
中国科学家实现电化学氟磺酰化反应合成 β -酮磺酰氟

作者：writer 来源：爱科学

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/16639.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！

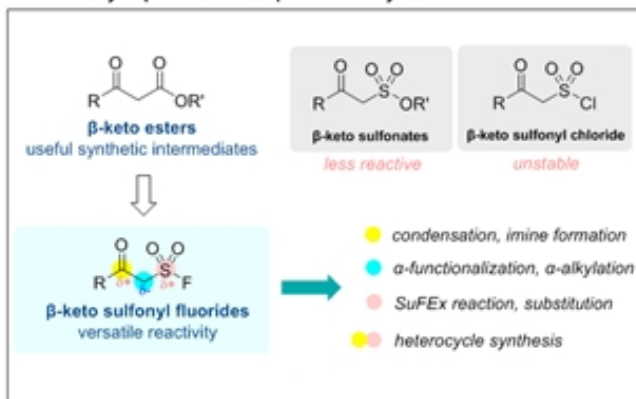
中国科学家实现电化学氟磺酰化反应合成 β -酮磺酰氟。近日，南京林业大学黄申林教授和福州大学廖赛虎教授合作首次报道了电化学氟磺酰自由基与炔烃的反应，实现了新型SuFEx合成砌块— β -酮磺酰氟类化合物的高效合成，发现了一些潜在的可用于治疗松材线虫病及杉木炭疽病的高活性分子，对相关森林病虫害防治活性分子开发具有一定的科学意义。

11月2日，该成果以Electrochemical Oxo-Fluorosulfonylation of Alkynes under Air: Facile Access to β -Keto Sulfonyl Fluorides为题，发表在Angewandte Chemie International Edition上。文章的第一作者是南京林业大学陈登峰博士，通讯作者为南京林业大学黄申林教授和福州大学廖赛虎教授。

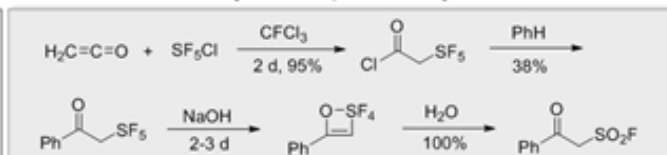
自Sharpless教授首次提出并实现六价硫氟交换反应（SuFEx）以来，这一反应已被广泛应用于有机合成、材料科学、化学生物学以及药物化学等领域，被誉为新一代的点击化学。磺酰氟类化合物的高效合成，也引起了研究人员越来越多的关注。传统合成方法中，磺酰氟类化合物需要以磺酰氯为原料，通过氯氟交换来制备。然而，磺酰氯类化合物稳定性较差、合成受限，这给新型SuFEx反应砌块的发现带来了巨大的挑战。在此背景下，研究人员发展了多种新型的磺酰氟类化合物的高效合成方法，同时也推动了SuFEx反应在化学生物学与药物科学等领域的研究。

松材线虫病被称为松木的癌症，是由松材线虫引起的一种作用于松木的毁灭性病害。近年来，我国松林受灾面积增长极为迅猛，每年都造成了非常大的经济损失。松材线虫的高效防治仍是一个亟待解决的突出问题。南京林业大学黄申林教授、黄麟教授与福州大学廖赛虎教授合作，发展了一种炔烃的电化学氧/氟磺酰双官能团化反应，构建了一系列 β -酮磺酰氟合成砌块，发现了可直接杀灭松材线虫的高活性分子。

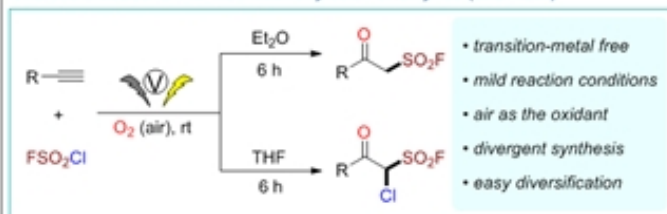
A. Reactivity of β -keto esters & β -keto sulfonyl fluorides



