



Záverečná karta projektu

Názov projektu

Evidenčné číslo projektu

APVV-0457-11

Progresívne katalytické transformácie na báze Cu a Fe

Zodpovedný riešiteľ **doc. Ing. Andrej Kolarovič, PhD.**

Príjemca **FCHPT STU**

Názov pracoviska, na ktorom bol projekt riešený

1. Oddelenie organickej chémie, FCHPT STU
- 2.
- 3.
- 4.
- 5.

Názov a štát zahraničného pracoviska, ktoré spolupracovalo pri riešení

- 1.
- 2.
- 3.

Udelené patenty/podané patentové prihlášky, vynálezy alebo úžitkové vzory, ktoré sú výsledkami projektu

- 1.
- 2.
- 3.

Najvýznamnejšie publikácie (knihy, články, prednášky, správy a pod.) zhrňujúce výsledky projektu – uveďte aj publikácie prijaté do tlače

1. Knižná kapitola

Kolarovič, A. Lithiations and Grignard Reactions on Pyrimidine and Quinazoline. Topics in Heterocyclic Chemistry; Schnürch, M., Mihovilovic, M. D., Eds.; Springer-Verlag Berlin Heidelberg, 2013, Vol. 31, pp 21-64

- 2.
- 3.
- 4.
- 5.

Uplatnenie výsledkov projektu

CHARAKTERISTIKA VÝSLEDKOV

Súhrn výsledkov riešenia projektu a naplnenia cieľov projektu v slovenskom jazyku (max. 20 riadkov)

Vedecké ciele projektu orientované na Fe-, resp. Cu-katalyzované transformácie alkínov považujeme za čiastočne splnené. Štúdiom Fe-katalyzovaných dekarboxylačných kaplingov alk-2-ínových kyselín sme vypracovali podmienky na prípravu disubstituovaných alkínov, predbežne dosiahnuté výťažky do 40% však nedokážu konkurovať klasickému Sonogashira kaplingu. Aj napriek intenzívnemu úsiliu sa nám nepodarilo vyvinúť intermolekulový variant Cu(I)-katalyzovaných adícií karboxylových kyselín na terminálne alkíny. Vypracovali sme praktickú metódu vedúcu ku širokej škále rôzne funkcionalizovaných (E)-3-acylakrylových kyselín. Popisujeme krátku a efektívnu stereoselektívnu syntézu vedúcu k (R)-3-benzylpiperidínu a jeho derivátom, v multigramovom rozsahu a bez použitia stĺpcovej chromatografie. Úspešne sme využili metódu CIAT v stereoselektívnej syntéze γ -oxo- α -aminokyselín. Tie boli použité ako stavebné bloky v stereoselektívnej syntéze konformačne obmedzených prolínových chimér s tromi kontinuálnymi stereogénnymi centrami.

Súhrn výsledkov riešenia projektu a naplnenia cieľov projektu v anglickom jazyku (max. 20 riadkov)

The scientific aims of the project in the domain of Fe- and Cu-catalyzed alkyne transformations we consider to be partially accomplished. Our studies of Fe-catalyzed decarboxylative couplings of alk-2-ynoic acids resulted in a method that allows synthesis of disubstituted alkynes. However, the obtained yields up to 40% can not compete with a standard Sonogashira coupling. Despite of our intense effort we did not succeed in developing an intermolecular variant of Cu(I)-catalyzed additions of carboxylic acids to terminal alkynes. We developed a practical method leading to a broad scale of diversely functionalized (E)-3-acylacrylic acids. We described a concise and efficient stereoselective synthesis leading to (R)-3-benzylpiperidine and its derivatives in a multigram scale and with no need of a chromatographic purification. We successfully utilized CIAT method in a stereoselective synthesis of γ -oxo- α -amino acids. These were used as building blocks in a stereoselective synthesis of conformationally restricted proline chimeras bearing three contiguous stereogenic centers.

Svojím podpisom potvrdzujem, že údaje uvedené v záverečnej karte sú pravdivé a úplné a súhlasím s ich zverejnením.

Zodpovedný riešiteľ

doc. Ing. Andrej Kolarovič, PhD.

V Bratislave 29. 07. 2015

Štatutárny zástupca príjemcu

prof. Ing. Ján Šajbidor, DrSc.

V Bratislave

.....
podpis zodpovedného riešiteľa

.....
podpis štatutárneho zástupcu príjemcu