

C-H金属化及不对称偶联反应研究取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/41536.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！

C-H金属化及不对称偶联反应研究取得进展

在有机合成中，构建手性C(sp³)中心是药物化学和天然产物合成的核心任务。传统C-H金属化及立体专一性交叉偶联策略常受限于导向基团的使用及化学计量的手性源，缺乏普适的催化不对称版本。如何利用消旋原料实现高对映选择性的C(sp²)-C(sp³)偶联，是该领域长期面临的挑战。

近日，中国科学院上海有机化学

研究所科研团队提出了一种C(sp³)-H金属化及对映选择性Negishi偶联策略。

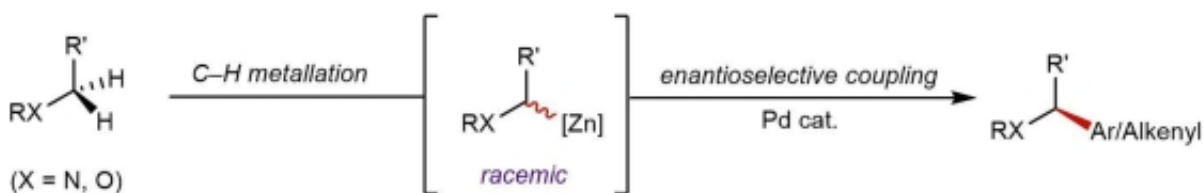
研究采用

催化量的手性卡宾或膦配位的钯络合物，实现了环状及链状胺和醚类底物的高对映选择性α-芳基化与烯基化反应。机理研究表明，胺与醚的α-芳基化反应分别经由动力学拆分与动态动力学拆分途径实现手性控制。该策略官能团兼容性优异，可适用于复杂药物分子的后期修饰，并应用于手性配体与生物活性分子的简洁合成。

相关研究成果发表在《自然-合成》(Nature

Synthesis)上。研究工作得到国家自然科学基金委员会、中国科学院等的支持。

[论文链接](#)



Challenges:

- ♦ Low reactivity of secondary alkylzinc reagent
- ♦ Undesired β-H elimination
- ♦ Efficient control of enantioselectivity

Highlights:

- ♦ Enantioselective C(sp³)-C(sp²) cross-coupling
- ♦ >140 examples, excellent heterocycles compatibility
- ♦ Up to 99% yield, up to >99% e.e.

C(sp³)-H金属化/对映选择性Negishi偶联策略

研究团队单位：上海有机化学研究所

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