

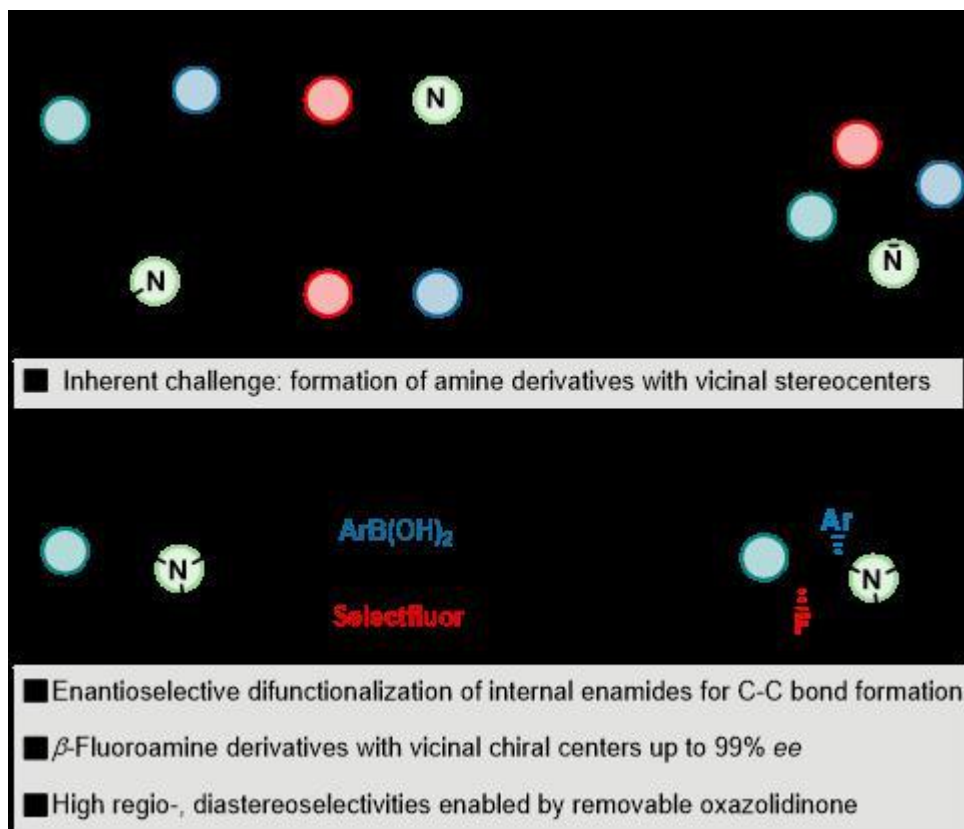
华东理工获钌催化烯酰胺的不对称双官能团化新进展

2020年12月08日

作者：陶婷婷

β -氟胺化衍生物常用作酶抑制剂、抗肿瘤和抗菌试剂，广泛应用于医药和农药等领域。近日，华东理工大学陈宜峰课题组获钌催化烯酰胺的不对称双官能团化最新进展。相关成果近期发表以“钌催化内烯酰胺区域、非对映、对映选择性1,2-氟芳基化反应”为题发表于德国《应用化学》。

手性胺衍生物是有机化学中最普遍和最有价值的骨架之一，其中含两个连续手性中心的手性胺高效构筑尤其重要。近年来，过渡金属催化的烯炔不对称碳胺化反应成为手性胺合成的重要方法之一，该策略通常适用于端烯；对于更为普遍且更为惰性的内烯而言，反应的区域选择性和非对映选择性控制变得尤为困难。在烯炔端预先引入含氮官能团，即烯胺衍生物的不对称双官能团化反应代表着另一类合成手性胺的策略。近期，烯酰胺的不对称氢化和氢官能团化已经成为手性胺衍生物的重要合成方法。因此，过渡金属催化内烯酰胺三组分对映选择性双官能化反应在构建C-C键的同时保持反应的高区域选择性、高非对映选择性具有重要的科学意义。



课题组成员以简便易得的1,2-二取代烯酰胺作为起始原料，通过钌催化的不对称1,2-芳基氟化反应，可以高区域选择性、高非对映选择性和高对映选择性的实现含有两个连续手性中心的 β -氟胺化衍生物模块化合成。作者推测，噁唑烷酮上的羰基作为导向基，诱导芳基钌物种区域选择性的迁移插入，形成稳定的苄基钌中间体，从而抑制 β -H消除的过程，随后亲电氟化试剂将苄基钌物种氧化成钌(IV)中间体，最后经历还原消除的过程即可高效地实现含有连续两个手性中心的 β -氟胺化合物的合成。

论文第一作者为华东理工大学博士研究生席洋，通讯作者为陈宜峰教授，并得到了曲景平教授的悉心指导。该工作得到了国家自然科学基金委，上海市“启明星”计划，基础科学中心、上海市重大科技专项、中央高校基本科研业务费等项目基金的支持，数据表征工作得到了华东理工大学邓卫平课题组和分析测试中心的大力支持。

原文链接：<https://doi.org/10.1002/anie.202012882>

编辑：liuchun 审核：liuchun

 沪公网安备 31010102006630号 (<http://www.beian.gov.cn/portal/registerSystemInfo?recordcode=31010102006630>)

中国互联网举报中心 (<https://www.12377.cn/>)

Copyright © 2009-2022

上海科技报社版权所有

上海科荧多媒体发展有限公司技术支持



([//bszs.conac.cn/sitename?method=show&id=5480BDAB3ADF3E3BE053012819ACCD59](http://bszs.conac.cn/sitename?method=show&id=5480BDAB3ADF3E3BE053012819ACCD59))