
科学家发现高通量有机合成新方法

作者：黄辛 来源：中国科学报

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/7043.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！

科学家发现高通量有机合成新方法。中科院上海有机化学研究所研究员董佳家课题组发现一种安全高效、从大量可得的一级胺化合物出发直接合成叠氮化合物库的方法。相关研究成果日前发表于《自然》。

随着学科间的交叉渗透日益加强，更高效地通过合成实现分子功能已成为合成学科的内在需求。相比于其他化学反应，点击化学反应在复杂环境下具有高度可预测性，其在众多交叉学科已经取得广泛应用，但其独特的、高度可预测的反应性在合成上的优势未能充分实现。

董佳家课题组在寻找新的六价硫氟交换反应砌块的过程中，意外发现一种安全、高效合成罕见的硫氟类无机化合物氟磺酰基叠氮的方法。该化合物表现出对于一级胺官能团异乎寻常高的重氮转移反应性。该论文共同通讯作者董佳家告诉《中国科学报》，他们进一步发现，氟磺酰基叠氮进行重氮转移后在两相条件下迅速水解。

一级胺是有机化学中多样性最大、砌块可得性最高的官能团。在新发现反应的基础上，该课题组从大量可得的一级胺官能团分子砌块出发，在96孔板内直接合成了对应的叠氮砌块库(1224个)。该化合物库不需分离纯化，就可以和任意给定端炔化合物进一步在96孔板内进行环加成反应(单人操作)，进而直接进行功能筛选。在实现砌块极大多多样性和链接高度可预测性的前提下，他们建立了高通量合成模式。

研究人员将氟磺酰基叠氮与一级胺类化合物的重氮转移反应过程命名为模块化的点击化合物库方法。该方法可以直接应用于生物功能的表型筛选。基于这种合成方式，短时间内对给定药物小分子或者大分子砌块进行万次以上的改造是可行的，而合成效率的提高对于药物先导分子的发现将起到直接的作用。

相关论文信息：<https://doi.org/10.1038/s41586-019-1589-1>

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