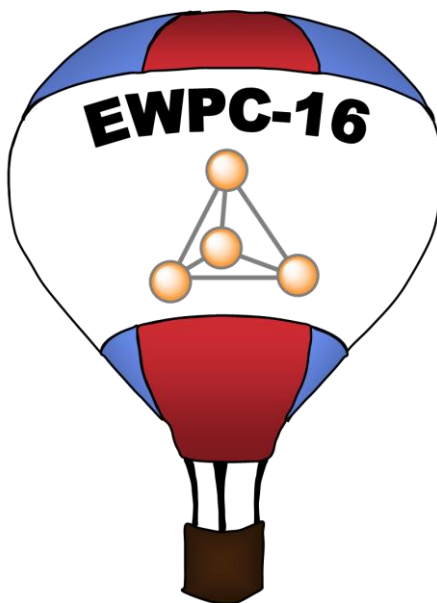


16th **E**uropean **W**orkshop on **P**hosphorus **C**hemistry



24-26 April 2019



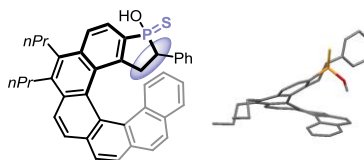
University of
BRISTOL

Chair: Philipp Brehm (Univ. Bonn)

11:10 **O12: New family of P-stereogenic phosphahelicenes**

Julie Febvay

Institut de Chimie des Substances Naturelles, CNRS, France

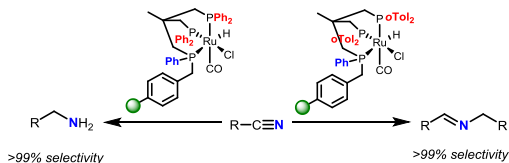


First helically chiral Brønsted acids

11:30 **O13: Selective nitrile reduction using solid-supported triphos ligands: application in continuous flow**

Robert Konrath

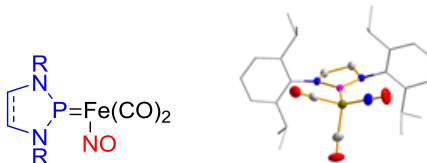
Univ. St Andrews, UK



11:50 **O14: NHP-Nitrosyl complexes of iron**

Christoph Feil

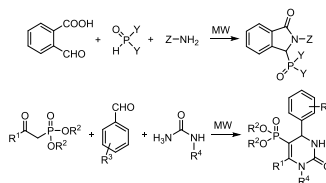
Univ. Stuttgart, Germany



12:10 **O15: Investigation of microwave assisted Kabachnik-Filedels and Biginelli reactions**

Nóra Tóth

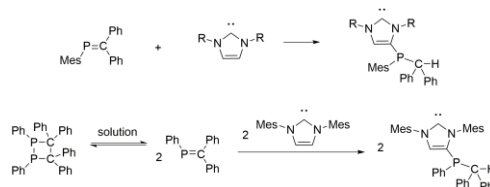
Budapest Univ. of Technology and Economics, Hungary



12:30 **O16: Abnormal reactions of N-heterocyclic carbenes with phosphalkenes**

Zeyu Han

Univ. British Columbia, Canada



12:50 **Lunch**

Investigation of microwave-assisted Kabachnik-Fields and Biginelli reactions

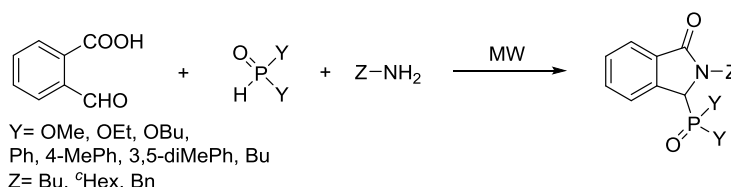
Nóra Tóth, Bettina Rávai, Evelyn Hümpfner, Ádám Tajti and Erika Bálint

Department of Organic Chemistry and Technology, Budapest University of Technology and Economics, Budapest, Hungary.

toth.nora@mail.bme.hu

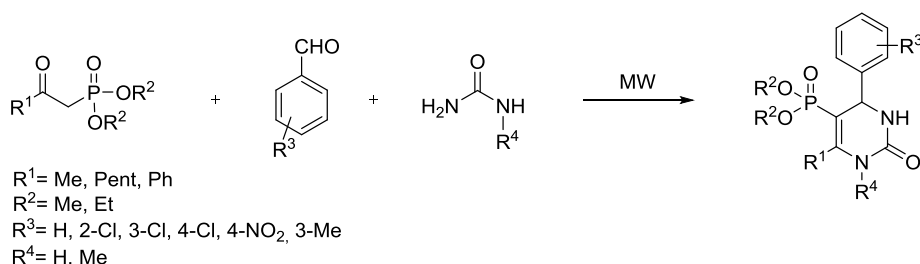
Organophosphorus compounds can be found in several fields of life, such as in organic and medicinal chemistry, in agriculture, as well as in plastic industry [1]. Over the last years, the synthesis of heterocyclic aminophosphonate derivatives has received a growing interest. In our research work, our aim was to synthesize various heterocycles containing phosphonate or phosphine oxide moiety *via* multicomponent reactions.

