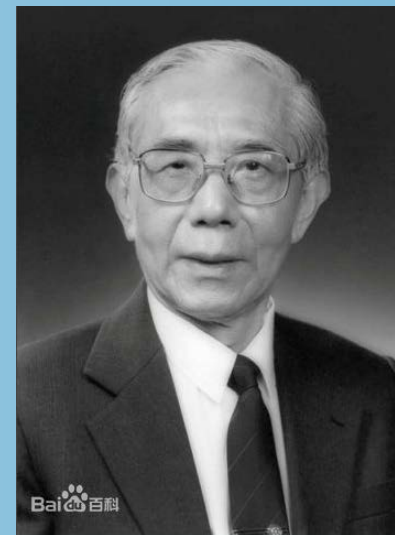
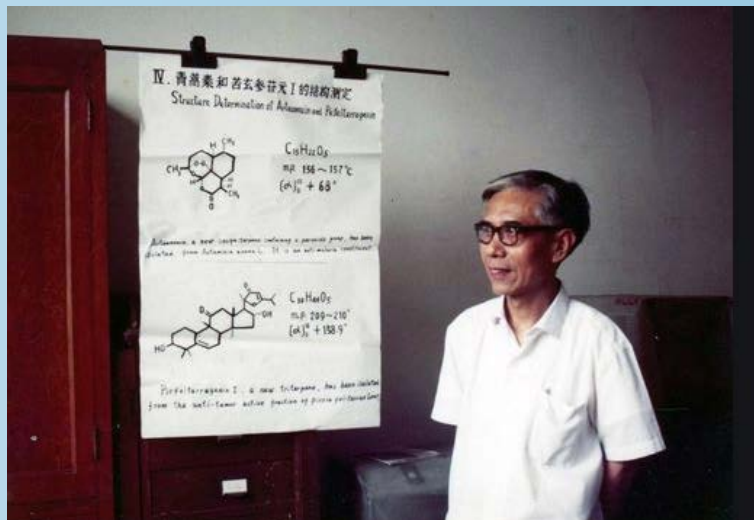


