

上海有机所在镍催化吡啶选择性C-H官能团化反应方面取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

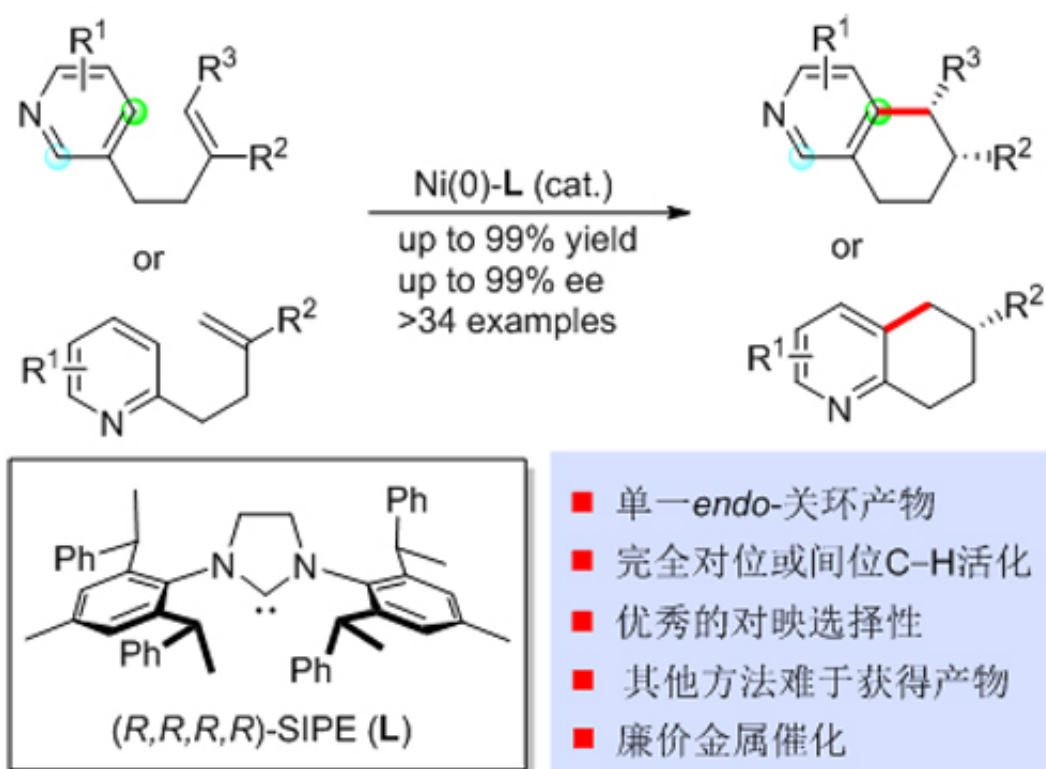
本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/6454.html>

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！

上海有机所在镍催化吡啶选择性C-H官能团化反应方面取得进展。吡啶是一类重要的杂环，广泛存在于药物和活性天然产物分子中。据FDA统计，吡啶是药物分子中出现最多的含氮芳环。此外，吡啶是一种重要的合成中间体以及配体设计的重要结构单元。因此，对吡啶类化合物构建和修饰方法的研究具有重要意义。其中，吡啶的不对称C-H键官能团化是合成手性吡啶类化合物最直接的方法，具备高度的原子经济性和步骤经济性。但目前该方面的研究鲜有报道，主要难点在于缺乏能同时控制活性和选择性的配体。

中国科学院上海有机化学研究所金属有机化学国家重点实验室施世良课题组一直致力于发展新型手性氮杂环卡宾(NHC)配体，相继报道了系列新型大位阻手性NHC配体，例如ANIPE和SIPE等，并应用于铜催化 α -烯烃不对称马氏氢硼化反应(Angew. Chem. Int. Ed, 2018, 57, 1376)和镍催化醇和炔烃偶联制备手性烯丙醇的反应中(ACS Catal, 2019, 9, 1)。近期，他们利用这类大位阻强给电的NHC配体实现了首例镍催化吡啶区域和对映选择性C-H环化反应(J. Am. Chem. Soc, 2019, 141, 5628 见下图)，快速构建了高对映选择性的5,6,7,8-四氢喹啉和5,6,7,8-四氢异喹啉类化合物(高达99%收率和99% ee)。该方法具有较好的底物适用性和官能团兼容性。利用吡啶间位烯烃取代的底物可得到专一的对位endo-关环产物，吡啶邻位或对位取代的烯烃底物可得到间位endo-关环产物。反应对于诸如酯基、带有活泼氢的酰胺等官能团和苯并呋喃、吲哚、吗啉、吡咯等杂环具有很好的兼容性。反应适用于1,1-二取代烯烃、苯乙烯、共轭二烯和三取代烯烃等。值得一提的是，通过其他方法例如发展完善的不对称催化氢化反应，很难获得该类手性杂环化合物。该研究作为吡啶的直接不对称官能团化提供了新方法，也拓展了廉价金属催化的不对称C-H活化反应范围。

上述研究得到国家自然科学基金委、中科院战略性先导科技专项(B类)、金属有机化学国家重点实验室的资助。



镍催化吡啶区域和对映选择性C-H环化反应

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