

广州生物院铜催化异腈的三氟甲基炔基化反应研究获进展

文章来源: 广州生物医药与健康研究院 发布时间: 2015-07-06 【字号: 小 中 大】

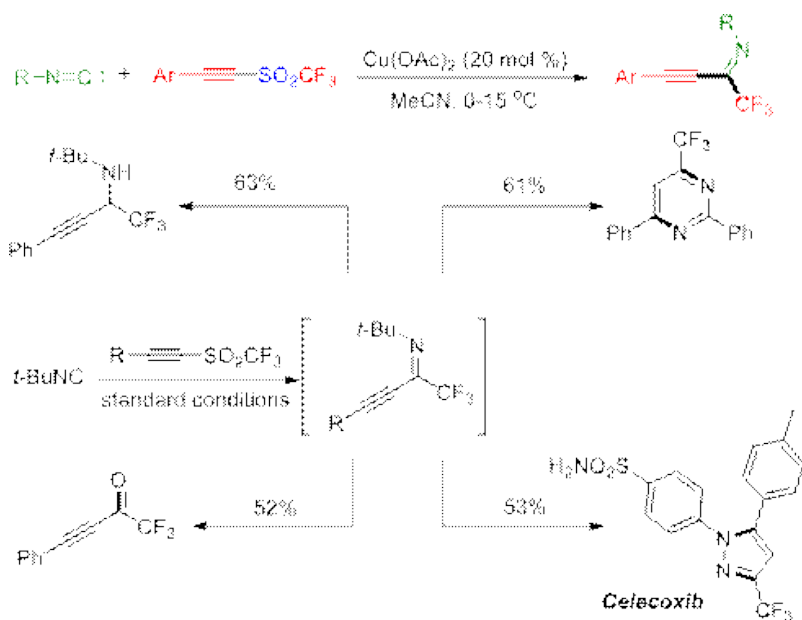
我要分享

中国科学院广州生物医药与健康研究院朱强研究组在铜催化异腈的三氟甲基炔基化反应中取得新进展, 相关研究成果于5月15日发表在美国化学会期刊《有机化学快报》上 (*Org. Lett.* 2015, 17, 2322- 2325)。

三氟甲基存在于很多生物活性分子当中, 它具有增强分子的化学与代谢稳定性、改善亲脂性以及提高与生物大分子结合的选择性等性质。因此, 在有机小分子中引入三氟甲基的合成方法受到了有机化学家和药物化学家的广泛关注。在双键相邻的两个碳原子上分别引入三氟甲基和另一官能团的反应已经有较深入的研究, 而在一个碳原子上同时引入三氟甲基和另一官能团的反应却鲜有报道。

广州生物院朱强与吴筱星合作, 设计了异腈与三氟甲基炔基的反应, 在异腈的末端碳原子上同时引入三氟甲基和炔基, 得到相应的构型单一的酮亚胺。该反应在醋酸铜的催化下, 在0到15摄氏度的条件即能顺利进行, 该方法操作简单, 条件温和, 无需其它添加剂。初步的机理研究表明, 异腈与铜盐的共同作用, 引发三氟甲基炔基裂解成三氟甲基自由基是反应的关键步骤。反应产物三氟甲基炔基亚胺具有多个反应位点, 可以进行多种类型的后续化学转化, 如还原、共轭加成、水解、缩合环化等。有些后续反应可以不经分离亚胺中间体, “一锅法”化得到结构多样性的含氟分子或杂环。例如利用该方法, 一步就可以以53%的总收率得到抗炎症药物分子Celecoxib。

该方法的建立为今后合成含三氟甲基杂环分子提供了便利途径, 在有机化学和药物化学研究中具有重要意义。该研究得到了国家自然科学基金(21202168, 21472190)的资助。



三氟甲基炔基亚胺的合成及其转化新方法

(责任编辑: 叶瑞优)


附件:

热点新闻

中科院党组2015年夏季扩大会议...

- 中科院“率先行动”计划组织实施方案
- “中国科学院科技创新年度巡展2015”在...
- 中科院与北京市海淀区领导会谈
- 中科院党组专题学习“三严三实”
- 白春礼调研大连化物所

视频推荐



【新闻联播】“率先行动”计划 领跑科技体制改革



【朝闻天下】中科院科技创新年度巡展在京开幕

专题推荐

“率先行动”计划

领航科技 创新中国

相关新闻



© 1996 - 2015 中国科学院 版权所有 京ICP备05002857号 京公网安备110402500047号 可信网站身份验证 联系我们

地址：北京市三里河路52号 邮编：100864

