

中国科大在手性胺合成领域取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/12871.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！

近日，中国科学技术大学合肥微尺度物质科学国家研究中心、化学与材料科学学院教授傅尧与特任副研究员陆熹在手性胺合成领域取得进展，开发镍氢催化烯酰胺不对称氢烷基化，实现温和条件手性脂肪胺模块化合成。2月26日，相关研究成果于以Catalytic asymmetric reductive hydroalkylation of enamides and enecarbamates to chiral aliphatic amines为题，发表在《自然·通讯》上。

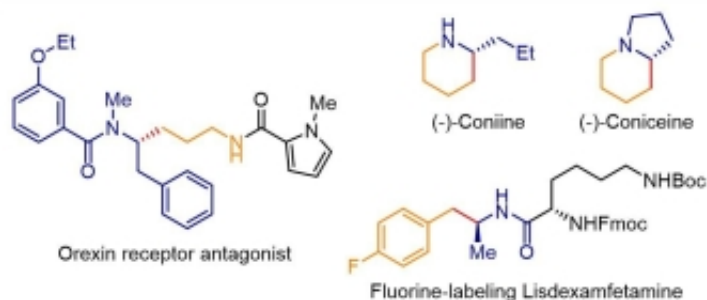
手性胺是重要的手性助剂以及医药、天然产物的关键合成中间体。2019年零售额前200名的药物中，超过三成都含有手性胺结构。高效、便捷合成手性胺化合物是有机合成化学研究的重要方向。常规催化合成手段，如亚胺/烯胺氢化、亚胺烷基化、烯烃氢胺化等，在双烷基取代手性脂肪胺合成中存在底物结构局限。

科研人员提出“烯烃还原偶联”概念，开发廉价金属镍催化体系，以烯烃替代当量金属试剂实现温和条件碳-碳偶联，简化合成步骤、丰富底物范围、提升官能团兼容性（Nat. Commun.2016,7, 11129; J. Am. Chem. Soc.2017,139, 12632; J. Am. Chem. Soc.2020,142, 214）。近期，科研人员在饱和碳偶联合成手性胺方向取得进展，成功实现镍氢催化烯酰胺不对称氢烷基化。反应使用性质稳定、易于获取的烯酰胺与烷基卤化物为原料，高对映选择性制备酰基保护的手性脂肪胺化合物，反应条件温和、底物适用范围广。反应可应用于多种天然产物、药物分子高效合成和修饰。例如，反应可以实现生物碱毒芹碱、多动症药物利地美、哮喘药物卡莫特罗等生理活性分子或其同位素标记物的高效合成。此外，反应还可实现烯酰胺与 α -硼酸酯卤化物的不对称氢烷基化，制备具有两个手性中心的 β -胺基硼酸酯。新方法串联有机含硼化合物丰富的转化，如氧化和芳基化等，将有助于开发复杂结构的胺类手性分子。

该研究展示了一种镍催化饱和碳偶联模块化合成手性脂肪胺的新策略，为含手性胺结构药物、天然产物和含氮复杂手性分子合成提供了新方法，是常规手性胺合成策略结构局限的补充与突破。中国科大化学与材料科学学院博士研究生王加旺和合肥微尺度物质科学国家研究中心博士研究生李炎为论文共同第一作者。研究工作得到国家自然科学基金委员会、中国科学院和安徽省生物洁净能源重点实验室的支持。

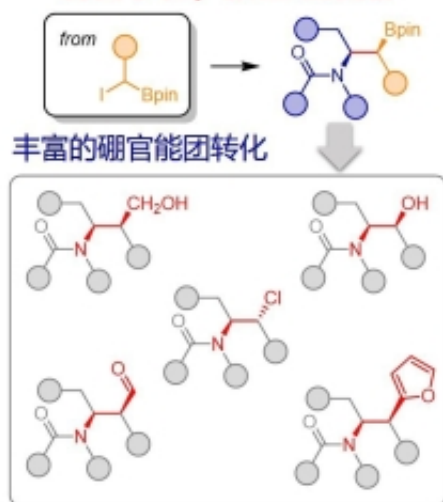
[论文链接](#)

烯酰胺还原氢烷基化制备手性脂肪胺



模块化合成手性胺药物分子

制备手性β-胺基硼酸酯



合成β-胺基醇等复杂结构手性胺

烯酰胺还原氢烷基化合成手性脂肪胺

研究团队单位：中国科学技术大学

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

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