

#### 中国科学院—当日要闻

- ▶ cctv焦点访谈: 灾后心理救助任重道远
- ▶ 百名全国青联委员走进高能所 零距离接触大科学装置
- ▶ 中科院与广东省全面战略合作规划纲要规划未来七年
- ▶ 白春礼: 中科院将投重兵构筑珠三角科技创新高地
- ▶ 中科院启动新疆煤化工产业发展战略规划研究
- ▶ 周光召: 新媒体正带来全球传播新格局
- ▶ 电子所怀柔园区奠基
- ▶ 中科院水利部签署科技战略合作协议
- ▶ 成思危: 世界经济2011年复苏
- ▶ 中科院党组举行学习实践科学发展观专题活动

当前位置: [首页](#) > [科研](#) > [科研动态](#) > [基础研究](#) >> [正文](#)

## 上海药物所化学合成药物研究取得系列进展

生命科学与生物技术局

近年来, 中科院上海药物所药物发现与设计中心(DDDC)合成组的柳红师生积极发展新的化学合成方法用于药物合成, 取得了一系列重要进展。

柳红、郭涤亮、黄河等采用廉价、环境友好的铁铜等催化体系, 发展了几种快速高效的C-C键与C-N键偶联的方法, 实现卤代芳烃与多种底物进行偶联。相关研究工作在Org. Lett. 等多种国际重要期刊上发表。他们发展的微波促进的钯催化体系, 可以使惰性的氯代芳烃与多种底物进行快速高产率的偶联, 适用于Sonogashira、Suzuki、Heck和Buchwald-Hartwig等偶联反应, 具有较高的学术价值和应用价值, 论文发表在J. Org. Chem. 后, 获得国际同行的高度评价, 被SYNFACTS和Organic Chemistry Porta作为重要有机合成进展报道。在此基础上, 柳红、黄河、李召广等通过微波辅助的手段, 建立了液相平行合成技术平台, 快速构建出具有不同母核的多样性杂环化合物库, 用于多种药物中间体的合成, 相关结果在Org. Lett.、J. Comb. Chem.、J. Comb. Chem. 等杂志上。

柳红指导的研究生邓光辉首次探索了Ni(II)螯合物诱导合成手性氨基酸的方法学工作, 王江等人对该方法进行了优化, 首次采用Ni(II)螯合物诱导, 合成了 $\beta$ -氨基酸等单体、 $\beta$ 2氨基酸、环状氨基酸、 $\alpha$ ,  $\beta$ -二氨基氨基酸及其衍生物, 丰富了Ni(II)螯合物诱导合成手性氨基酸的应用范围。与其他手性氨基酸的合成方法相比较, 该方法具有合成过程简洁方便、合成的氨基酸结构丰富、光学纯度高、收率好、操作步骤少、可直接得到游离氨基酸等优点, 具有很高的应用价值。相关研究论文发表在J. Org. Chem.、J. Org. Chem.、Tetrahedron. 杂志上。

此外, 柳红指导的研究生叶德举等在合成抗流感药物Zanamivir及其衍生物的基础上, 发展了一种双重立体选择性的2-O-脱乙酰化和4-胺化全乙酰基保护的唾液酸合成方法, 以较高的产率得到C-4位环状二级胺取代的唾液酸衍生物以及C-4位哌嗪衍生物连接的唾液酸二聚体, 从而为合成非天然唾液酸多聚体提供了新的途径, 相关论文发表在Tetrahedron Lett. 和Tetrahedron上。

DDDC合成组有机合成化学方法学发展方面的研究成果, 为创新药物研发奠定了重要的技术基础。

[ 2008年11月26日 ]

[ 评论几句 ] [ 推荐给同事 ] [ 关闭窗口 ]