科学家提出有机催化新策略合成手性亚磺酰胺

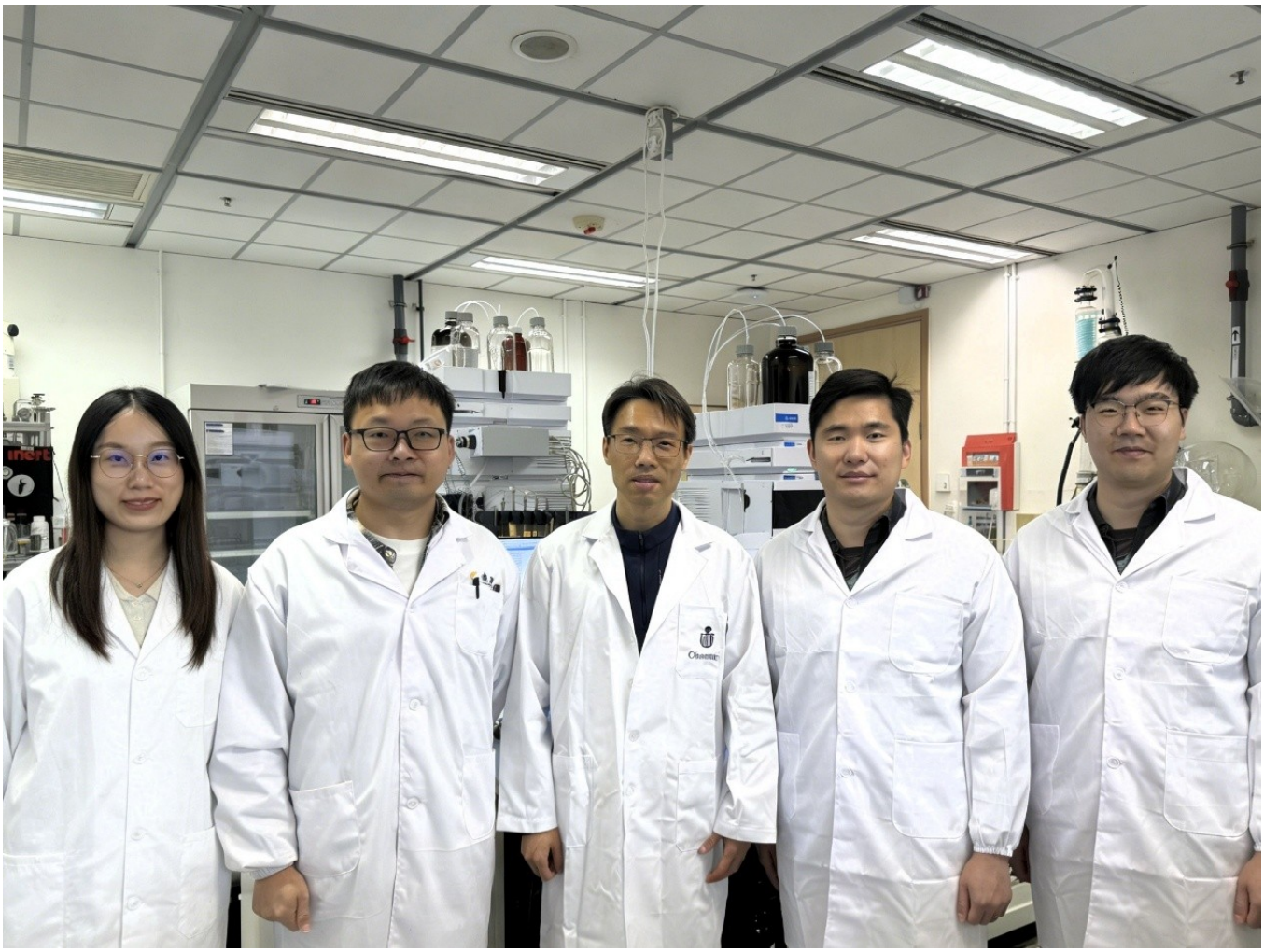
作者：writer 来源：科学网

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/38937.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！

科学家提出有机催化新策略合成手性亚磺酰胺

。近日，香港科技大学化学系讲座教授孙建伟团队在有机合成与药物化学领域取得进展。他们开发出一种基于空气稳定的手性膦催化剂的不对称合成方法，成功制备了高对映体纯度的S（IV）手性乙烯基亚磺酰胺。相关成果发表于《自然-化学》。



孙建伟（中）教授团队。研究团队供图

手性硫中心化合物在药物研发与有机合成中具有重要作用。目前市售小分子药物中，超过四分之

一含有硫原子；其中，具有S（IV）手性的亚磺酰胺是药物化学、不对称合成助剂及催化配体领域的关键合成砌块。然而，现有高对映体纯度亚磺酰胺的合成方法多依赖过渡金属催化，并使用有机金属亲核试剂，高效的有机催化策略长期缺乏。

为解决这一问题，孙建伟团队设计并合成了基于SPHENOL手性骨架的新型C2对称手性膦催化剂QianPhos。该催化剂具备良好的空气稳定性和结构刚性，可催化森田—贝利斯—希尔曼（MBH）酯与亚磺酰胺之间的“ 3+2 ”环加成反应，实现高化学选择性、高对映选择性及高非对映选择性的碳-硫键构建。

与传统的过渡金属催化不同，该有机催化方法通过原位生成磷叶立德作为乙烯基亲核试剂，为高对映体纯度手性环状乙烯基亚磺酰胺的合成提供了一条新路径。研究表明，该类环状乙烯基亚磺酰胺能够与新冠病毒突变刺突蛋白及人类免疫缺陷病毒1型（HIV-1）的ENV蛋白高效结合，提示该化合物在抗病毒药物研发中具有潜在应用价值。

此外，研究团队结合密度泛函理论计算与核磁共振机理实验，揭示了该反应的核心机理特征：膦鎓物种为催化剂的休眠态，而亚磺酰胺兼具反应底物与促进剂的双重作用，可推动关键催化中间体膦鎓的形成。该机理为此类反应的高选择性提供了合理解释。

相关论文信息：https://doi.org/10.1038/s41557-026-02095-9

作者：朱汉斌 来源：中国科学报

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