# Shrapless 不对称环氧化的 周维善改良法

2021.01 26

Xin Wang

# Introduction of Weishan Zhou

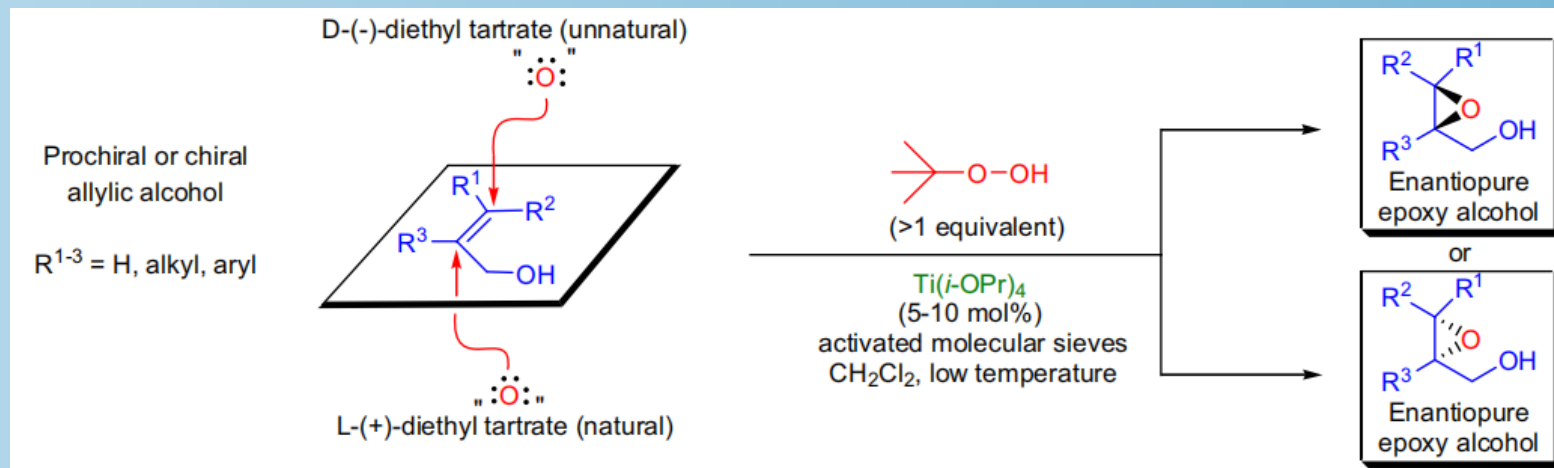


1944年，周维善就读于东吴大学化学系。  
1949年，周维善毕业于国立上海医学院药学系并留校任教。  
1952年—1956年，周维善在军事医学科学院化学系师从著名有机化学家黄鸣龙教授从事科研工作。  
1956年，周维善调到中国科学院上海有机化学研究所从事科研工作。  
1960年，周维善在捷克科学院有机和生化研究所作访问学者。  
1984年，周维善在法国自然科学研究中心神经化学研究中心天然产物研究室作客座教授。  
1991年，周维善当选为中国科学院学部委员。  
2012年8月10日，周维善在上海中山医院因医治无效逝世

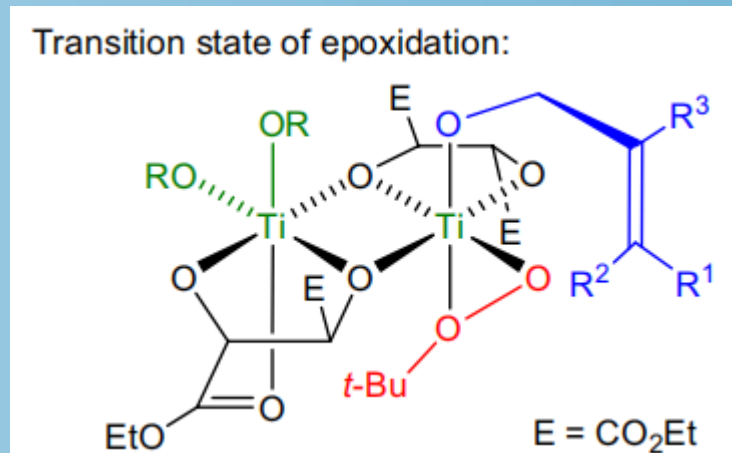
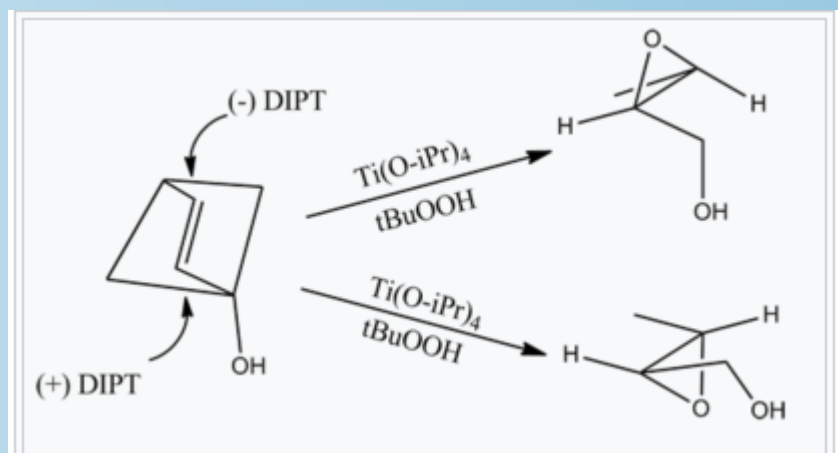
## 长期从事甾体、萜类和不对称合成化学研究

- 不对称全合成了光学活性高效口服避孕药18-甲基炔诺酮，
- 发展了植物生长调节剂油菜甾醇内酯及类似物的合成方法合成了抗癌海洋甾体角鲨多胺
- 首次测定抗疟疾新药青蒿素结构并完成其全合成
- 测定多种昆虫性信息素结构并进行了不对称合成。
- 改良了Sharpless烯丙醇不对称环氧化反应试剂，并扩展到烯丙胺 $\alpha$ -糠胺的动力学拆分

