“金属迁移”策略助环己烷合成突破

作者：writer 来源：爱科学

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/18346.html

本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

“金属迁移”策略助环己烷合成突破。武汉高等研究院教授阴国印课题组利用金属迁移策略，解决了环己烷合成领域长期存在的难题，打开了热力学不稳定取代环己烷模式化合成的大门，让复杂药物分子的合成变得更加简单高效。5月13日，以《动力学控制的取代环己烷的模式化合成》为题，《科学》在线发表了其研究成果。

武汉大学高等研究院博士研究生李阳阳为第一作者，阴国印为第一通讯作者，西班牙拉里奥哈大学博士后Ignacio Funes-Ardoiz为共同通讯作者，武汉大学高等研究院为该论文第一署名单位。

与平面的生物同位体相比，具有三维复杂的几何形状的药物分子，通常具备更好的生物活性和物理特征。因此，创建高效的合成方法，以立体定向的方式构建饱和环状化合物一直是合成化学领域的研究热点。环己烷的一个取代基在平伏键,另一个在直立键,即1,2-cis,1,3-trans,1,4-cis取代模式，广泛存在于药物分子中。此外，它们往往表现出比其热力学上有利的同分异构体更好的生物活性。自从1928年Diels和Alder报道环戊二烯与顺丁烯二酸酐的环加成反应后，人们一直没有停止对环己烷合成的探索，然而到目前为止，仍未有一种高效的、模式化合成动力学控制的取代环己烷的方法。

阴国印课题组在前期烯烃1,1-碳硼化工作的基础上，利用金属迁移策略，以简单易得的环外烯烃为原料，开创了一种简单、高效合成1,2-顺式、1,3-反式以及1,4-顺式取代环己烷的方法，并且该方法具有优异的立体选择性以及底物兼容性。机理实验以及DFT理论计算研究表明，大位阻硼酸酯基的引入对于反应的立体控制具有至关重要的作用。该研究不仅代表了环己烷合成的重大突破，也是金属迁移策略在合成中应用的重要进展，还将为药物化学的研究以及重要生物活性分子的发现提供物质基础。（来源：中国科学报 温才妃 吴江龙）

相关论文信息：https://doi.org/10.1126/science.abn9124

版权声明：凡本网注明来源：中国科学报、科学网、科学新闻杂志的所有作品，网站转载，请在正文上方注明来源和作者，且不得对内容作实质性改动；微信公众号、头条号等新媒体平台，转载请联系授权。邮箱：shouquan@stimes.cn。
作者：阴国印等 来源：《科学》

更多 科学进展 请访问 https://www.iikx.com/news/progress/

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，爱科学iikx.com转发