
新策略实现含硫半饱和稠合吡啶结构的快速构建

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/40929.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！

新策略实现含硫半饱和稠合吡啶结构的快速构建。近日，中国科学院大连化学物理研究所研究员陈庆安、副研究员郭诗宇与研究员吴小锋团队、辽宁师范大学教授王连月等合作，在环状硫化物的扩环骨架编辑研究中取得新进展。团队发展了一种光催化吡啶自由基诱导环硫醚扩环重构新策略，为快速构建含硫半饱和稠合吡啶结构提供了一条简洁高效的模块化合成路线。相关成果发表在《美国化学会志》。

氮杂环与含硫基团是药物分子中的两类重要结构单元。其中，吡啶是FDA获批药物中最常见的氮杂环药效团之一，含硫基团约占上市药物活性成分的四分之一。兼具二者结构特征的含硫半饱和稠合吡啶在多靶点激酶抑制、抗肿瘤、抗流感等方面展现出独特的生物活性，但现有合成路径多依赖多步从头构建，缺乏简洁高效的催化合成方法。

本工作开发了一种光催化环状硫化物骨架编辑的新方法。该方法以卤代吡啶、饱和环硫醚为原料，在温和条件下实现了含硫半饱和稠合吡啶的催化合成。机理研究表明，该反应以吡啶自由基为关键中间体，协同实现C-S键的选择性断裂与重组，完整经历自由基交叉偶联、分子内环化的级联转化历程。

该反应底物适用范围广、官能团兼容性强，可构建结构多样的含硫半饱和稠合吡啶，为高Fsp3值含硫三维杂环骨架的构建提供了有效途径。（来源：中国科学报 孙丹宁）

相关论文信息：<https://doi.org/10.1021/jacs.6c09452>

作者：陈庆安等 来源：《美国化学会志》

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