

有效产生芳香杂环氮自由基的新策略

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/24934.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！

有效产生芳香杂环氮自由基的新策略

氮中心自由基作为通用的有机合成中间体，已被广泛地应用在构建高价值含氮有机分子中。因此，开发新型氮自由基物种并探索其新的反应模式，长期以来一直受到合成化学家们的关注。迄今为止，大多数光催化产生的氮自由基主要集中在四种类型：酰胺氮自由基、二烷基氮自由基、氮自由基阳离子和亚胺氮自由基。然而，对于合成医药活性中间体非常重要的芳香杂环氮自由基反应性的研究相对落后，主要存在两个挑战：一、由于氮杂芳环具有芳香性，产生的芳香杂环氮自由基可能在芳环内进行离域，降低了氮自由基反应活性，同时反应区域选择性较难控制；二、不同类型的氮杂芳环性质上存在较大差异，很难利用单一的策略实现各种芳香杂环氮自由基的构建。因此，如何高效产生种类多样的芳香杂环氮自由基长期以来一直是一个重要的挑战。

近日，国科大杭州高等研究院张夏衡课题组在化学领域权威期刊《德国应用化学》发表了一篇题为Generation of Aromatic N-Heterocyclic Radicals for Functionalization of Unactivated Alkenes的研究成果。该研究利用吡啶盐作为芳香杂环氮自由基前体，在光促条件下，通过能量转移方式，发展了一种高效产生各类芳香杂环氮自由基的新策略，并成功地将其应用于对非活化烯烃的氢胺化反应。

该研究还进一步利用了二硫化物和溴丙二酸二乙酯作为自由基猝灭剂，实现了非活化烯烃的多样性双官能团化，包括硫胺化和溴胺化，可快速合成功能化的杂环胺骨架。此外，作者对溴胺化产物进行了一些应用转化。利用可见光氧化还原的条件，实现了烷基溴的烷基化、酰基化、芳基化和三氟甲基化反应，而且产物的对映选择性有了明显提升，进一步丰富了胺化产物的结构。

该工作不仅为芳香杂环氮自由基的产生和应用提供了新思路，也为从廉价易得的非活化烯烃出发快速构建生物医药领域重要的含氮杂环骨架提供了新视角。

相关论文信息：

<https://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/anie.202314312>

特别声明：本文转载仅仅是出于传播信息的需要，并不意味着代表本网站观点或证实其内容的真实性；如其他媒体、网站或个人从本网站转载使用，须保留本网站注明的“来源”，并自负版权等法律责任；作者如果不希望被转载或者联系转载稿费事宜，请与我们联系。

来源：《德国应用化学》

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

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