First, 3-oxoisindolin-1-ylphosphonates were synthesized by microwave(MW)-assisted Kabachnik-Fields reaction followed by cyclization (Scheme 1). The reaction of 2-formylbenzoic acid, diethyl phosphite and butyl amine was investigated and optimized in the absence of any catalyst and solvent. Then the condensation studied was extended to various >P(O)H reagents and amines.



Scheme1: The Kabachnik-Fields reaction of 2-formylbenzoic acid

The Biginelli reaction of diethyl (2-oxopropyl)phosphonate, benzaldehyde and urea was also investigated under MW conditions (Scheme 2). After the optimization of the model reaction, new dihydropyrimidinone phosphonates were synthesized using different β -ketophosphonates, aldehydes and urea derivatives.



Scheme 2: The Biginelli reaction of β -ketophosphonates

Acknowledgements

The project was supported by the Hungarian Research Development and Innovation Fund (FK123961), N.T. was supported by the National Talent Program (NTP-NFTÖ-18-B-0375), E. B. was supported by the János Bolyai Research Scholarship of the Hungarian Academy of Sciences (BO/00278/17/7) and by the ÚNKP-18-4-BME-131 New National Excellence Program of the Ministry of Human Capacities.

References

- 1 *SPR - Organophosphorus Chemistry*; D. W. Allen, D. Loakes, J. C. Tebby, Eds.; Vol. 45, RSC Cambridge, **2016**.

KABACHNIK-FIELDS- ÉS BIGINELLI-REAKCIÓK TANULMÁNYOZÁSA MIKROHULLÁMÚ REAKTORBAN

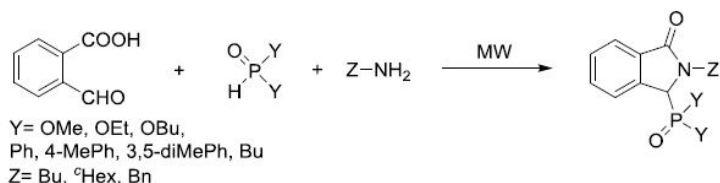
Tóth Nóra, Rávai Bettina, Hümpfner Evelyn, Tajti Ádám, Bálint Erika

Budapesti Műszaki és Gazdaságtudományi Egyetem, Szerves Kémia és Technológia Tanszék, 1111 Budapest, Budafoki út 8.

toth.nora@mail.bme.hu

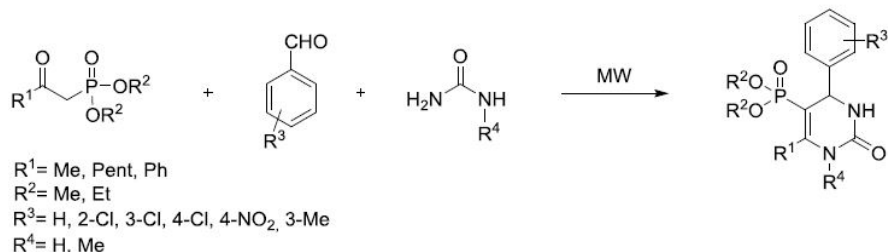
A szerves foszforvegyületek az élet számos területén megtalálhatóak, így a szerves kémia, az orvostudomány, a mezőgazdaság és a műanyagipar területén [1]. Az utóbbi időben egyre nagyobb hangsúlyt kaptak a heterociklusos aminoszfónátok és származékainak előállítása. Kutatómunkánk során célunk volt a különféle aminoszfónát, illetve aminoszfín-oxid származékok előállítása multikomponensű reakciókban.

Első lépésben mikrohullámú (MW) besugárzás hatására történő gyűrűzárásban izoindolin gyűrűs aminoszfónátot szintetizáltunk Kabachnik-Fields-reakción keresztül (1. ábra). A 2-formilbenzoesav, dietil-foszfít és butil-amin reakciójának optimalizálását katalizátor és oldószer alkalmazása nélkül valósítottuk meg. A kondenzációt további aminokra és foszfor reagensekre is kiterjesztettük.



1. ábra: 2-formilbenzoesav Kabachnik-Fields-reakciója

A Biginelli-reakció során dietil-2-oxopropilfoszfónátot, benzaldehidet és karbamidot reagáltattunk MW körülmények között (2. ábra). A modellreakció optimalizálása után, különböző β -ketofoszfónát, aldehid, illetve karbamid származékokkal új dihidro-pirimidinon foszfónátokat szintetizáltunk.



2. ábra: β -ketofoszfónátok Biginelli-reakciója

Köszönetnyilvánítás:

A kutatás az NKFIH FK123961 és az NTP-NFTÖ-18-B-0375 pályázat részfinanszírozásával, a Bolyai János Kutatási Ösztöndíj (BO/00278/17/7), valamint az Új Nemzeti Kiválóság Program (ÚNKP-18-4-BME-131) támogatásával készült.

Irodalom:

SPR - Organophosphorus Chemistry; D. W. Allen, D. Loakes, J. C. Tebby, Eds.; Vol. 45, RSC, Cambridge, **2016**.