

---

# 上海药物所在构建多样性碳杂键反应及其应用研究中取得进展

作者：writer 来源：本站

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/5338.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！**

上海药物所在构建多样性碳杂键反应及其应用研究中取得进展。近期，Cell出版社子刊iScience发表了中国科学院上海药物研究所张翱课题组和陆晓杰课题组协作完成的基于C-N键切断构建多样性碳杂键的最新科研成果。

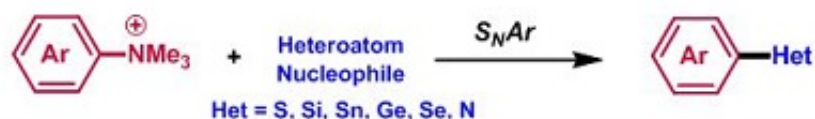
碳杂键(如C-O、C-N、C-S、C-Se、C-Si、C-Ge、C-Sn等)是有机分子中最常见的化学键，其构建和切断是合成天然产物、药物分子、功能材料等的重要步骤，也是进一步官能团转化的关键。迄今为止，构建多样性碳杂键的方法通常是以芳基卤代物和杂原子亲核试剂为底物，在过渡金属催化条件下的交叉偶联反应。但该方法存在条件苛刻、底物需预官能团化、过渡金属残留等多种问题，在医药工业等诸多领域的应用存在一定限制。

张翱课题组围绕高效构建碳杂键的新方法开展了多年研究，先后实现了基于惰性C-H键活化构建芳环间位碳氮键(J. Am. Chem. Soc.2016, 138, 8470.;ACS Catalysis, 2016, 6, 769.;Org. Lett., 2017, 19, 3199)以及基于芳香胺底物高效构建碳氧键(Angew. Chem. Int. Ed., 2018, 57, 3641)等新反应。

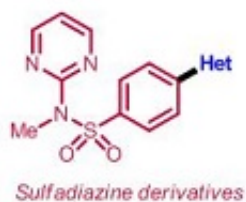
在此基础上，课题组进一步拓展了芳基季铵盐为底物的新化学反应空间，在极温和的条件下实现了无过渡金属催化的多样性碳杂键(C-S、C-Se、C-Si、C-Ge、C-Sn、C-N)快速高效构建。这一方法条件温和，不仅能用于活性天然产物和药物分子的后期结构修饰，还能用于通过药物Click反应构建荧光探针分子，高选择性识别并标记(高)半胱氨酸，可用于体内特定生物过程的检测。

最后，通过与陆晓杰课题组合作，成功地把该方法应用到了DNA兼容的官能团化反应中，并实现了DNA编码化合物库的建立。目前已从DEL库中高效筛选出了具有抗肿瘤活性的化合物，后续研究工作正在进行中。

该研究工作是在张翱课题组博士后王东宇和陆晓杰课题组硕士生温馨共同努力下完成的，王东宇为论文第一作者(iScience, 2019, 15, 307-315)。该研究工作得到上海药物所分析化学研究室研究员周虎及其课题组博士孟乾的支持。该项目在国家自然科学基金委、科技部、中科院、上海市科委等资助下完成。



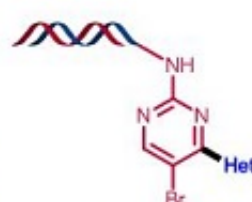
TM-catalyst free; easily available reagent; mild conditions; Functional group compatibility



Late-stage functionalization of antibiotic drug



Click reaction leading to fluorescent probe for Cys/Hcy



Development for DNA encoded library synthesis

基于芳基季铵盐构建多样性碳杂键的反应及其应用研究

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