

Formulár ZK - Záverečná karta projektu

Riešiteľ: Ing. Peter Szolcsányi, PhD.	Evidenčné číslo projektu: APVV-20-000904
Názov projektu: Asymetrické Pd(II)-katalyzované reakcie ako metodika prípravy chirálnych stavebných blokov pre syntézu biologicky účinných prírodných látok a ich analógov	
Na ktorých pracoviskách bol projekt riešený:	Fakulta chemickej a potravinárskej technológie STU Bratislava
Ktoré zahraničné pracoviská spolupracovali pri riešení (názov, štát):	
Udelené patenty alebo podané patentové prihlášky, vynálezy alebo úžitkové vzory vychádzajúce z výsledkov projektu:	
Publikácie (knihy, články, prednášky, správy a pod.) zhrňujúce výsledky projektu (uved'te i publikácie prijaté do tlače alebo pripravované): <i>Uvádzajte maximálne päť najvýznamnejších publikácií.</i>	P. Szolcsányi, T. Gracza: <i>Chem. Commun.</i> 2005 , 3948-3950; <i>"Novel Pd(II)-catalysed N,O-bicyclisation as an efficient route to the 6-oxa-2-azabicyclo[3.2.1]octane skeleton"</i>
	M. Babjak, L. Remeň, P. Szolcsányi, P. Zálupský, D. Mikloš, T. Gracza: <i>J. Organomet. Chem.</i> 2006 , <u>691</u> , 928-940; <i>"Novel bicyclisation of unsaturated polyols in PdCl₂-CuCl₂-AcOH catalytic system"</i>
	P. Szolcsányi, T. Gracza: <i>Tetrahedron</i> 2006 , <u>62</u> , 8498-8502; <i>"PdCl₂/CuCl₂-catalysed chlorocyclisation of sugar-derived aminoalkenitols in the synthesis of new iminohexitols"</i>
	„Short racemic syntheses of calvine and epicalvine“ <i>Tetrahedron Lett.</i> 2007 , doi: 10.1016/j.tetlet.2007.12.099 P. Szolcsányi, T. Gracza, Ivan Špánik
	“Formal synthesis of (+)-6-epipinidinone” Synlett (publikácia zaslaná editorovi na posúdenie) Peter Szolcsányi, Kristína Csatajová, Tibor Gracza, Ivan Špánik
V čom vidíte uplatnenie výsledkov tohto projektu:	V obohatení poznatkov syntetickej organickej chémie s dôrazom na aplikáciu novo vyvinutých metód na efektívnu prípravu biologicky aktívnych prírodných látok.

Podpisom záverečnej karty riešiteľ vyjadruje svoj súhlas ku zverejneniu údajov v nej uvedených.

Podpis riešiteľa:

Dátum:

Charakteristika výsledkov

Evidenčné číslo: APVV-20-000904

Súhrn výsledkov riešenia projektu a naplnenia cieľov projektu (max. 20 riadkov) - slovensky:

Vypracovali sa nové a efektívne syntetické metódy prípravy ako racemických, tak aj enantioméne čistých, vhodne ochránených a funkcionalizovaných aminoalkenitolov ako východiskových substrátov pre asymetrické transformácie. Vypracovali sa nové metodiky stereoselektívnych Pd(II)-katalyzovaných aminokarbonylácií, bicyklizácií a chlóracyklizácií príslušných aminoalkenitolov, ktoré predstavujú efektívny spôsob prípravy pyrrolidínov, piperidínov, azepánov, laktónov a laktámov ako vhodných chirálnych stavebných blokov. Navrhli sa možné mechanistické scenáre ich vzniku a boli uskutočnené kvantovo-chemické výpočty za účelom identifikácie najpravdepodobnejších syntetických mechanizmov. Pripravené kľúčové intermediáty boli využité ako optimálne stavebné bloky v nových a efektívnych totálnych syntézach prírodných alkaloidov a ich analógov vykazujúcich využiteľnú biologickú aktivitu: (epi)pinidinónu, (epi)kalvínu, (epi)dihydropinidínu a homológov iminohexitolov. Dosiahnuté výsledky boli publikované formou 3 diplomových prác, 5 publikácií v karentovaných zahraničných časopisoch, 3 pozvaných prednášok a 2 posterov na zahraničných konferenciách, ako aj 3 prezentácií ŠVOČ. Naplánované ciele boli v plnej miere splnené.

Súhrn výsledkov riešenia projektu a naplnenia cieľov projektu (max. 20 riadkov) - anglicky:

We have developed new and simple synthetic methods for the preparation of racemic as well as enantiomerically pure, suitably protected and functionalised aminoalkenitols as starting materials for asymmetric transformations. We have developed novel and efficient stereoselective methodologies of Pd(II)-catalysed aminocarbonylations, bicyclisations and chlorocyclisations of corresponding aminoalkenitols, which represent a straightforward approach for the preparation of pyrrolidines, piperidines and azepanes, lactones and lactams as suitable chiral building blocks. We have proposed a viable mechanistic scenarios of their formation and performed quantum-chemical calculations in order to identify the most probable synthetic mechanisms. Such prepared key intermediates were employed as suitable building blocks in new and effective total syntheses of naturally occurring alkaloids and their functional analogues with useful biological properties: (epi)pinidinone, (epi)calvine, (epi)dihydropinidine and homologues of iminohexitols. The results were published in form of 3 MSc. Thesis, 5 publications in high-quality journals, 3 invited lectures and 2 posters at international conferences. All set goals have been fully achieved.

Podpis riešiteľa: