

Lipofil királis organokatalizátor előállítása, alkalmazása és visszaforgatása

Synthesis, application, and recycling of lipophilic chiral organocatalyst

DARGÓ Gyula¹, ERDÉLYI Dóra¹, MOLNÁR Balázs¹, GARÁDI Zsófia²,
HUSZTHY Péter¹, DSc, KISSZÉKELYI Péter¹, PhD, BAGI Péter¹, PhD,
KUPAI József¹, PhD

¹Budapesti Műszaki és Gazdaságtudományi Egyetem, Vegyészmérnöki és Biomérnöki Kar, Szerves
Kémia és Technológia Tanszék
1111 Budapest, Műegyetem rkp. 3.

²Semmelweis Egyetem, Farmakognózi Intézet
1085 Budapest, Üllői út. 26
kupati.jozsef@vbk.bme.hu, www.kupaigroup.com

ABSTRACT

More than seven years ago, in 2015, the United Nations General Assembly announced the 2030 Agenda for Sustainable Development, which many countries worldwide have joined. Through this Agenda, 17 major targets have been identified. These targets include several requirements for the chemicals sector to reduce its environmental impact. Taking these into account, catalytic processes and the recovery and reuse of chemicals have gained attention, which could save significant energy and resources. In our research, our aim was the stereoselective synthesis of the chiral intermediate of the skeletal muscle relaxant drug, baclofen, using a cinchona squaramide organocatalyst. Following the reaction, the catalyst was recycled by the exchange of the solvent. For this purpose, a lipophilic unit was incorporated into the catalyst, resulting in a significant solubility difference between the catalyst and the other components of the reaction mixture. Thus, using a polar solvent (e.g., acetonitrile), the catalyst can be recycled by simple centrifugation.

Keywords: organocatalysis, cinchona, squaramide, stereoselective, catalyst recovery

KIVONAT

Több mint 7 éve, 2015-ben az Egyesült Nemzetek Szervezetének közgyűlésén meghirdették a 2030-ig tartó időszakra vonatkozó fenntartható fejlődés menetrendjét, amely teljesítéséhez a világ számos országa csatlakozott. Ennek során 17 nagyobb célpontot jelöltek ki. Ezek a célkitűzések között található számos vegyipart érintő elvárás, amelyeknek köszönhetően csökkenteni lehet ezen ágazat környezeti terhelését. Ezeket a törekvéseket figyelembe véve a középpontba kerülnek a katalitikus eljárások, valamint az alkalmazott vegyi anyagok visszanyerése és újrafelhasználása, amelyek révén jelentős energiát és erőforrást takaríthatunk meg. Munkánk során többek között célunk volt a simaizom-görcsoldó baclofen gyógyszerhatóanyag királis intermedierjének sztereoszelektív szintézise cinkona-négyzetamid organokatalizátor segítségével. A reakciót követően a katalizátort visszaforgatását oldószercseré segítségével valósítottam meg. Ehhez a katalizátorra egy lipofil egységet építettem be, amely segítségével a katalizátor és a reakcióelegy többi komponense között jelentős oldhatóságbeli különbség alakul ki. Így egy poláris oldószer (pl. acetonitril) alkalmazásával a katalizátor egyszerű centrifugálás segítségével visszaforgatható.

Kulcsszavak: organokatalízis, cinkona, négyzetamid, sztereoszelektív, katalizátor-visszanyerés