



您现在的位置: [首页](#) > [新闻动态](#) > [科研进展](#)

福建物构所过渡金属配合物催化手性四元环合成取得新进展

更新日期: 2024-02-08

四元碳环由于其较强的刚性骨架和独特的构象性质，是许多生物活性物质（如批准的药物和天然产物）的基本单元。其中，芳基/烷基取代的环丁烷是一个重要的亚类，许多获得专利的候选药物或药物分子衍生物都具有芳基/烷基取代环丁烷结构。近十年来，环丁烷及其衍生物的催化不对称合成得到了快速的发展，但如何以简洁、高选择性和多样化的方式获得手性四元碳环的仍极具挑战性。对预先存在的四元环底物进行对映选择性官能团化是制备手性环丁烷的高效途径，一系列四元环化合物如环丁烷、环丁烯、环丁酮、环丁烯酮和苯并环丁酮等都被广泛用于手性环丁烷的不对称合成中。然而，环丁烯二酮，一种易于获得且高度官能团化的四元环化合物，却从未成功用于催化不对称转化。究其原因，主要是环丁烯二酮具有两个活性羰基和一个双键，反应的区域选择性控制非常困难。另外，根据文献报道，环丁烯二酮很容易发生开环反应，从而生成开链或扩环产物。

中国科学院福建物质结构研究所房新强课题组致力于酮醇酯类分子的催化转化，包括二酮类分子的不对称转移氢化反应研究。近日，他们首次实现了环丁烯二酮的高区域选择性、对映选择性和非对映选择性不对称转移氢化，以较高的收率得到三种不同的四元环产物。产物可以方便地进行一系列进一步转化，从而得到多种不同骨架的四元碳环。作者同时也实现了二-, 三-和四取代生物活性分子的高效合成。机理研究和计算结果解释了反应的区域选择性来源和氢化过程的关键过渡态模型。这项工作为手性环丁烷及其衍生物的不对称合成提供了新的思路和方向，并且也解释了不对称转移氢化在区域选择性和立体选择性控制方面的应用。

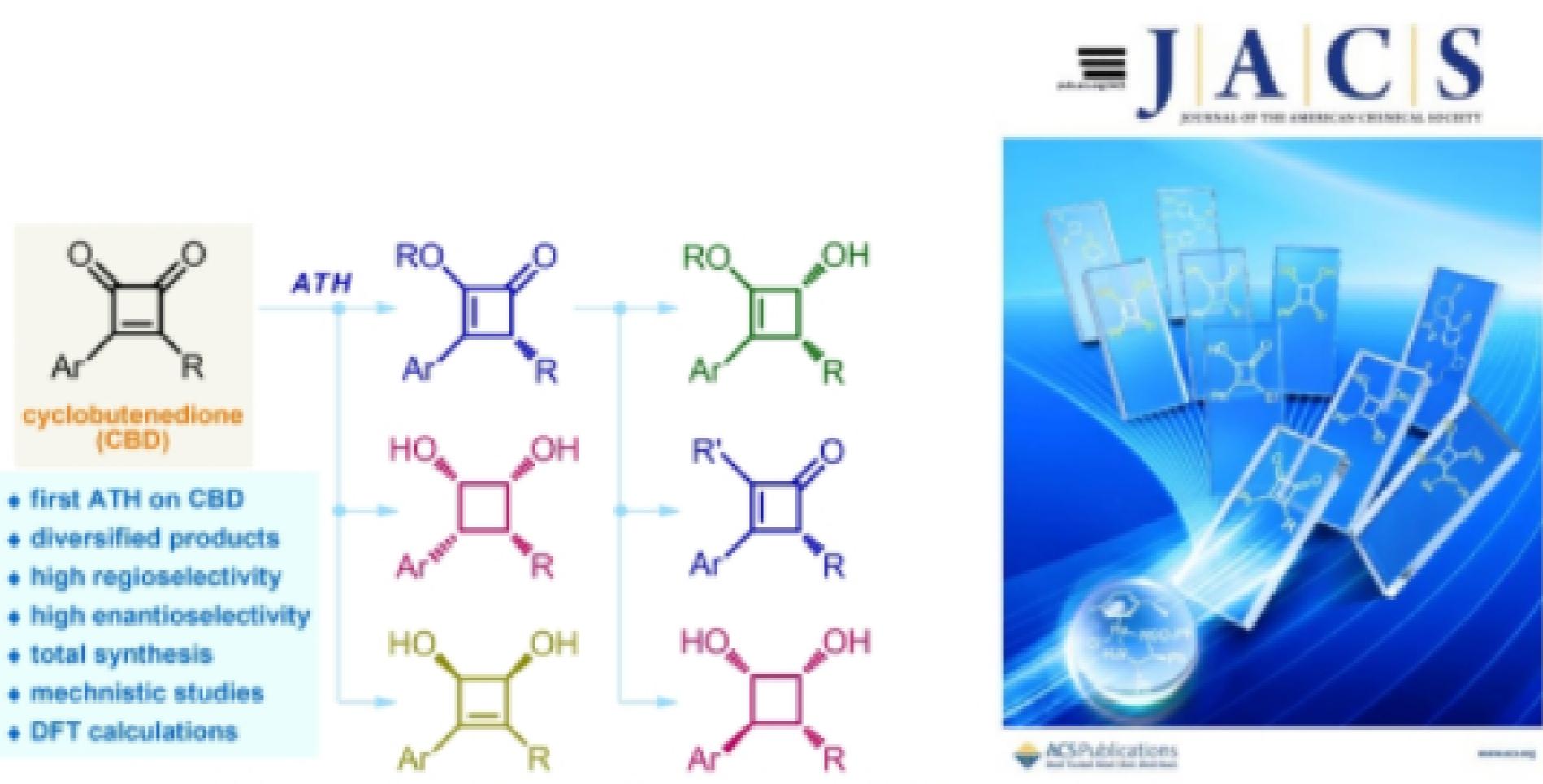


图1. 环丁烯二酮的不对称转移氢化。图片来源: *J. Am. Chem. Soc.*

相关成果于近期发表于 *J. Am. Chem. Soc.*，并受邀制作了期刊封面。博士生兰首昂和硕士生黄煌江是论文的共同第一作者，物构所房新强研究员和合肥工业大学张琪副研究员为共同通讯作者。这一工作得到了国家自然科学基金、福建省自然科学基金、中国科学院先导项目的支持。

论文链接: https://pubs.acs.org/doi/10.1021/jacs.3c14239?go_proxy=1

(房新强课题组供稿)

[上一篇: 福建物构所铝团簇玻璃研究取得新进展](#)

[下一篇: 福建物构所铜催化不对称炔-烯丙基取代反应取得新进展](#)