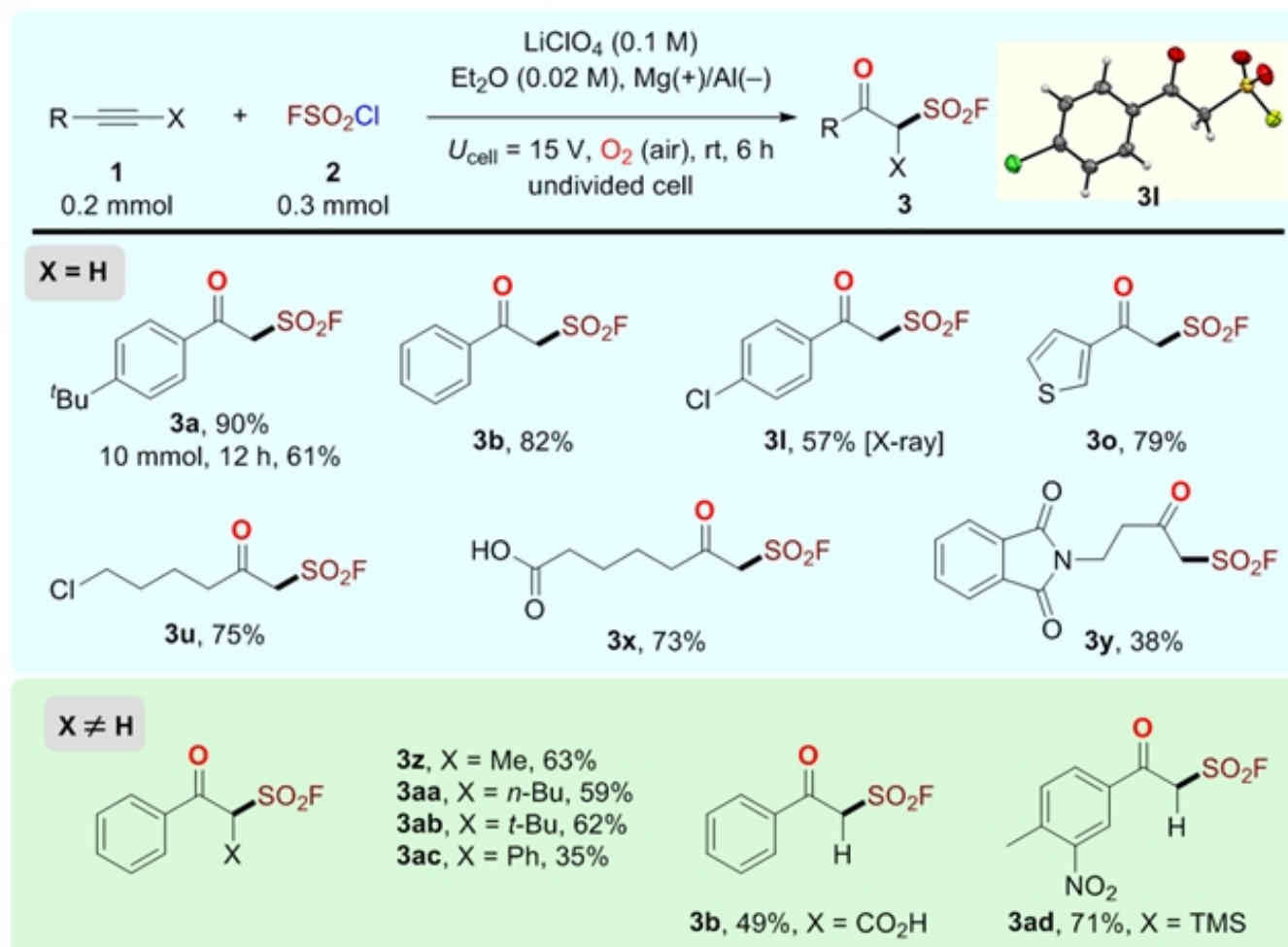
B. Known method for the synthesis of β -keto sulfonyl fluorides



