



[高级]

[首页](#) [新闻](#) [机构](#) [科研](#) [院士](#) [人才](#) [教育](#) [合作交流](#) [科学传播](#) [出版](#) [信息公开](#) [专题](#) [访谈](#) [视频](#) [会议](#) [党建](#) [文化](#)
 您现在的位置： [首页](#) > [科研](#) > [科研进展](#)

上海有机所等在手性芳香螺缩酮化合物合成与应用中获进展

文章来源：上海有机化学研究所

发布时间：2012-11-21

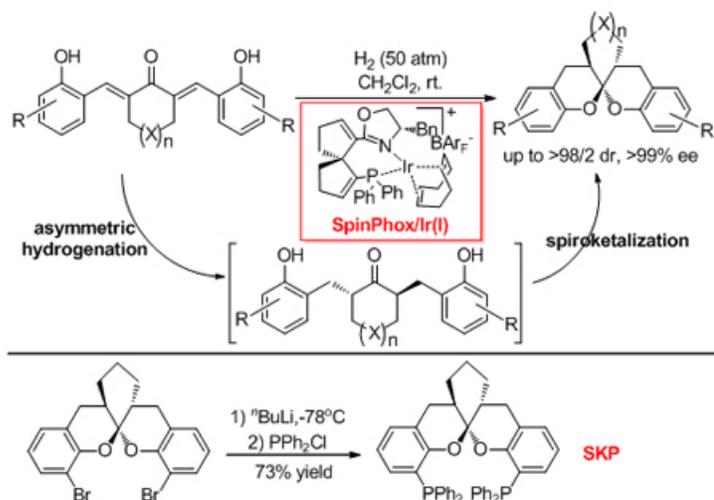
【字号：小 中 大】

手性芳香螺缩酮是一些天然产物、生物活性化合物和手性配体的重要结构单元，虽然已有一些合成方法报道，但如何直接通过催化过程对映选择性地获得手性芳香螺缩酮一直没有可行的方法。

上海有机所金属有机化学国家重点实验室丁奎岭课题组运用他们发展的SpinPhox/Iridium(I) 催化剂 (*Angew. Chem. Int. Ed.* 2009, 48, 5345-5349)，首次实现了通过 α, α' -二(2-羟基亚芳基)酮的不对称催化氢化-缩酮化反应合成芳香螺缩酮化合物的方法 (*Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 936-940)。初步研究表明，手性络合物在该反应中具有双重作用：一是催化C=C双键的不对称氢化，二是促进反应中间体的缩酮化过程。此方法已被成功地应用于芳香螺缩酮骨架的手性双膦配体 (SKP) 的合成中。该工作发表后，德国化学家Reissig教授在《德国应用化学》杂志的Highlights栏目进行了专题评述，评价这一方法为“impressive and elegant approach” (*Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 9486-9488)，并期待有新的发展。

正如Reissig教授所预期，该课题组与中科院化学所刘利课题组合作，进一步将上述方法合成的手性SKP双膦配体成功应用于Pd催化的芳香胺对Morita-Baylis-Hillman加合物的不对称烯丙基胺化反应中，以高的化学收率及优秀的区域和对映选择性得到一类 α -亚甲基- β -氨基酸衍生物，这些产物还可以方便地转化为相应的手性 β -内酰胺化合物，为多种具有潜在生理活性分子的合成提供了有效的方法。同时，该催化体系还被成功应用于手性药物依泽替米贝 (Ezetimibe) 的不对称合成中，避免了传统方法中手性辅基的使用，简化了合成步骤。相关工作发表在*Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 9276-9282上，有关成果还申请了4项中国发明专利。

上述研究工作得到国家科技部、国家自然科学基金委、中国科学院和上海市科委的资助。



打印本页

关闭本页