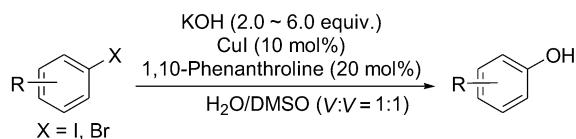


• 亮点介绍 •

铜催化芳基卤的羟基化反应: 酚类、芳基醚和苯并呋喃的合成

Angew. Chem. Int. Ed. **2009**, *48*, 8729~8732

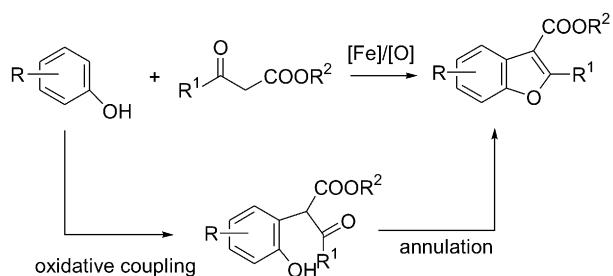
酚类化合物不仅是药物、聚合物单体和天然产物中的一类重要结构单元, 而且作为一种通用的有机合成中间体广泛应用于含氧杂环的合成中。因此, 寻找高效的酚类化合物的合成方法一直备受关注。如何在温和的条件下实现芳基卤代物的羟基化反应是一个挑战。尽管目前已发展一些催化体系用于芳基卤代物到酚类化合物的转换, 但依然存在使用价格昂贵的钯源和对空气敏感的膦配体作催化剂等缺点。四川大学化学学院游劲松课题组利用价格低廉的铜盐和邻二氮菲作为催化剂, 在温和的条件下, 成功实现了芳基卤至酚类化合物的转化, 同时作者还利用该方法成功构筑了一步合成芳基烷基醚以及苯并呋喃类化合物的串联反应。本方法不仅具有操作简单、高效、官能团容忍性强等特点, 而且为芳基烷基醚以及苯并呋喃类化合物的合成提供了一种补充方法, 为酚类及其衍生物的合成提供了一种实用而有效的合成策略, 因此具有广泛的应用前景。



铁催化氧化偶联-环化反应: 苯并呋喃衍生物的合成新方法

J. Am. Chem. Soc. **2009**, *131*, 17387~17393

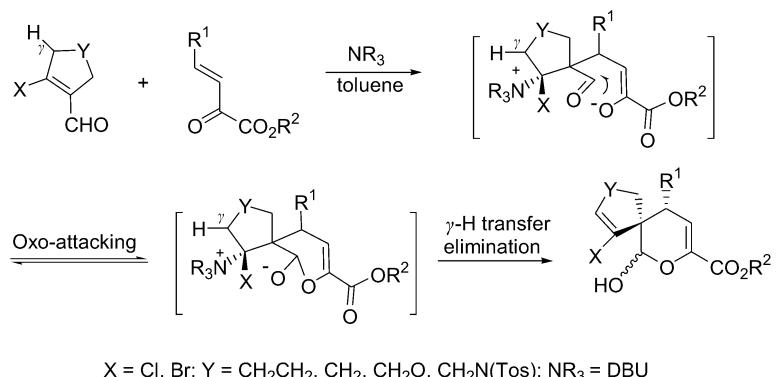
苯并呋喃是一种重要的具有生物活性的结构单元, 因此, 探索从简单易得的原料构筑苯并呋喃骨架的新途径新方法是一项具有重要意义的研究课题。中国人民大学李志平研究小组围绕“非活泼化学键的氧化活化”的研究思路和理念, 开展了系列研究工作。最近研究结果证实, 在水合三氯化铁为催化剂和有机过氧化物为氧化剂的条件下, 通过简单的苯酚和1,3-二羰基化合物可以高效高选择性地合成苯并呋喃衍生物。反应机理研究表明, 苯酚衍生物与1,3-二羰基化合物首先选择地发生分子间C—H键的氧化偶联形成C—C键, 进一步分子内脱水形成苯并呋喃衍生物。该研究成果表明, 在氧化条件下, 有机化学反应可以表现出与经典的有机化学反应不同的反应性质和途径, 为进一步探索铁催化剂在非活泼化学键氧化活化的研究领域提供了重要的理论依据和应用价值。



