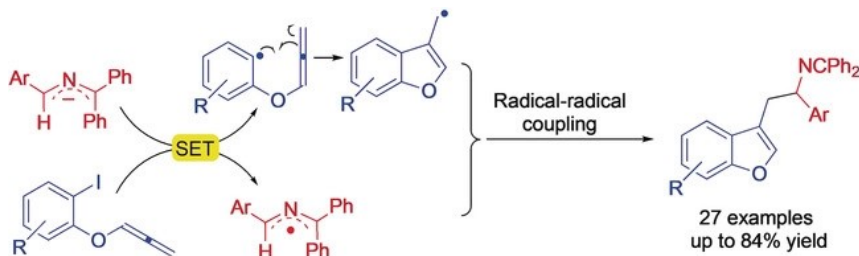


当前位置: 首页 >> 正文

## 云南大学羊晓东/张洪彬团队在Angewandte Chemie International Edition上发表研究成果

2019-02-25 点击: [ 1076 ]

近日, 云南大学自然资源药物化学教育部重点实验室羊晓东/张洪彬教授团队与宾夕法尼亚大学Patrick J. Walsh教授课题组合作, 在自由基环化串联反应合成苯并呋喃的研究领域取得重要进展。该成果以“Synthesis of Benzofuran Derivatives through Cascade Radical Cyclization/Intermolecular Coupling of 2 - Azaallyls” (2019, 58, 2826-2830, DOI: 10.1002/anie.201812369) 为题发表在国际化学领域权威期刊Angewandte Chemie International Edition (《德国应用化学》, Nature Index期刊, 影响因子12.102)。羊晓东教授课题组博士生邓国刚为论文第一作者。该论文首次报道了串联自由基环化/分子间偶联反应合成苯并呋喃衍生物的新方法。



苯并呋喃结构单元作为重要的生物活性基团广泛存在于天然产物分子和药物分子中, 在抗肿瘤、抗病毒、抗菌、抗炎、抗氧化以及对心血管系统的保护作用等方面表现出优异的生理活性。2015年, 有34种临床批准的药物是苯并呋喃衍生物, 包括Darifenacin (达非那新)、Vilazodone (维拉唑酮)、Ramelteon (雷美替胺) 等。苯并呋喃乙胺类化合物是苯并呋喃衍生物中的重要一类化合物, 是 $\alpha_2$ -肾上腺素受体拮抗剂的合成前体, 并对血清素5-HT<sub>2</sub>和5-HT<sub>1A</sub>受体具有高亲和力, 引起了合成化学家的高度重视。然而, 前人报道的合成路线冗长、产率低、高温、使用过渡金属催化剂/配体/危险试剂(钯催化剂、镍催化剂、重氮甲烷、氢化铝锂等)。因此, 发展一种合成苯并呋喃基乙胺高效便捷的新方法是急需解决的科学问题。

该论文工作以原料易得的2-氮杂烯丙基和碘代芳基丙二烯基醚为反应物, 在双(三甲基硅基)氨基钠为碱、乙二醇二甲醚(DME)为溶剂的反应体系中, 室温条件下, 首次实现了自由基环化串联分子间偶联反应, 应用于苯并呋喃乙胺类化合物的合成。该方法具有良好的普适性, 同时可以拓展合成一系列常规合成方法难以制备的多功能化、多(杂)环苯并呋喃衍生物, 也可以扩环合成一系列苯并六元或七元氧杂环衍生物。值得一提的是, 该串联反应不需要过渡金属催化、无配体, 避免了在后处理过程中过渡金属杂质分离的难度, 同时降低

### 最新文章

- |                             |       |
|-----------------------------|-------|
| 云南大学羊晓东/张洪彬团队在An...         | 02/25 |
| 云南大学邵志会课题组在Angew. ...       | 02/18 |
| Chemical Science发表夏成峰团...   | 02/03 |
| 国家自然科学基金重点项目启动...           | 01/25 |
| 云南大学肖春杰课题组首次揭示W...          | 01/11 |
| 云南大学生命与分子科学学科群2...          | 01/10 |
| 杨崇林研究组和郭伟翔研究组联...           | 01/08 |
| 何俊研究员及合作者在Journal o...      | 01/08 |
| 重要突破 云南大学拟增科技部重...          | 12/17 |
| 于黎研究员课题组揭示川金丝猴...           | 11/28 |
| 加拿大温莎大学副校长Michael S...      | 10/31 |
| 云南大学陈芬儿院士工作站揭牌...           | 10/17 |
| Journal of Catalysis发表化工... | 10/15 |
| 我校4个项目获得冷门“绝学”和...          | 09/26 |
| 中国西南天文研究所刘晓为教授...           | 09/10 |
| 云南大学光盘创新团队参加第十...           | 08/27 |

反应成本，避免了来自可持续性的挑战问题，这将有助于该工作今后在制药领域中的应用。

该项工作得到了国家自然科学基金、教育部长江学者与创新团队发展计划、云岭学者及东陆学者支持计划的支助。

自然资源药物化学教育部重点实验室 供稿

(编辑：李哲)

下一条：[云南大学邵志会课题组在Angew...](#)

[【关闭】](#)