

广州生物院有机小分子催化的不对称合成方法学研究获进展

中国科学院广州生物医药与健康研究院胡文辉研究组在手性磷酸催化的C3-位取代的吲哚与b,g-不饱和- α -酮亚胺酯的C2不对称傅-克烷基化反应方面取得新进展，相关研究成果已于1月16日在线发表在《有机化学通讯》(Organic Letters, DOI: 10.1021/ol5035222)。

含吲哚环系类化合物是天然产物中分布最广的化合物系列之一，很多药物分子和生物活性分子均含有吲哚结构单元。不对称傅-克烷基化反应是合成光学活性的吲哚类衍生物的最常用方法。

但由于吲哚C3位亲核活性明显高于其它位置，因此现有的吲哚衍生化反应大多集中在吲哚的C3位进行，活性相对较低的C2位官能化反应研究较少，合成方法的局限严重影响了此类化合物在天然产物合成和药理活性研究等方面的应用。该团队利用BINOL衍生的手性磷酸为催化剂，成功实现了C3取代的吲哚与b,g-不饱和- α -酮亚胺酯的C2不对称傅-克烷基化反应，高对映选择性的合成了一系列吲哚C2官能化的光活性化合物。更重要的是，反应产物可以经过衍生合成一系列含有吲哚结构非天然 α -氨基酸类化合物，对有机合成化学及药物化学都有重要的意义。

该研究得到了国家自然科学基金（21102145）和广州市科信局“珠江科技新星”（2012J2200014）的资助。

原文地址：<http://www.china-nengyuan.com/tech/72666.html>