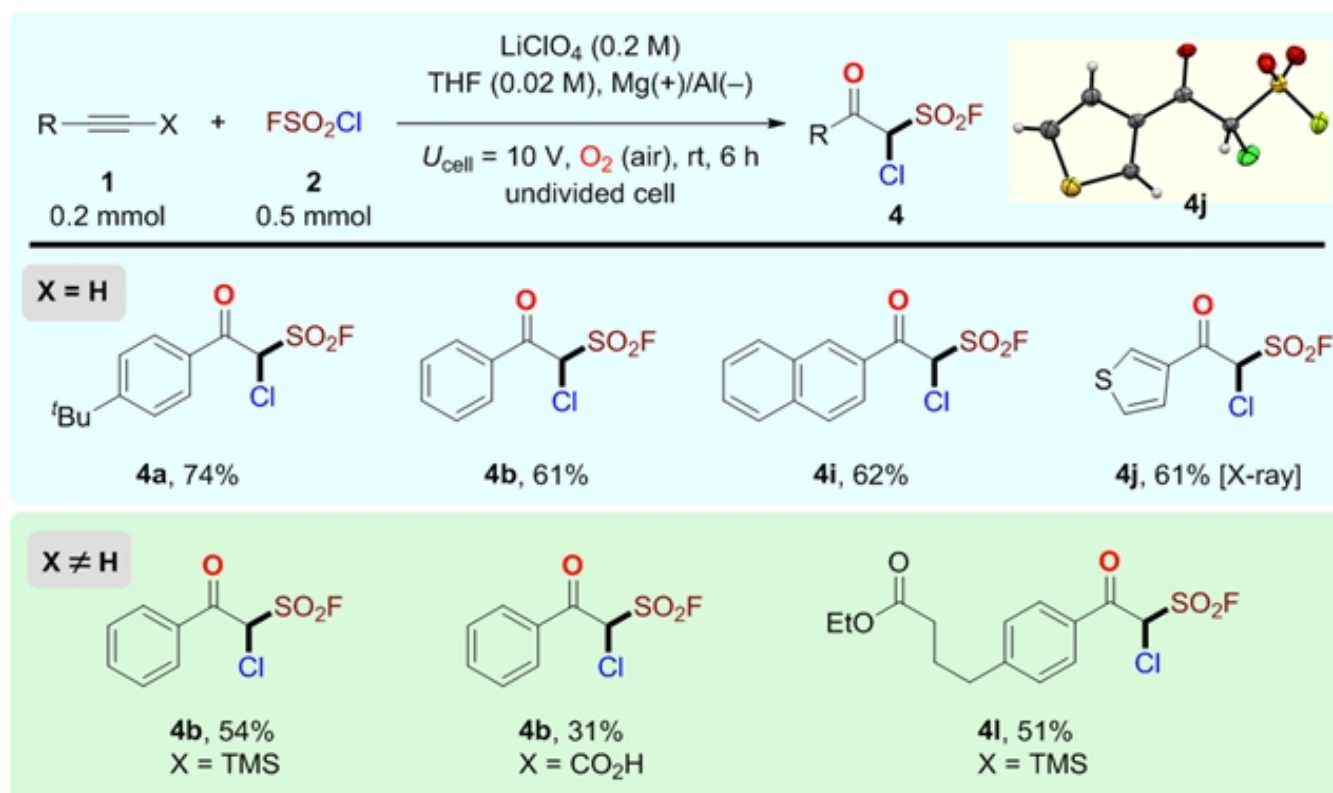
C. Electroreductive oxo-fluorosulfonylation of alkynes (this work)



