
新方法实现非张力饱和环胺多样化环扩张合成

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/30629.html>

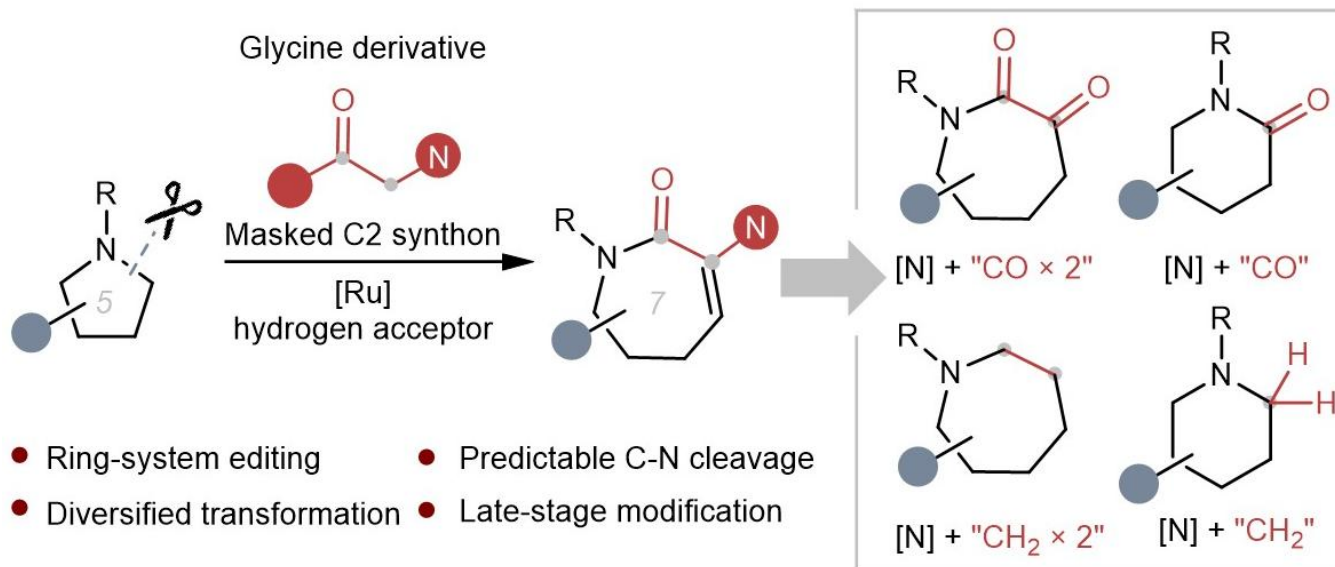
本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

新方法实现非张力饱和环胺多样化环扩张合成。华东理工大学化学与分子工程学院、费林加诺贝尔奖科学家联合研究中心教授陈宜峰团队，开发了非张力饱和环胺的多样化环扩张反应，为现有候选药物的多样化合成提供了一个前景广阔的平台。11月21日，相关研究发表于《自然—化学》。

多样性导向合成（DOS）旨在用简单的起始原料构建出复杂且多样化的有机化合物，在合成化学中具有重要意义。

饱和环胺是天然产物和生物活性化合物中广泛存在的结构基元。围绕含氮杂环的多样性合成开发新方法，一直是有机化学和药物化学领域的重要研究目标。通过骨架编辑快速生成具有不同环尺寸的多样化类似物，可以显著提升结构-活性关系的研究效率。近年来，基于饱和环胺的 α -官能化、远端直接官能化反应已被广泛报道，但对其直接骨架编辑仍存在较大挑战。同时，将饱和环胺转化为扩环后的含氮杂环，同时保持其原有功能性，也是一个亟待攻克的难题。

研究团队开发了将甘氨酸衍生物作为两个碳合成子直接插入五元或六元饱和环胺的方法。利用借氢策略，研究人员实现了串联钨催化C-C键形成、逆-氮杂迈克尔加成和内酰胺化过程，构建出七元内酰胺类衍生物，实现了形式上的[5+2]反应。进一步地，研究人员对产物进行衍生化，在脂肪环上模块化插入碳一或碳二单元，最终将一个氮杂环转化为多达五种不同的氮杂环。（来源：中国科学报 江庆龄）



研究总览。图片由研究团队提供

相关论文信息：<https://doi.org/10.1038/s41557-024-01668-w>

作者：陈宜峰等 来源：《自然—化学》

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](https://www.iikx.com)转发