



上海有机所在惰性酰胺的直接脱氧锆基化反应研究方面取得进展

文章来源：上海有机化学研究所 | 发布时间：2022-11-01 | [【打印】](#) [【关闭】](#)

近年来，有机硅化合物引起了化学家们的广泛关注。然而，同为同族元素的锆的研究则相对较少。相比于硅原子与碳原子，锆原子具有更强的正电性、更大的原子半径与更强的疏水作用，因此向有机化合物中引入锆原子会导致独特的化学与药理学性质，具有潜在价值。结合胺类化合物的重要性，如何在含氮单元上引入锆原子，是富有学术意义和研究价值的课题。

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王晓明课题组致力于双多核金属催化和脱氧官能团化反应研究。近年来王晓明课题组发展了多金属介导的单电子还原策略，将酰胺转化为 α -氨基卡宾中间体，实现了酰胺脱氧芳基化与脱氧多氟芳基化反应 (*Angew. Chem. Int. Ed.* 2021, 60, 17088–17093; *Angew. Chem. Int. Ed.* 2022, 61, e202115497)。近期，他们进一步发展了这一体系，成功实现了Mg/Sml₂促进的酰胺与锆氢化合物的脱氧锆基化反应 (*Cell Rep. Phys. Sci.* 2022, 10.1016/j.xcrp.2022.101116)。该反应原料易得，条件温和，具有广泛的底物适用范围，可以很方便地制备 α -锆基胺类化合物 (图1)。结合实验和薛小松研究员课题组合作展开的理论计算，初步推测，惰性酰胺首先生成了 α -氨基卡宾中间体，随后发生协同的锆氢键插入过程得到最终的产物。

Mg/Sml₂ promoted deoxygenative germylation of aromatic amides via α -aminocarbene

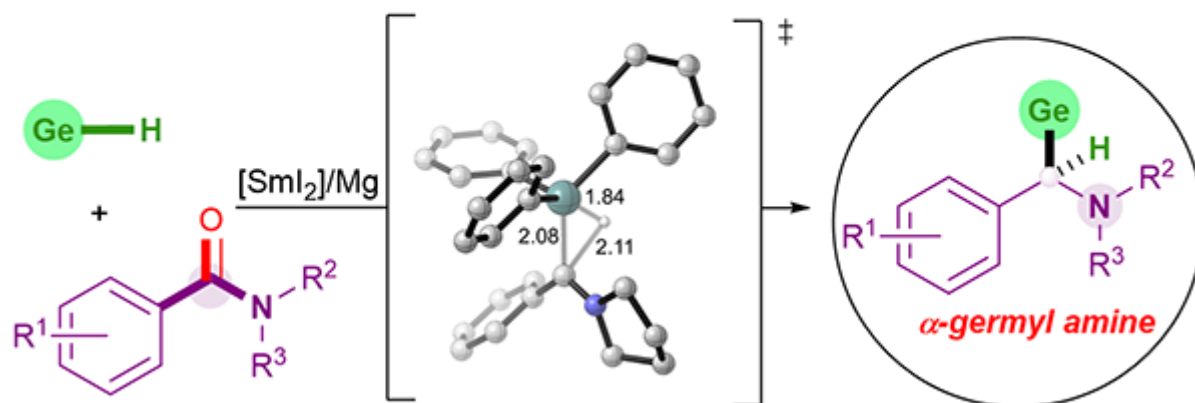


图1 酰胺与锗氢的直接脱氧锗基化反应

除了对芳基酰胺底物和锗氢底物的范围进行了考察之外，作者还将该方法应用于一些药物分子衍生的酰胺的转化中，结果表明该反应可有效兼容一些复杂药物分子结构，进一步证实了所发展方法的实用性和应用价值（图2）。

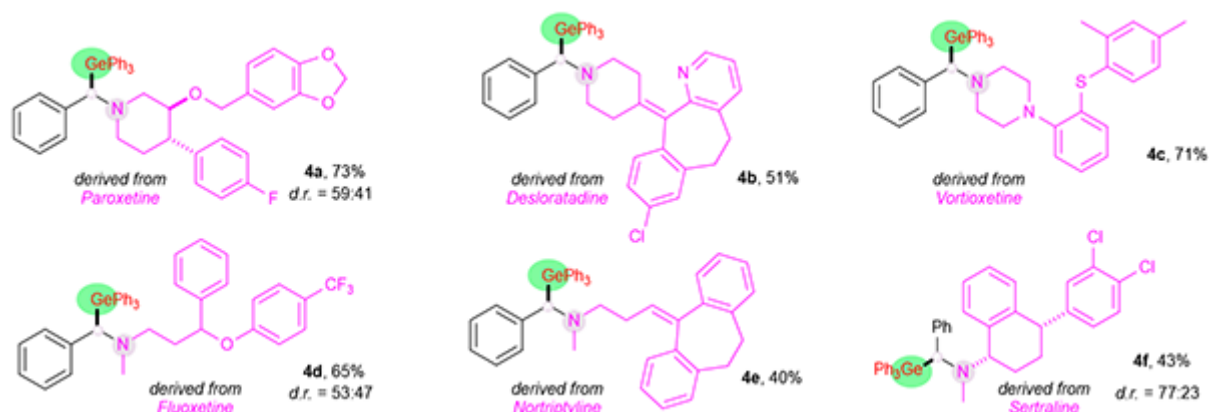


图2 复杂分子衍生物的脱氧锗基化

2019级博士生王宇霄为该论文的第一作者，王晓明研究员与薛小松研究员为共同通讯作者。该研究受国家自然科学基金委、中国科学院、上海有机所以及金属有机化学国家重点实验室资助。