

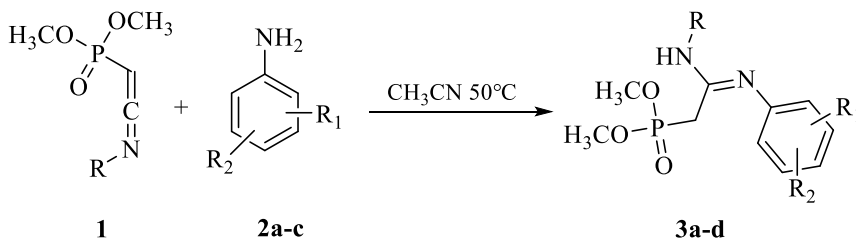
**СИНТЕЗ N-АРИЛ-С-ФОСФОАЦЕТАМИДИНОВ  
НА ОСНОВЕ ДИЗАМЕЩЕННЫХ АРИЛАМИНОВ  
И ДИМЕТИЛ-2-(N-АЛКИЛИМИНО)ЭТЕНИЛФОСФОНАТОВ**

*Головки А.И., Свиницкая Н.И.*

Санкт-Петербургский государственный технологический институт  
190013, г. Санкт-Петербург, Московский пр-т, д. 24-26/49, литер А

К числу важных азотсодержащих производных карбоновых кислот относятся амидины – соединения, обладающие высокой основностью и выраженной биологической активностью. Они широко используются в качестве ключевых интермедиатов при синтезе металлоорганических комплексов и разнообразных гетероциклических молекул. В их структуре заложены азометиновый (C=N) и амидный (C–N) фрагменты, что придаёт молекулам частично двойственный характер и определяет особенности их реакционной способности. Фосфонилированные амидины, включающие фосфонатный фрагмент, находят применение в медицинской химии, катализе и реакциях с участием супероснований. Особый интерес представляют фосфорилированные пептиды, содержащие амидиновое звено, которые рассматриваются как потенциальные ингибиторы тромбина и других сериновых протеаз, участвующих в процессах коагуляции крови.

В продолжение исследований в области химии функционально-замещённых аминокислот нами осуществлён синтез новых N-арил-С-фосфоацетамидинов **3a–d** на основе диметил-2-(N-адамант-1-ил/трет-бутил)иминоэтиленфосфонатов **1** и дизамещённых ариламинов **2** с выходом 55-75%.



R = Ad, t-Bu; **2a**: R<sub>1</sub> = 2-OCH<sub>3</sub>, R<sub>2</sub> = 5-OCH<sub>3</sub>; **2b**: R<sub>1</sub> = 3-OCH<sub>3</sub>, R<sub>2</sub> = 4-OCH<sub>3</sub>; **2c**: R<sub>1</sub> = 2-F, R<sub>2</sub> = 4-Br

Использование метоксизамещённых анилинов усиливают нуклеофильность аминогруппы, повышая скорость реакций и выходы целевых продуктов. При этом 3,4-изомер проявляет большую доступность аминогруппы, тогда как 2,5-изомер частично ограничен стерическим влиянием. В противоположность им, применение 2-фтор-4-броманилина несколько затрудняет реакцию, поскольку галогены снижают электронную плотность на аминогруппе.

Строение полученных соединений подтверждено методами спектроскопии ЯМР <sup>1</sup>H, <sup>13</sup>C, <sup>31</sup>P.