
上海药物所等基于酮官能团接力实现芳烃多位点修饰

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/30074.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！

上海药物所等基于酮官能团接力实现芳烃多位点修饰。

10月25日，中国科学院上海药物研究所戴辉雄课题组与中国科学院大学杭州高等研究院蓝乐夫课题组合作，在《自然-合成》（Nature Synthesis）上发表了题为Multi-site modifications of arenes using ketones as removable handles enabled by Pd and norbornene cooperative catalysis

的学术论文。该研究通过钯/降冰片烯催化下芳酮官能团接力Catellani反应，实现了对芳烃的多位点修饰，并进一步应用于脱氢松香酸分子库的构建工作。

天然产物具有独特而多样的分子结构，是药物研发的重要来源。有研究发现，超过50%的小分子药物直接或间接来源于天然产物。而天然产物结构复杂、来源局限，限制了其在药物研发中的应用。因此，发展有效的天然产物结构修饰的方法与策略以提高生物活性、改善药物代谢性质、减轻毒性，成为药物研发的研究热点。近年来，戴辉雄课题组发展了配体促进的非张力芳酮碳-碳键活化策略。这一策略通过与不同的亲核试剂反应，实现了芳酮的硼化、芳基化、炔基化、烯基化、烷基化及硅化等多种官能团转化。

该研究发展了基于芳酮碳-碳键活化的Catellani反应，通过钯/降冰片烯催化下芳酮官能团的连续接力，实现对天然产物的多位点修饰。研究以廉价易得的苯为起始原料，通过傅克酰基化、酮导向的邻位碳氢键氟化及芳酮接力Catellani反应，构建了高附加值的1,2,3,4-、1,2,3,4,5-及1,2,3,4,5,6-多取代芳烃骨架。同时，研究人员运用这一策略，构建了基于天然产物脱氢松香酸的分子库，并通过筛选耐甲氧西林金黄色葡萄球菌USA300 LAC和化脓性链球菌ATCC 12344的抗菌活性，获得了高活性的苗头化合物。

研究工作得到国家自然科学基金、国家重点研发计划、上海市相关项目的支持。

[论文链接](#)

研究团队单位：上海药物研究所

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](http://www.iikx.com)转发