叔胺参与的串联 Rauhut-Currier/Acetalization 反应： 官能化螺-3,4-二氢吡喃的形成

Angew. Chem. Int. Ed. **2009**, 48, 9713~9716

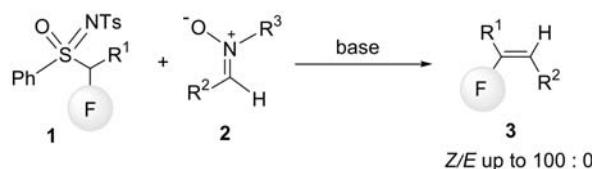
Rauhut-Currier (RC)反应，又称乙烯基型 Morita-Baylis-Hillman (MBH)反应，是指两个缺电子烯烃分别作为烯醇化物和 Michael 受体进行的交叉偶联反应。由于存在两个活泼烯烃选择性控制困难、反应中间体不稳定等挑战性问题，分子间交叉 RC 反应一直是有机合成中的难点之一。浙江大学化学系马成等报道了一个 RC 反应触发的新串联过程，在三级胺的作用下，环状 β -卤代烯醛与 β,γ -不饱和酮酸酯通过 Rauhut-Currier/Acetalization 反应，利用醛基捕获 RC 反应的中间体，同时发生 γ -H 迁移，高选择性地实现了多个化学键的形成，非对映体选择性地得到官能化的螺-3,4-二氢吡喃结构。



利用 α -氟代亚砜亚胺和硝酮高立体选择性合成单氟烯烃

Angew. Chem. Int. Ed. **2009**, 48, 9858~9861

近年来，单氟烯烃在药物化学领域得到了广泛关注。单氟烯烃骨架在电荷分布与偶极距性质上与酰胺结构相近，但前者比后者具有更好的水解稳定性，因此单氟烯烃单元作为仿酰胺结构，常被用于仿肽类蛋白酶抑制剂类药物中。但是，目前已知单氟烯烃的合成方法一般顺/反选择性较差，再加上单氟烯烃顺/反异构体之间的分离一般比较困难，因此要得到单一顺式或反式构型的单氟烯烃是一项难度较大的合成挑战。最近，中国科学院上海有机化学研究所胡金波等发展出了一种高立体选择性合成单氟烯烃的新方法。他们利用 α -氟代亚砜亚胺 **1** 与简单硝酮 **2** 在碱的作用下发生反应，一步得到单氟烯烃 **3**，顺/反选择性可以高达 100 : 0。这一方法的优点是原料易得、操作简便、产物立体选择性高。鉴于亚砜亚胺与硝酮之间的成烯反应在以往文献中从未曾报道，该反应作为一类全新的成烯反应，为单氟烯烃的合成提供了简捷的方法。



欢迎投稿、订阅《有机化学》

《有机化学》是一份由中国化学会主办、中国科学院上海有机化学研究所承办的集中反映有机化学界的最新科研成果、研究动态以及发展趋势的学术类刊物, 主要刊登有机化学领域基础研究和应用基础研究的原始性研究成果。设有综述与进展、研究论文、研究通讯、研究简报、学术动态、研究专题等栏目。

本刊由中国科学院院士陈庆云教授任主编、丁奎岭教授任编辑室主任, 由 14 名中国科学院院士和中国工程院院士等老、中、青三代共 53 名学术专家组成的编委会。

本刊所载论文水平较高, 内容涉及国家自然科学基金、攀登计划、“973”项目及其它科学基金资助项目成果。

本刊被国内外著名数据库或检索期刊 SCI-E、CCI、CA、《俄罗斯文摘杂志》、《中国学术期刊文摘》、《中文科技期刊数据库》、《中国期刊全文数据库》、《中国学术期刊综合评价数据库》、《中国科技论文统计源期刊》、《中国核心期刊(遴选)数据库》、《中国化学化工文摘》等收录。

本刊是中国自然科学核心期刊之一, 在国内外具有广泛的影响, 享有较高的声誉, 是我国学术类期刊发行量最大的刊物之一。

栏 目	研究专题、综述与进展、研究通讯、研究论文、研究简报、学术动态
语 种	中文
广告服务	广告经营许可证: 3100420090013
收 录	SCI-E、CCI、CA、《俄罗斯文摘杂志》、《中国学术期刊文摘》、《中文科技期刊数据库》、《中国期刊全文数据库》、《中国学术期刊综合评价数据库》、《中国科技论文统计源期刊》、《中国核心期刊(遴选)数据库》、《中国化学化工文摘》等
定 价	20 元/册 (邮发代号: 4-285)
出版周期	从正式接收日起: 研究专题、研究通讯 2 个月内, 综述与进展 7 个月内, 研究论文、研究简报、学术动态 5 个月内

《有机化学》为月刊, A4 版, 每期 96 页, 采用微机排版, 胶版印刷, 国内定价 20 元, 全年 240 元, 公开发行, 刊号: **ISSN 0253-2786**, 邮发代号 4-285. 国内读者可在当地邮局订阅, 国外读者可通过中国国际图书贸易总公司订阅。补订者可与本刊编辑部联系。

通讯地址: 上海市枫林路 354 号, 中国科学院上海有机化学研究所《有机化学》编辑部; 邮编: 200032.

网址: <http://sioc-journal.cn>; E-mail: bianji@mail.sioc.ac.cn; 电话: 021-54925244; 传真: 021-54925285.

《有机化学》编辑部