







首页 南开要闻 百年校庆 媒体南开 专题报道 南开人物 南开之声 南开大学报 视频 广播

0

您当前的位置: 南开大学 >> 南开要闻

# 周其林和朱守非团队《Science》发文:脂肪胺N-H键的高对映选择性卡宾插入合成手性氨基酸

来源: 南开大学新闻网 发稿时间: 2019-11-23 23:44



**南开新闻网讯**(记者 马超)11月22日,国际著名期刊《Science》在线发表南开大学周其林和朱守非团队题为 "Hig hly enantioselective carbene insertion into N-H bonds of aliphatic amines" (卡宾对脂肪胺氮-氢键的高对映选择性插入反应)的研究论文。

## 解决了半个多世纪的难题

该论文报道了基于两种催化剂协同催化的卡宾高对映选择性插入脂肪胺N-H键合成手性氨基酸的策略。此项研究不仅解决了对映选择性卡宾插入反应的长期挑战,为手性氨基酸的合成提供了高效方法,而且为涉及强配位底物的过渡金属催化的不对称转化提供了潜在的通用策略。

据统计,在2016年度销售额排名前200位的处方药中,近一半含有手性胺—一种重要的分子结构单元,如镇痛药吗

## 官方微博



#### 南开大学

加关注

#南开时讯#【南开志愿者、志愿服务集体获 天津市多项表彰】近日,共青团天津市委、 天津市青年志愿者协会对在2018至2019年度 我市涌现出的青年志愿服务先进个人、集体 进行了表彰,南开大学获得多项荣誉。http:// t.cn/A6PzRZt1



20分钟前

转发 | 评论

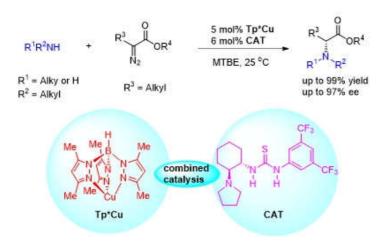
# 官方微信



## 新闻热度排行榜

鉴往知来——跟着总书记学历...

啡、曲马多, 抗抑郁药舍曲林, 抗血栓药波立维等。长期以来, 科学家们一直想找到高效的方法, 直接利用脂肪胺来合成 手性胺类化合物。但脂肪胺极易引起金属催化剂失活, 使得金属催化脂肪胺反应面临巨大挑战。周其林院士和朱守非教授 带领研究团队建立了一种新颖的双催化剂体系, 解决了这个困扰不对称催化领域半个多世纪的难题。



协同催化卡宾高对映选择性插入脂肪胺N-H键合成手性氨基酸

#### 以柔克刚

据研究人员介绍,该方法具有高达99%的产率和高达97%ee的对映选择性,并在一些药物及生物活性分子(如阿莫沙平、曲美他嗪、沃替西汀等)的衍生化中具有很好的适用性。其反应产物——手性α-氨基酸衍生物,可以作为重要的合成子用于多种手性药物的高效合成。

应用在线红外光谱技术,研究人员对此反应做了动力学测量,接着他们利用核磁共振和紫外光谱技术,证明了金属铜配合物和脂肪胺几乎不存在相互作用,而手性硫脲催化剂的硫原子与铜有较强的配位作用。他们据此认定,这是由于配体带有一个负电荷,与正一价铜结合后生成中性的铜配合物,使铜变得更"软"。根据软硬酸碱理论,它很难与较"硬"的脂肪胺作用——"以柔克刚"这是该反应能发生的关键。

### 催化组合拳

此项研究不仅解决了对映选择性卡宾插入反应的长期挑战,而且为涉及强配位底物的过渡金属催化的不对称转化提供了潜在的通用策略。

哈佛大学著名化学家埃里克·雅各布森(Eric N. Jacobsen)在同期《Science》发表了题为"A catalytic one-two pun ch(催化组合拳)"的评论文章,对该项研究进行了系统解读,并给予了高度评价。

他强调该反应的机制颠覆了手性有机催化剂常见的催化原理,使得手性氢键给体催化剂可以通过多种非共价机制促进 立体选择性的控制。

周其林和朱守非团队论文链接:

习近平考察西南联大旧址 南开大学法学院获评天津市"… 2020届"中学生英才计划"天… 科技日报:总书记来津考察调研… 校领导看望慰问老同志和院士专家 南开学子与石家庄外国语学校… 天津日报:走好走实新时代高质… 天津日报:牢记嘱托加油干不…

新华每日电讯微信公众号: 习...

https://science.sciencemag.org/content/366/6468/990

埃里克·雅各布森评论文章链接:

https://science.sciencemag.org/content/366/6468/948

编辑: 郝静秋

新闻热线: 022-23508464 022-85358737 投稿信箱: nknews@nankai.edu.cn 本网站由南开大学新闻中心设计维护 Copyright@2014 津ICP备12003308号-1 南开大学 觉悟网 校史网 BBS

版权声明: 本网站由南开大学版权所有, 如转载本网站内容, 请注明出处。