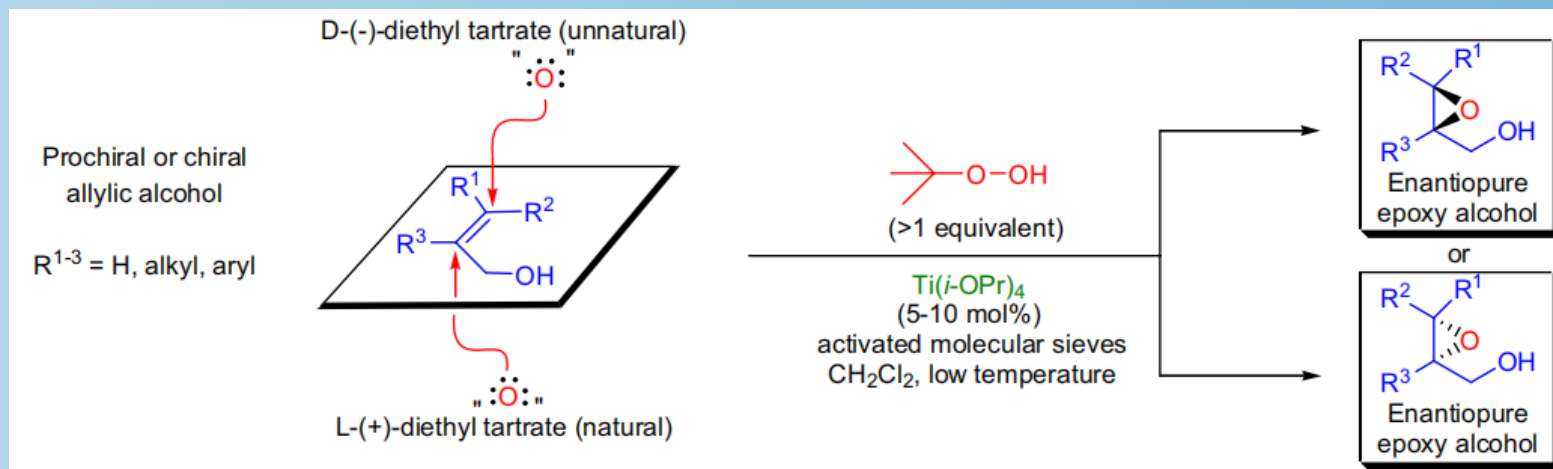
# Sharpless Asymmetric Epoxidation



- 1) chemoselectivity: **allylic alcohols** since the presence of the hydroxyl group is essential
- 2) enantioselectivity: the enantiofacial selectivity of the SAE can be **predicted** for all prochiral allylic alcohols



# Sharpless Asymmetric Epoxidation

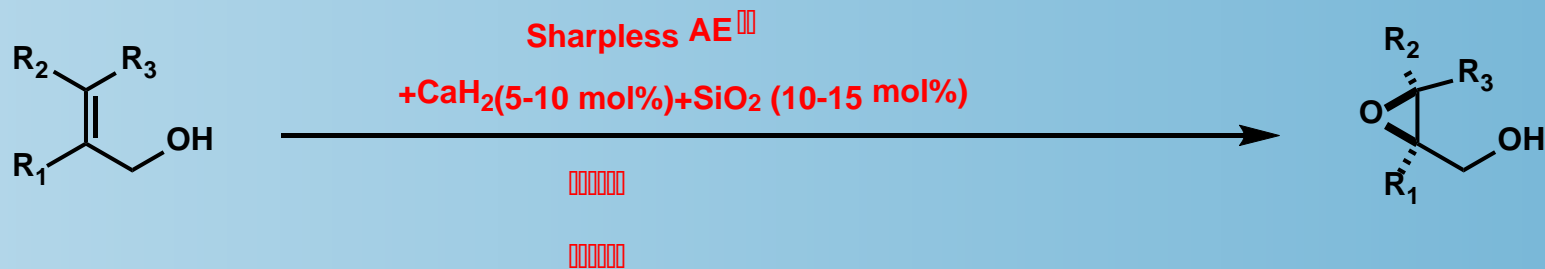


3) substrate sensitivity: the reaction time of **Z-alkene** is much longer than E-alkene

4) the reaction conditions tolerate most functional groups except for free amines, carboxylic acids, thiols, and phosphines

5) the addition of catalytic amounts of molecular sieves to the reaction mixture allows the use of only catalytic amounts (5-10 mol%) of the Ti-tartrate complex; in the absence of molecular sieves, a full equivalent of this complex is needed

