

兰州化物所在新型胺化试剂的开发方面取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/7613.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！

有机硼化合物被广泛应用于合成化学各个领域，是重要的有机合成中间体，C-B键可以转化成C-O，C-C，C-X等重要的化学键。其中，有机硼化合物的胺化反应具有重要的应用价值。传统的人名反应Chan-Lam偶联是实现有机硼化合物胺化的一种重要手段。但是该类反应需要用到当量铜盐或者催化量铜盐在氧化剂作用下实现有机硼化合物的胺化。使用两亲的胺化试剂通过简单的1,2-迁移实现有机硼化合物的胺化反应因其无需金属催化剂、高立体专一性而一直受到人们的广泛关注，但是目前都是使用氮氯、烷基叠氮或者羟胺衍生物等高活性化合物做胺化试剂，这类胺化试剂不易保存、稳定性差，且主要实现高活性的有机硼化合物的胺化。而有机频哪醇硼酸酯越来越多的合成出来并应用于新物质构建中。其胺化反应一直以来都具有很大的挑战。因此，发展新型的胺化试剂实现活性较低的硼酸酯类化合物的胺化反应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研究员刘超团队自2015年成立以来一直致力于基于羰基化合物转化的有机硼化合物合成与应用研究，并取得了一系列研究成果（[Angew. Chem., Int. Ed. 2019, 58, 15813](#)；[Angew. Chem., Int. Ed. 2018, 57, 5501](#)；[Angew. Chem., Int. Ed. 2018, 57, 10318](#)；[J. Am. Chem. Soc. 2017, 139, 5257](#)；[Chem. Commun. 2019, 55, 11884](#)；[Org. Chem. Front. 2019, 6, 900](#)；[Chin. J. Catal. 2018, 39, 1725](#)）。其团队目前为止利用羰基化合物的转化已经合成超过三百个有机硼酸酯类化合物。

最近，

他们团队与浙

江工业大学教授靳立群合作

成功发展了以DABCO的氨基季铵盐（H₂N-DABCO）作为新型胺化试剂并首次将该胺化试剂用于有机频哪醇硼酸酯的胺化反应中（下图）。产率最高可达96%，且反应具有立体专一性、广谱的官能团兼容性等。

该胺化试剂容易合成，易于保存，该胺化方法底物兼容性广，不仅可以完成简单的一级、二级、三级烷基硼酸酯的胺化、1,2-二硼类化合物也可以高效地转化成二胺化合物。对于芳香硼酸酯类化合物也可以顺利地转化成芳香胺类化合物。该方法操作简单，无需过渡金属催化剂，能够将有机硼化合物高效地转化成胺类化合物，为有机硼酸酯的胺化反应提供了新的试剂选择。

该研究成果近期发表在《德国应用化学》（X. Liu⁺, Q. Zhu⁺, D. Chen, L. Wang, L. Jin^{*}, C. Liu^{*}, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2019, doi: 10.1002/anie.201913388）上。

以上工作得到国家自然科学基金、中国化学会青年人才托举工程项目、中科院青年促进会、江苏

省自然科学基金以及羰基合成与选择氧化国家重点实验室的长期支持。

[论文链接](#)

兰州化物所在新型胺化试剂的开发方面取得进展

研究团队单位：兰州化学物理研究所

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](http://www.iikx.com)转发