

 [交大首页 \(https://www.sjtu.edu.cn/\)](https://www.sjtu.edu.cn/)

 [上海交大报 \(http://shjdb.sjtu.edu.cn/\)](http://shjdb.sjtu.edu.cn/)

 (https://weibo.com/chiaotunguniv?refer_flag=1001030102_)



[旧版新闻学术网入口 \(https://oldnews.sjtu.edu.cn/\)](https://oldnews.sjtu.edu.cn/)



上海交通大学 · 新闻学术网
SHANGHAI JIAO TONG UNIVERSITY

(<https://news.sjtu.edu.cn/index.html>)

[首页 \(/index.html\)](/index.html) / [探索发现 \(/tsfx/index.html\)](/tsfx/index.html) / [交大智慧 \(/jdzh/index.html\)](/jdzh/index.html)

站内搜索



/ 正文

探索发现 · 交大智慧

药学院孙占奎团队报道了一种绿色、
温和、高效的药物氙代新方法

2020年02月13日 责任编辑：田辉



近日，国际知名期刊《Green Chemistry》在线发表了上海交通大学药学院孙占奎研究员课题组的最新研究成果“A mild, general, and metal-free method for site-specific deuteration induced by visible light using D₂O as the source of deuterium atoms”。

氘代作为一种重要标记工具，在药物化学领域、标记示踪、反应机理研究等领域有着广泛应用。药物氘代是一种常用的改变药物分子吸收、分布、代谢、排泄过程（ADME）的方法。在药物代谢的关键部位氘代能够显著提高药物代谢的稳定性，延长药物的半衰期。2017年，美国FDA批准了世界上首个氘代药物-氘代丁苯那嗪，这极大推动了药物氘代技术的研究。

孙占奎课题组设计并实现了一种全新的自由基氘代新方法，具有条件温和、选择性高、无金属参与、高产率和高氘代率的优点。这种新方法以巯基化合物或二硫化物为底物，以DTBP为自由基引发剂，以D₂O/DCM或者D₂O/EA为溶剂，在可见光条件下，经过有机膦试剂脱硫，可以选择性地引入氘原子。该氘代方法表现出非常好的官能团容忍性，各种各样的官能团比如羟基、氨基、羧基、酯基、酰胺等都能被兼容；并且反应的氘代效率很高，基本都能达到90%以上的氘代率。作者进一步把这种方法应用于一些药物结构改造上，均可得到高收率和高氘代率的产物。为了进一步

说明该反应体系的实用性，作者进行了克级规模合成试验，仍然可以实现高效率的氘代。另外，除了有机小分子之外，该方法还可以在多肽结构中实现定点氘代。

Green Chemistry是英国皇家化学学会旗下面向绿色化学领域的国际知名期刊，中科院JCR化学1区Top，2019年影响因子9.4。药学院孙占奎研究员为论文通讯作者，博士生时帅为该论文的第一作者，李瑞宁博士为该论文共同作者。该研究工作得到了上海交通大学的支持。

文章链接为：

<https://pubs.rsc.org/en/content/articlelanding/2020/gc/c9gc04096j#!divAbstract>
(<https://pubs.rsc.org/en/content/articlelanding/2020/gc/c9gc04096j#!divAbstract>)

作者： 孙占奎课题组

供稿单位： 药学院

闻网编辑部维护

地址：上海市东川路800号 邮编：200240 查号：86-21-54740000