第03版：综合新闻

上一版 下一版

- 南方阴雨绵绵 还是厄尔尼诺在作怪
- “低慢小”航空器成众矢之的
- 农技指导助春耕
- 互联网+医疗健康，宁夏打造全国样板
- 我国水文测站达12.1万处
- 锌碘单液流电池能量密度大幅提高
- 2018年70个城市消费者满意度总体良好
- 新方法可高效合成苯并呋喃衍生物
- 坚持“特色论”，切实加强党对科技创新工作的全面领导
- 自走式油葵收割机研发成功
- 黑龙江新发现一超大型石墨矿

新方法可高效合成苯并呋喃衍生物

科技日报昆明2月26日电 （记者赵汉斌）记者26日从云南大学获悉，该校与宾夕法尼亚大学课题组合作，在自由基环化串联反应合成苯并呋喃的研究领域取得重要进展，首次报道了合成苯并呋喃衍生物的新方法。

苯并呋喃结构单元作为重要的生物活性基团广泛存在于天然产物分子和药物分子中，在抗肿瘤、抗病毒、抗菌、抗炎、抗氧化以及对心血管系统的保护作用等方面表现出优异的生理活性。2015年，有34种临床批准的药物是苯并呋喃衍生物，包括达非那新、维拉唑酮、雷美替胺等。苯并呋喃乙胺类化合物是苯并呋喃衍生物中的重要一类化合物，是α2-肾上腺素受体拮抗剂的合成前体，并对血清素5-HT2和5-HT1A受体具有高亲和力，引起了合成化学家的高度重视。但此前报道的合成路线冗长、产率低且高温，需使用过渡金属催化剂等，发展一种合成苯并呋喃基乙胺高效便捷的新方法是急需解决的问题。

云南大学自然资源药物化学教育部重点实验室羊晓东、张洪彬教授团队与宾夕法尼亚大学帕特里克·沃尔什教授课题组合作，以原料易得的2-氮杂烯丙基和碘代芳基丙二烯基醚为反应物，首次实现了自由基环化串联分子间偶联反应，应用于苯并呋喃乙胺类化合物的合成。新方法具有良好的普适性，同时可以拓展合成一系列常规合成方法难以制备的多功能化、多环苯并呋喃衍生物，也可以扩环合成一系列苯并六元或七元氧杂环衍生物。

值得一提的是，此种串联反应不需要过渡金属催化、无配体，避免了在后处理过程中过渡金属杂质分离的难度，同时降低反应成本，避免了来自可持续性的挑战问题，这将有助于该工作今后在制药领域中的应用。新成果已于近日发表在国际化学领域期刊《德国应用化学》上。

上一篇 下一篇

Copyright © Science and Technology Daily, All Rights Reserved 科技日报社 版权所有

京ICP备 06005116 号