



上海有机所在酰胺直接脱氧多氟芳基化研究方面取得进展

文章来源：上海有机化学研究所 | 发布时间：2022-01-16 | [【打印】](#) [【关闭】](#)

中国科学院上海有机化学研究所金属有机化学国家重点实验室王晓明课题组致力于研究多金属物种参与的反应体系，包括通过金属间电子传递、基团转移实现挑战性的转化过程和探究内在规律、仿酶的双多核金属催化剂的开发和金属团簇催化等。王晓明课题组在前期的工作中发现，在SmI₂/Sm的单电子还原体系中，芳基酰胺被活化后与芳基硼酸酯发生脱氧芳基化反应，从而生成相应的1,1-二芳基甲胺类化合物 (Angew. Chem. Int. Ed. 2021, 60, 17088–17093)。在上述研究基础上，王晓明课题组于近期实现了酰胺脱氧多氟芳基化反应，并与蓝字课题组合作，通过实验和理论计算相结合，初步阐释了反应可能的机制 (Angew. Chem. Int. Ed. 2022, 10.1002/anie.202115497)。

基于前人在挑战性的酰胺脱氧官能团化和单电子转移活化酰胺的工作，王晓明团队通过将电子转移诱导活化酰胺和多氟芳烃的直接C-H官能团化相融合，实现了芳基酰胺和多氟芳烃的脱氧交叉偶联，可以便利地合成一系列具有潜在生物活性的 α -多氟芳基胺化合物。该反应具有操作简单和官能团兼容性良好等优势，在酰胺直接脱氧合成胺的领域具有潜在的应用前景。

除了对多氟芳基试剂和芳基酰胺底物的范围进行了考察之外，作者还将该方法应用于一些药物分子的转化和合成中。从苯甲酰胺类化合物出发，该方法也可以直接合成与药物分子Buclizine和Mecilizine类似的多氟芳基胺产物。另外，廉价易得的钐粉与二碘甲烷反应可现场制备所需要的SmI₂/Sm混合液，并且可实现克级规模的反应。这些工作进一步说明所发展的方法的实用性和应用价值。

该工作得到国家自然科学基金委、上海市浦江人才计划、上海有机所以及金属有机化学国家重点实验室的大力资助。



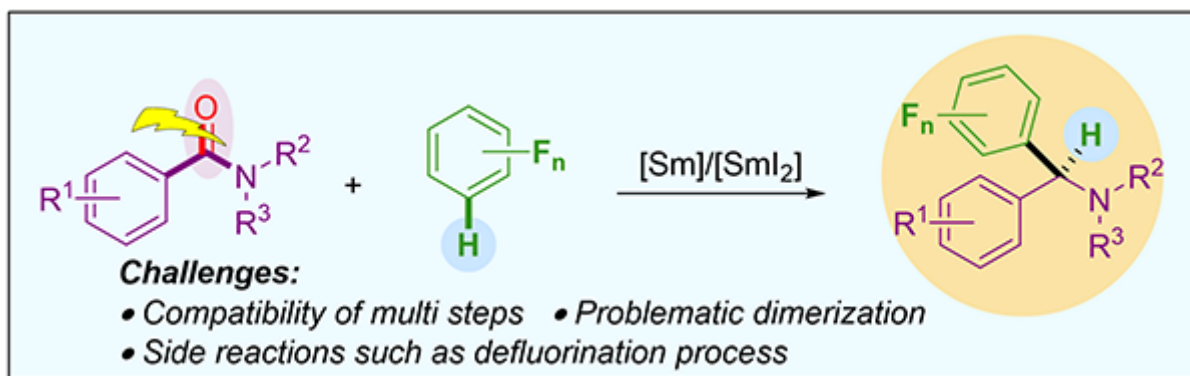


图 酰胺与多氟芳烃的直接脱氧多氟芳基化反应

版权所有 © 2016 中科院上海分院 沪ICP备 05000140号 网站标识码:bm48000030
 Copyright 2016 All Rights Reserved, Chinese Academy of Sciences Shanghai Branch



(<https://bszs.cmethod=show>)

