

广州生物院高光学选择性实现铜催化Ullmann C-N偶联反应

文章来源：广州生物医药与健康研究院

发布时间：2013-08-02

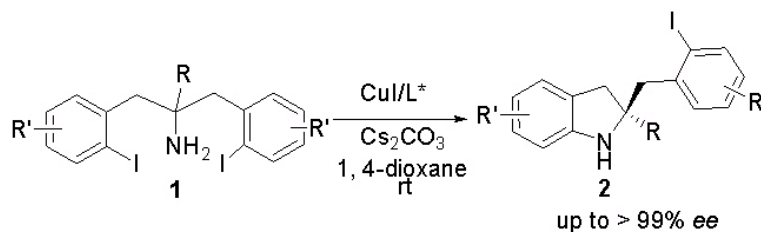
【字号：小 中 大】

铜催化的Ullmann类偶联反应是构建芳基碳杂键最为经典以及重要的方法之一，在有机合成以及药物研发中应用极为广泛。但在Ullmann类偶联反应中获得光学选择性是一个显著的挑战。在这类偶联反应一百多年的历史中，仅有一例催化的不对称反应报道。

中科院广州生物医药与健康研究院蔡倩博士课题组与南京大学俞寿云博士课题组合作，采用不对称去对称化的方法，首次高光学选择性地实现了铜催化的Ullmann C-N偶联反应。在CuI/(R)-BINOL衍生的配体作用下，1,3-二(2-碘芳基)丙-2-胺类化合物通过分子内的去对称化C-N偶联反应，可以高收率及高光学选择性地得到含叔碳或季碳手性中心的二氢吲哚产物。这一方法也同样适用于高光学选择性的合成1,2,3,4-四氢喹啉化合物。

目前该方法相关成果已经被《美国化学会杂志》接收并在线发表(*J. Am. Chem. Soc.* DOI: [10.1021/ja306631z](https://doi.org/10.1021/ja306631z))。

该项目由国家自然科学基金、国家重大新药创制专项基金和中科院“百人计划”等资助。



广州生物院高光学选择性实现铜催化的Ullmann C-N偶联反应