

## 广州生物院利用C-H键官能化反应构建杂环分子

文章来源：广州生物医药与健康研究院

发布时间：2014-04-21

【字号：小 中 大】

近年来，过渡金属催化的C-H键官能化反应因其具有很好的原子经济性受到科学家的广泛关注。与传统的方法相比，这类反应具有底物不需要预活化、底物适应性广泛、合成路线短、产生的废弃物少等多种突出优点，在有机合成特别是药物分子合成方面具有重要的意义。

中国科学院广州生物医药与健康研究院朱强研究员团队长期致力于药物分子的绿色合成方法研究，在杂环分子的高效设计合成方面积累了丰富的经验。课题组通过金属催化和高价碘催化的C-H键官能化策略设计合成了多个具有广泛药理活性的杂环化合物，这些方法普遍具有良好的原子经济性和步骤经济性，极大地提高了药物分子的合成效率，降低了药物研发成本。例如：Acridone类分子广泛存在于天然产物中，是药物分子的优势骨架，该研究组发展了以廉价的铜为催化剂，氧气为氧化剂，通过分子内的C-H键胺化反应高效地合成了这类分子。该方法具有简便高效的优点；Phenanthridinone衍生物同样是一类具有重要生物活性的分子，该研究组成功地利用C-H键的胺化羰基化反应构建这类杂环分子，与传统合成方法相比简化了合成路线，减少了废弃物排放，提高了药物分子的合成效率，具有良好的原子经济性和步骤经济性；高价碘作为一类特殊的试剂，它具有多种价态，在很多方面具有跟过渡金属类似的性质，该研究组发展了利用高价碘催化的N-芳基-2-氨基吡啶的C-H键胺化环化反应合成Pyrido[1, 2-a]benzimidazole衍生物，这类反应具有反应条件温和，底物适应性广泛，产率高等突出优点。以上这些合成方法的建立，为今后高效地设计合成具有广泛生物活性的杂环药物分子奠定了基础。

以上部分相关成果发表于国际期刊*Eur. J. Org. Chem.* 2013, 1876 - 1880; *Chem. Commun.* 2013, 49, 7352 - 7354; *Chem. Commun.* 2013, 49, 173 - 175; *Org. Lett.* 2013, 15, 3476 - 3479; *Org. Lett.* 2013, 15, 4110 - 4113; *Adv. Synth. Catal.* 2013, 355, 3290 - 3294。该项研究获得国家自然科学基金(21072190, 21202167, 21272233)和广东省自然科学基金资助(S2011020000806)。

打印本页

关闭本页