

Lipofil oldallánccal módosított cinkona organokatalizátorok

Cinchona organocatalysts modified with a lipophilic moiety

MOLNÁR Balázs¹, DARGÓ Gyula¹, KISSZÉKELYI Péter¹,
FEHÉR Zsuzsanna¹, HUSZTHY Péter¹, dsc, KUPAI József¹, phd

¹Budapesti Műszaki és Gazdaságtudományi Egyetem,
Vegyészmérnöki és Biomérnöki Kar, Szerves Kémia és Technológia Tanszék
1111 Budapest, Műegyetem rkp. 3.
jkupai@mail.bme.hu, www.kupaigroup.com

ABSTRACT

Nowadays, the recovery of organocatalysts is a crucial issue considering both environmental and economic aspects. An effective and simple solution to meet this challenge is to change the solubility of the reaction components compared to each other. To reach this aim, lipophilic side chain can be incorporated into the organocatalyst. This causes a considerable difference in the polarity, which allows the catalyst and the other components of the reaction mixture to be separated from one another by filtration after changing the solvent or by an extraction step. Our aim was to develop a new synthetic method for the incorporation of a lipophilic moiety into the catalysts. At first, starting from methyl gallate, we prepared a carboxylic acid derivative containing three octadecyl groups. This lipophilic unit was then linked in an amide formation reaction to a cinchona squaramide organocatalyst (through an aminoethyl linker), which had previously led to excellent enantioselectivity in *Michael* reactions. In the amide formation, we examined the acyl chloride pathway and coupling agents as well. We plan to apply the gained lipophilic catalyst in various asymmetric conjugate addition reactions.

Keywords: organocatalysis, cinchona alkaloids, squaramide, enantioselectivity, catalyst recovery

KIVONAT

Napjainkban környezetvédelmi és gazdaságossági szempontból egyaránt fontos feladat az organokatalizátorok visszaforgatása. Erre hatékony és egyszerű megoldást jelent, ha megváltoztatjuk a reakcióelegy komponenseinek oldhatóságát egymáshoz képest. Ez többek közt az organokatalizátorra történő lipofil oldallánc beépítésével érhető el. Az így adódó jelentős különbség a katalizátor és a reakcióelegy többi komponensének polaritása között lehetővé teszi, hogy azokat egy oldószercserét követő szűréssel, vagy egy extrakciós lépéssel elválasszuk egymástól. Célkitűzésünk egy új szintetikus módszer kidolgozása volt, mellyel lipofil oldalcsoport építhető be a katalizátorokra. Ehhez először metil-gallátból kiindulva egy három oktadecilcsoportot tartalmazó karbonsavszármazékot állítottunk elő. Ezt a lipofil egységet savamidképzési reakcióval rögzítettük egy cinkona-négyzetamid organokatalizátorra (egy aminoetil linkerrel keresztül), amely korábban kitűnő enantioszelektivitás elérését tette lehetővé *Michael*-reakciókban. Az amidképzésnél savkloridképzést és kapcsolószerek alkalmazását is vizsgáltunk. A kapott lipofilezett katalizátort a jövőben különböző aszimmetrikus konjugált addíciós reakciókban tervezzük alkalmazni.

Kulcsszavak: organokatalízis, cinkona-alkaloidok, négyzetamid, enantioszelektivitás, katalizátor-visszanyerés