



作者: 李晨 来源: 中国科学报 发布时间: 2018/9/25 9:56:23

选择字号: 小 中 大

## 西安交通大学破解碳酸酯高效利用难题

■ 本报记者 李晨

碳酸酯可由环氧乙烷与二氧化碳反应生成,碳酸酯的高效利用能促进作为潜在石油碳源替代品之一的二氧化碳的化学转化,具有重要的战略意义。近日,《中国科学报》记者采访西安交通大学前沿科学技术研究院教授郭武生时了解到,他以碳酸酯及其衍生物为原料,实现了系列具有挑战性的药物分子及中间体的高效合成,拓展了碳酸酯及衍生物的化学应用,推进了多取代烯烃的立体选择性合成及烯丙基化学的发展。

烯丙胺是合成化学及药物化学中非常重要的基本单元。烯丙基亲核取代是合成烯丙胺最常用的方法。郭武生告诉记者,如何利用烯丙基化学高效构建重要的药物中间体手性 $\alpha$ -双取代烯丙胺,具有巨大挑战。同时,对于钯催化的烯丙基亲核取代反应,胺更易进攻位阻较小的烯丙基钯端位碳生成线状产物,如何引导胺进攻位阻较大的烯丙基钯同位碳是合成手性 $\alpha$ -双取代烯丙胺支状产物的关键。

于是,郭武生带领团队分别以环状、线状碳酸酯为原料,利用氢键诱导等策略,成功实现 $\alpha$ -双取代烯丙胺的不对称合成;苯酚也适用于该体系合成手性烯丙基芳香醚。烯丙基芳香胺的研究在发表当月入选JACS。美国科学院院士、日本化学会主席Hisashi Yamamoto连续两次将该系列工作作为近期研究亮点加以介绍,认为合成 $\alpha$ -双取代烯丙胺是“相当具有挑战的”,并指出郭武生用“非常简单的新方法”实现了 $\alpha$ -双取代烯丙胺的合成。

多取代烯烃片段是另一种广泛存在于天然产物及药物分子中的基本单元。如何构建立体构型单一,实现立体选择性合成多取代烯烃是该类研究的关键科学难题。作为烯烃的一类,烯丙醇是合成甘油、乙二醇、增塑剂和工程塑料的重要化工原料。研究多取代烯丙醇新骨架的立体选择性合成,不仅能促进其在工业生产中的新应用,同时也为多取代烯烃的立体可控合成提供借鉴意义。

郭武生以烯丙基环状碳酸酯为原料,利用催化脱羧形成六元环钯中间体的策略,抑制了立体异构体副产物的形成,实现了立体选择性合成多取代烯丙醇或胺。该研究被选为JACS封面重点报道,评价认为,该类反应是全合成的精巧工具,该体系适用于包括水在内的不同亲核试剂,在立体选择性合成多取代烯丙醇方面具有极强的普适性,将推动立体选择性合成多取代烯烃的发展。

同时,郭武生还观察到,胺基甲酸酯类化合物在农药和医药领域有着十分重要的应用,也可作为合成聚氨酯的单体,合成聚氨酯2017年全球产量达1800万吨。环状碳酸酯胺化是合成胺基甲酸酯的最佳途径且无废弃物生成。然而,芳香胺的亲核性较差,如何实现环状碳酸酯的芳香胺化开环生成胺基甲酸酯是尚未解决的关键科学难题。通过研究,郭武生相继合成了手性 $\alpha$ -双取代氨基酸、顺式和反式胺基甲酸酯及其衍生物,并合成了治疗T细胞淋巴瘤药物Vorinostat、肌肉松弛剂Carisoprodol、癫痫治疗药物Felbatol衍生物等药物分子。

《中国科学报》(2018-09-25 第8版 科创)

打印 发E-mail给:

以下评论只代表网友个人观点,不代表科学网观点。

目前已有0条评论

[查看所有评论](#)

需要登录后才能发表评论,请点击 [「登录」](#)

姑苏人才计划 苏州 创新团队最高奖励5千万

江南大学 2018年海内外优秀人才招聘启事

- | 相关新闻                                | 相关论文 |
|-------------------------------------|------|
| 1 从接收到在线发表仅8天 西安交大《科学》发文            |      |
| 2 第二届中国数据新闻大赛暨数据新闻教育发展高峰论坛在西安交通大学举行 |      |
| 3 西安交通大学隆重举行2018年研究生毕业典礼暨学位授予仪式     |      |
| 4 西安交大提出3D打印技术重建脊柱脊髓功能              |      |
| 5 我国在微纳尺度典型金属材料力学特性及内在机理研究国际领先      |      |
| 6 西安交大举行“科技·人文·社会”跨学科合作与交融高端论坛      |      |
| 7 纪念马克思诞辰200周年学术研讨会在西安举行            |      |
| 8 “丝绸之路大学联盟(UASR)校长论坛”在西安交大举行       |      |

图片新闻

[>>更多](#)

- | 一周新闻排行                  | 一周新闻评论排行 |
|-------------------------|----------|
| 1 美英科学家获2018年度诺贝尔化学奖    |          |
| 2 美法加三位科学家获2018诺贝尔物理学奖  |          |
| 3 诺奖启示: 关注基础科学的支撑与引领作用  |          |
| 4 掌控进化: 生命这样被改写         |          |
| 5 当我们在为陈列平鸣不平,我们应该谈些什么? |          |
| 6 陈列平与诺奖失之交臂 专家: 原因有三   |          |
| 7 今年诺奖自然科学奖“写满”两个字: 续命  |          |
| 8 18年里18人获奖,好学术环境比诺奖更重要 |          |
| 9 华人女科学家肖颖获美国“天才奖”      |          |
| 10 科技发展40年: 多项指标世界领先    |          |
- [更多>>](#)

编辑部推荐博文

- 计算方法之弱水三千
- 一文看懂期刊文献中的DOI
- 欢呼Nordhaus教授获诺贝尔经济学奖
- 是否应该将绝症诊断和预后直接告知患者?
- 探索马里亚纳型俯冲带应力状态与震级的奥秘
- 感知概率

[更多>>](#)

论坛推荐

- AP版数理物理学百科 3324页
- 物理学定律的特性 feynman
- 波恩的光学原理
- 弦论的发展史
- 时间与物理学
- 矩阵分析 霍恩 (Roger A. Horn) 著

[更多>>](#)

[关于我们](#) | [网站声明](#) | [服务条款](#) | [联系方式](#) | 中国科学报社 京ICP备07017567号-12 京公网安备110402500057号

Copyright © 2007-2018 中国科学报社 All Rights Reserved

地址: 北京市海淀区中关村南一条乙三号

电话: 010-62580783