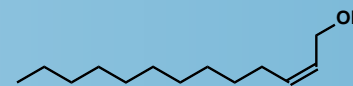
# Sharpless 不对称环氧化的周维善改良法



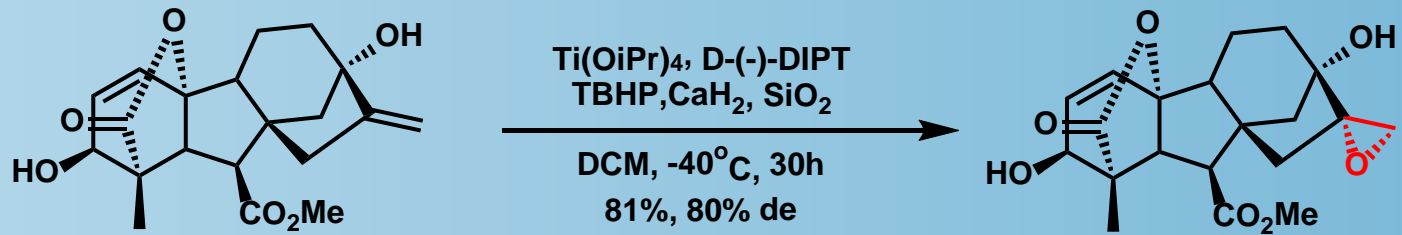
Tetrahedron Lett ,1985, 25, 2835

Catalyst	Amount (mol%)	Reaction Time (h)	Yield(%)	$[\alpha]_D$ (EtOH)
None	None	96	76-80	-7.6°
CaH <sub>2</sub> -Silica Gel	5, 10	8	76	-7.8°
CaH <sub>2</sub>	10	20	74	-4.3°
NaH	10	66	81.5	-4.2°
Silica Gel	10	96	77.7	-7.7°
KH	10	70	87	-5.0°

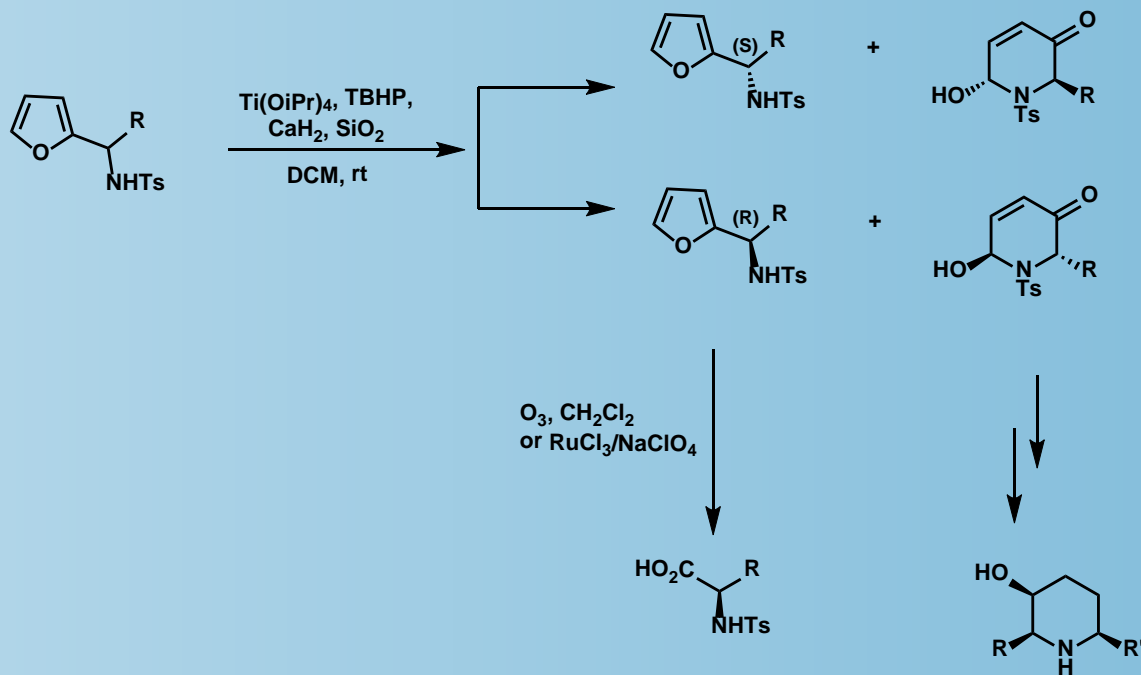
Effect of metal hydride or silica gel on Sharpless asymmetric epoxidation of Z-2-tridecen-1-ol



# Synthetic Applications



*Tetrahedron Lett.* **1985**, 26, 6221-6224



*Tetrahedron Lett.* **1991**, 32, 1467-1470

Thanks for listening

