

钯催化烯酰胺的不对称双官能团化研究获进展

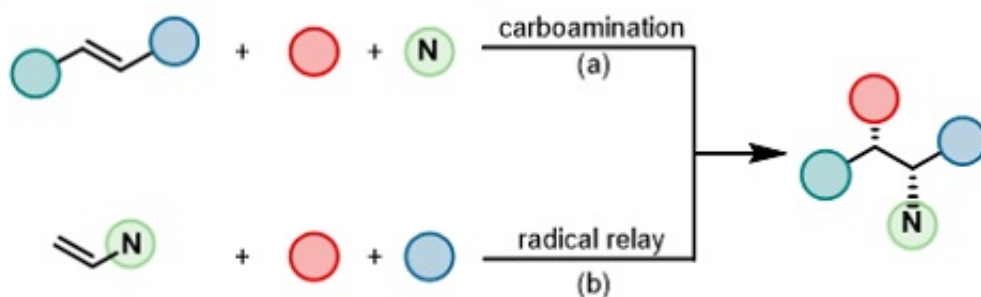
作者：writer 来源：爱科学

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/12038.html>

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

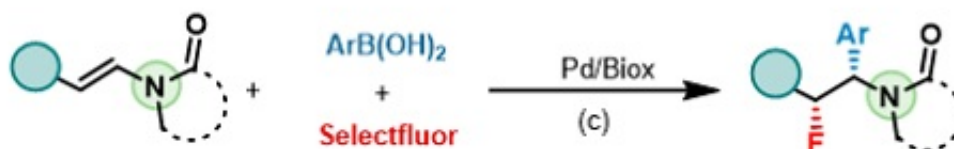
钯催化烯酰胺的不对称双官能团化研究获进展。

1) Current art of transition metal-catalyzed difunctionalization of alkenes



■ Inherent challenge: formation of amine derivatives with vicinal stereocenters

2) This work: Pd-catalyzed asymmetric arylfluorination of internal enamides



■ Enantioselective difunctionalization of internal enamides for C-C bond formation

■ β -Fluoroamine derivatives with vicinal chiral centers up to 99% ee

■ High regio-, diastereoselectivities enabled by removable oxazolidinone

β -氟胺化衍生物常用作酶抑制剂、抗肿瘤和抗菌试剂，广泛应用于医药和农药等领域。华东理工大学陈宜峰课题组在钯催化烯酰胺的不对称双官能团化研究中最新进展。相关成果近日发表于德国《应用化学》。

手性胺衍生物是有机化学中最普遍和最有价值的骨架之一，其中含两个连续手性中心的手性胺高

效构筑尤其重要。近年来，烯酰胺的不对称氢化和氢官能团化已经成为手性胺衍生物的重要合成方法。因此，过渡金属催化内烯酰胺三组分对映选择性双官能化反应在构建C – C键的同时保持反应的高区域选择性、高非对映选择性具有重要的科学意义。

研究人员以简便易得的1,2-二取代烯酰胺作为起始原料，通过钨催化的不对称1,2-芳基氟化反应，可以高区域选择性、高非对映选择性和高对映选择性的实现含有两个连续手性中心的 β -氟胺化衍生物模块化合成。研究人员推测，噁唑烷酮上的羰基作为导向基，诱导芳基钨物种区域选择性的迁移插入，形成稳定的苄基钨中间体，从而抑制 β -H消除的过程，随后亲电氟化试剂将苄基钨物种氧化成钨(IV)中间体，最后经历还原消除的过程即可高效地实现含有连续两个手性中心的 β -氟胺化合物的合成。（来源：中国科学报黄辛）

相关论文信息：<https://doi.org/10.1002/anie.202012882>

版权声明：凡本网注明来源：中国科学报、科学网、科学新闻杂志的所有作品，网站转载，请在正文上方注明来源和作者，且不得对内容作实质性改动；微信公众号、头条号等新媒体平台，转载请联系授权。邮箱：shouquan@stimes.cn。

作者：陈宜峰等 来源：《应用化学》

更多 科学进展 请访问 <https://www.iikx.com/news/progress/>

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，[爱科学iikx.com](https://www.iikx.com)转发