЗУ ТРИФТОРМЕТИЛЗАМЕЩЕННЫХ
ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИХ ФОСФОНАТОВ*

Ключевые слова: фосфонаты, гетероциклы, фторорганические соединения, катализ.

Фосфоновые кислоты и их производные, ввиду их биологической активности, широко применяются в медицинской химии и агрохимии [1]. Известно, что введение атома фтора и перфторалкильных фрагментов в молекулы биологически активных органических соединений часто приводит к увеличению их активности [2]. В связи с этим разработка методов синтеза соединений, содержащих как фтор, так и фосфорильный фрагмент, является актуальным и перспективным подходом для создания новых биологически активных соединений.

В данной работе мы разработали методы синтеза CF_3 -замещённых (индолин-2-илиден)метил- (**1**) и хинолин-3-илфосфонатов (**2**) из 1-(2-аминофенил)-2,2,2-трифтор-этанонов и диэтил этинилфосфонатов с использованием различных каталитических систем. Использование катализатора на основе меди привело к получению CF_3 -замещённых (индолин-2-илиденметил)фосфонатов, тогда как в случае катализа солями и комплексами серебра и золота образовывались CF_3 -замещённые хинолин-3-илфосфонаты (рисунок 1).

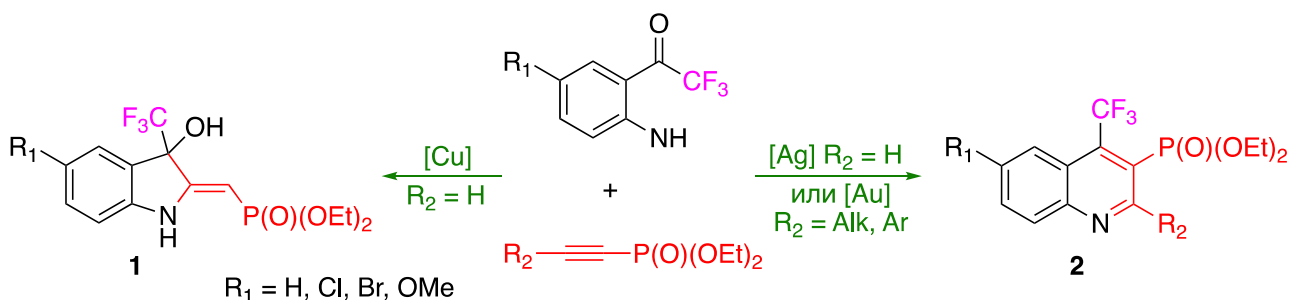


Рисунок 1

Также нами разработан метод получения CF₃-замещенных (1,3-диоксолан-4-илиден)метилфосфонатов (**3a,b**) по реакции диэтил этинилфосфоната или 3-гидроксипроп-1-ин-1-илфосфонатов с различными 2,2,2-трифтотрацетофенонами в присутствии основания (рисунок 2).

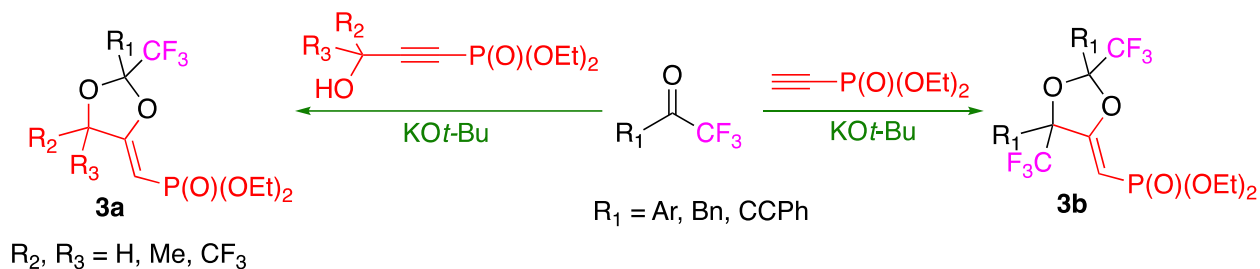


Рисунок 2

Впервые синтезирован новый прекурсор для получения разнообразных CF₃-замещенных гетероциклических фосфонатов – диэтил 4,4,4-трифтор-3-оксобут-1-ин-1-илфосфонат (**4**) (рисунок 3). Изучено его использование для синтеза различных пиразолов, хинолинов, триазолов.



Рисунок 3

Изучена антибактериальная активность полученных соединений.

Список литературы

1. *Horsman G. H., Zechel D. L.* // Chemical Reviews. 2017. Vol. 117. P. 5704–5783.
2. *Nie J., Guo H.-C., Cahard D., Ma J.-A.* // Chemical Reviews. 2011. Vol. 111. P. 455–529.

* Работа выполнена при поддержке гранта РФФ 19-73-00168.