

兰州化物所在环丙烷的不对称碳氢键硼化方面获进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/5734.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！

兰州化物所在环丙烷的不对称碳氢键硼化方面获进展。光学活性的环丙烷类化合物广泛存在于天然产物中，在有机合成、药物化学和催化材料等方面有着重要的应用价值。其中，环丙烷基硼酸由于能够利用碳硼键的立体专一性反应实现产物的多样性而受到了越来越多的关注。目前合成此类化合物的方法大多需要对底物进行预先活化，从而引起额外的操作步骤和更多试剂与溶剂的消耗。因此，发展步骤和原子经济的催化不对称方法将对这一领域的发展起到重要的推动作用。

中国科学院兰州化学物理研究所羰基合成与选择氧化国家重点实验室徐森苗团队一直致力于过渡金属催化的区域和立体选择性硼化反应研究(Org. Lett. 2017, 19, 3676; Chem. Sci. 2018, 9, 5855; J. Am. Chem. Soc. 2019, 141, 5334; Angew. Chem. Int. Ed. 2019, 58, 8187)。尤其在不对称碳氢键硼化方面，他们发展了一类新型的手性双齿硼基配体并首次实现了配位基团导向的二芳基甲基胺的C(sp²)-H键的不对称硼化(J. Am. Chem. Soc. 2019, 141, 5334)。

最近，他们利用改进的手性双齿硼基配体首次实现了过渡金属铈催化的环丙烷类化合物的C(sp³)-H键的不对称硼化反应(图1)。他们以环丙基甲酰胺为底物，利用手性硼基配体L，实现了铈催化的不对称C(sp³)-H键硼化反应，产物的最高ee值可达96%，且具有非常广谱的官能团兼容性，并通过单晶确定了产物的绝对构型。同时，这一方法也能够应用于一些连有环丙环的生物活性分子的后期修饰。

研究人员对所得产物的碳硼键的转化也进行了研究，合成了治疗抗抑郁的药物分子左旋米那普仑(图2)，提出了可能的反应机理，并对映选择性的控制因素进行了解释(图3)。

相关成果在线发表在《美国化学会志》(J. Am. Chem. Soc)上。以上工作得到国家自然科学基金、江苏省自然科学基金、兰州化物所、羰基合成与选择氧化国家重点实验室和杭州师范大学有机硅化学及材料技术教育部重点实验室的支持。

图2 产物的应用

图3 可能的反应机理

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