

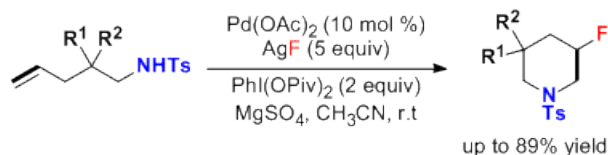


钯催化烯烃分子内的氟胺化反应工作新进展

文章来源: 上海有机化学研究所

发布时间: 2009-12-30

【字号: 小 中 大】



美国化学会志 (*J. Am. Chem. Soc.*, 2009, 131, 16354) 近日刊登了中国科学院上海有机化学研究所在金属催化氟化方面取得的工作进展。

含氟有机化合物由于其独特的性质, 被广泛的使用于材料科学和生命科学中, 尤其是在农药和医药领域, 氟原子的引入使得有机分子的电性改变导致其亲脂性提高, 增加了药物的生物穿透性, 提高含氟药物与目标靶点的选择性相互作用, 从而达到提高药效的目的。但是, 目前含氟有机化合物的制备往往反应条件比较苛刻, 使用一些价格昂贵或极具危险的氟化试剂, 因此, 在温和条件下高效、高选择性地对有机化合物的氟化一直是一个挑战性的难题。

上海有机所的刘国生和吴涛等研究人员首次发现在钯的催化下, 利用AgF作为氟源, PhI(OPiv)₂为氧化剂, 可以实现烯烃的分子内的氟胺化反应。该反应以很好的化学选择性和区域选择性得到含氟的六元含氮杂环, 这类化合物目前被广泛应用于药物化学的研究中。而且值得注意的是该反应在室温下进行就可以得到80%以上的收率。在进一步的研究中发现, 该反应是通过Pd(IV)的中间体, 最后主要是通过直接还原消除的方式得到构型保持的C-F键。与其他含氟氮杂环的合成方法相比, 该反应具有简单、高效、选择性好等特点。同时, 该反应的发现为进一步探讨金属催化剂与氟化试剂的相互作用提供了重要的理论基础。

打印本页

关闭本页