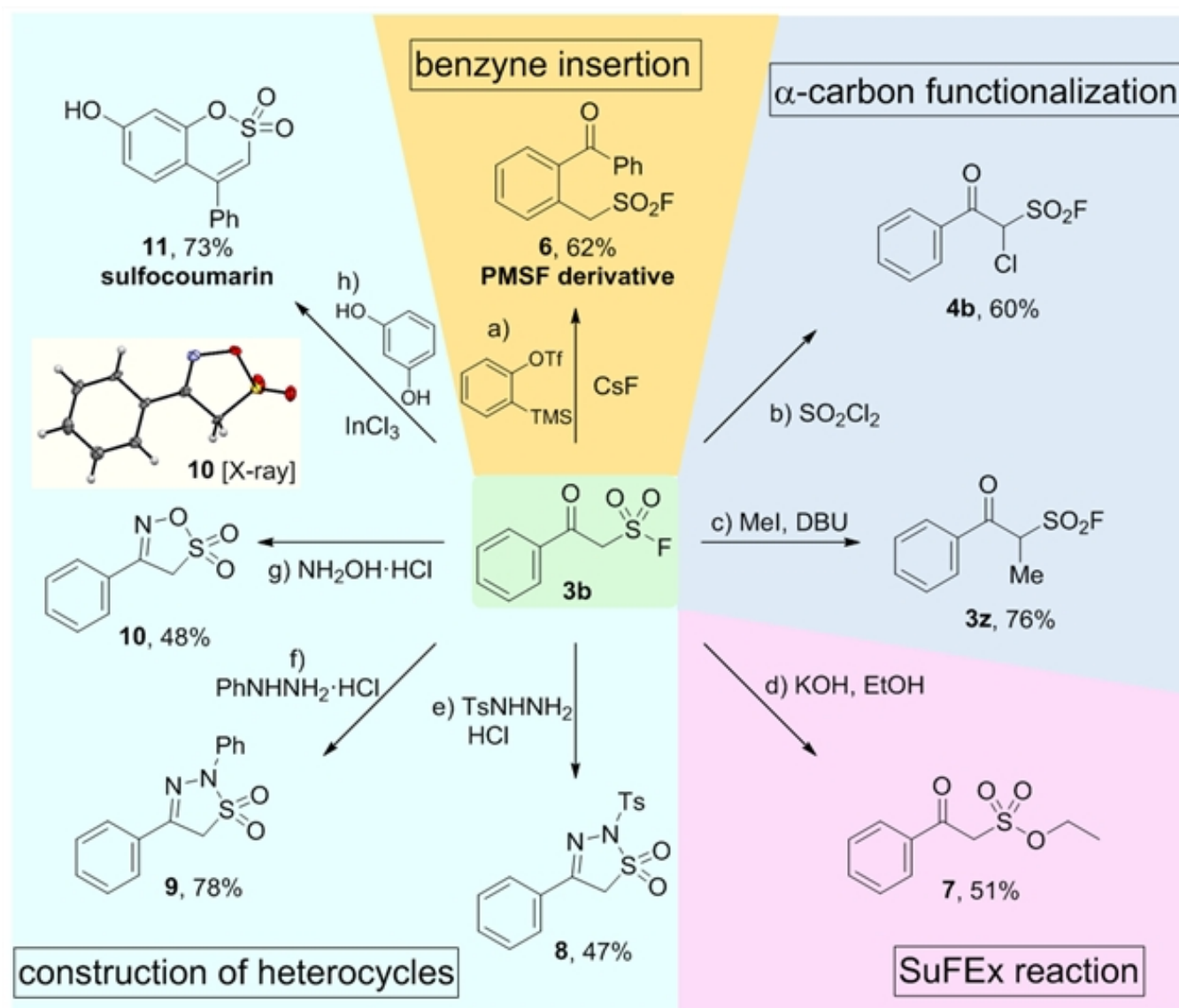
研究发现，在乙醚溶剂中，众多芳基、烷基端炔以及二取代炔烃都能顺利发生氧/氟磺酰双官能团化反应，得到双官能团化 β -酮磺酰氟产物。羧酸、酰胺等敏感基团均能顺利兼容。



在四氢呋喃溶剂中，反应产物为炔烃的三官能团化 α -氯- β -酮磺酰氟化合物。各类芳基炔烃能够较好地反应。带有可离去基团，如TMS，COOH的非端炔底物，也能够标准反应条件下得到对应的 α -氯- β -酮磺酰氟类化合物。酯基底物也能顺利地进行三官能团化反应。



随后，作者以**3b**作为模型化合物，进行了一系列后续衍生化，如 α -官能团化、SuFEx反应、杂环合成等，这都表明 β -酮磺酰氟是一类非常重要的合成砌块。通过与盐酸羟胺进行反应，能够制备一种新型的噁唑啉二氧化合物杂环骨架**10**。进一步的活性研究表明，部分化合物对松材线虫、杉木炭疽菌等危险性林业有害生物有较高的杀线和抑菌生物活性作用，具有潜在的成果转化应用前景。



在此工作中，作者首次报道了电化学氟磺酰自由基与炔烃的反应，实现了新型SuFEx合成砌块— β -酮磺酰氟类化合物的高效合成，发现了一些潜在的可用于治疗松材线虫病及杉木炭疽病的高活性分子，对相关森林病虫害防治活性分子开发具有一定的科学意义。

相关工作得到了国家自然科学基金面上项目、中国博士后科学基金项目和南京林业大学等的大力支持。（来源：科学网）

相关论文信息：<https://doi.org/10.1002/anie.202112118>

作者：黄申林等 来源：《德国应用化学》

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](http://iikx.com)转发