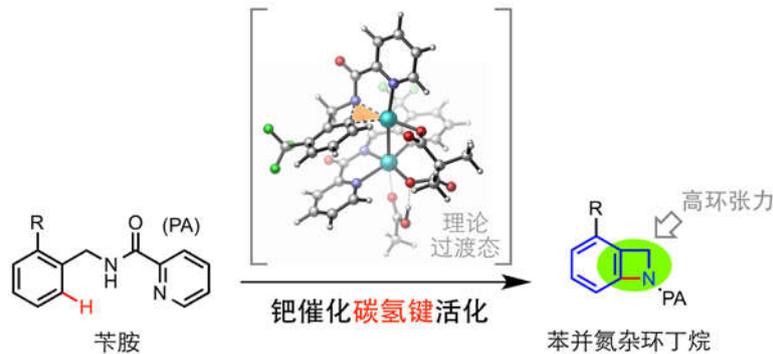


您当前的位置：[南开要闻](#) 正文

南开团队在高效合成氮杂环化合物领域获重要突破

来源：[南开新闻网](#) 发稿时间：2016-08-04 09:17

破解小环含氮骨架合成“重要难题” 开辟小分子药物研发“新天地”



图为基于钯催化碳氢键活化策略的氮杂环合成方法的示意图

南开新闻网讯(记者 吴军辉)日前,困扰有机化学界多年的一个氮杂环化学合成难题,被南开大学的科研团队攻克。南开大学元素有机化学国家重点实验室陈弓、何刚团队首次实现了对具有高“环张力”的苯并氮杂环丁烷类化合物的高效合成,填补了含氮杂环分子研究的一项重要空白。8月1日出版的国际顶级化学学术刊物《自然-化学》(Nature Chemistry)发表了介绍该成果的论文。

杂环化合物是由碳原子和非碳原子共同组成环状骨架结构的一类化合物。非碳原子统称为杂原子,常见的杂原子有氮、氧、硫等。含氮杂环化合物种类繁多,在自然界中分布极广。例如,叶绿素、血红素、中草药中有效成分生物碱等诸多天然含氮杂环化合物在动、植物体内发挥着重要的生理作用。

含有氮原子的环碳骨架是许多医药、农药和功能材料分子的核心组成结构。体积更小的小环含氮骨架因其具有独特化学反应活性,一直是有机化学研究的热点课题。同时,它们对小分子药物的研发意义重大。然而,其极高的“环张力”让化学家们头疼不已,化学合成困难重重。

“所谓环张力,就是当环状分子内的键结形成不正常角度时产生的不稳定性。这有点像拉弓,弓越偏离其最舒适的弧度,其张力就越大,甚至会折断。”陈弓教授说。

苯并氮杂环丁烷就是这类小环含氮骨架的“典型”,它是一类独特的四元氮杂环化合物。相较于其他四元氮杂环骨架,其特有的苯并结构更进一步增加了环张力,这给化学合成带来了巨大挑战,也阻碍了科学家对其化学活性和结构功能的进一步研究。

“此前文献中有少量关于苯并氮杂环丁烷化学合成的报导,但是需要使用高温、高真空或强碱性等剧烈的反应条件,且反应产率低下,适用范围窄,远不具有实用性。”陈弓介绍,他们的团队希望试验出一种低成本、简易、高效的化学合成方法。

近几年,该研究团队在基于钯金属催化碳氢键活化的化学反应研究上取得了一系列成果。在此基础上,他们成功开发了一条基于分子内碳氢键氮基化策略,实现苯并氮杂环丁烷的简洁高效合成。该方法采用廉价易得的苯胺化合物作为起始原料,在金属钯催化下一步生成多种苯并氮杂环丁烷化合物。

这项研究的一个关键是一种新型三价碘氧化剂PhI(DMM)的发明。该试剂可以抑制原本更加容易发生的竞争副反应,从而促使反应沿着热力学上更加困难的设定路径进行,高效生成了常规条件下难以获得的带有高环张力的四元氮杂环产物。

“我们的这项工作成功解决了氮杂环化学合成化学一个遗留多年的难题。这一苯并氮杂环丁烷合成方法的发现,不仅为其在有机合成中的应用奠定了基础;而且也其他具有高环张力杂环化合物的合成提供了一个新的研究思路。”目前,陈弓团队正积极探索苯并氮杂环丁烷化合物自身的化学反应活性及其在生物功能分子合成中的运用。

据了解,美国匹兹堡大学刘鹏教授为该研究提供理论计算支持。刘鹏教授也是论文的共同通讯作者之一。

论文链接: <http://www.nature.com/nchem/journal/vaop/ncurrent/full/nchem.2585.html>

编辑: 韦承金

官博

本网站由南开大学新闻中心设计维护 Copyright©2014 津ICP备12003308号-1
新闻热线: 022-23508737 022-23508464 投稿邮箱: nknews@nankai.edu.cn

人民网 新华网 光明网 中新网 中国教育新闻网 中国青年网 天津网 今晚网 北方网
南开大学 英文资讯 信息公开 信息门户 校友会 教育基金会 本科招生网 新校区建设



南开大学
天津 南开区
[加关注](#)

#晚安南开# 在我身上你或许会看见秋天，当黄叶，或尽脱，或只三三两两挂在瑟缩的枯枝上索索抖颤 ——莎士比亚《十四行诗》



今天 21:32 转发(6) | 评论(6)

#南开时讯# 纠正“脱实向虚”，南开这场高水平研讨会，聚焦中国虚拟经济热点问题。11月3日，第十届全国虚拟经济研讨会在南开大学八里台校区举行。htt

专题



聚焦2016年网络安全宣传周

今年的网络安全宣传周将在9月19日-25日举行，主题是“网络安全为人民，网络安全靠人民”



聚焦“双一流”建设

国务院日前印发《统筹推进世界一流大学和一流学科建设总体方案》

关注

中国青年报：伟大的教育在于点燃内...
 光明日报：生命之境 笔墨之歌——...
 我校教授乐国安获全国优秀科技工作...
 侯莹：我用一束光瓦解世界
 渤海早报：外籍留学生畅游滨海
 校学术委员会审议部分学院“十三五...
 今晚报：南大在新校区复建三座初创...
 经济学院教师获“中国经济学优秀博...
 南开师生观看纪念红军长征胜利80周...
 天津人民广播电台：本市各界青年纪...