

高异三尖杉酯碱的合成及其立体异构体的分离鉴定

李绍白,崔育新,李裕新林,潘鑫复,王永铿,黄文魁

兰州大学有机化学研究所

收稿日期 修回日期 网络版发布日期 接受日期

摘要 2-氧代-6-甲基庚酰基三尖杉碱(3)与O-(1-甲氧基异丙基)羟基乙酸甲酯(4)在强碱性试剂二异丙胺锂(LDA)存在下,起亲核加成反应,反应中间体5在室温用酸性丙酮水解,得到一种新的三尖杉酯类生物碱——高异三尖杉酯碱(6c)及其立体异构体(6a、6b、6d)的混合物,产率56%、通过制备薄层层析分得这四个立体异构体,它们的¹H NMR和异三尖杉酯碱及其立体异构体的¹H NMR类似,推定了它们的绝对构型。初步药理试验表明,高异三尖杉酯碱及其立体异构体的混合物对白血病L7712的DNA合成有明显的抑制作用。

关键词 [生物碱](#) [分离](#) [抗癌药](#) [质子磁共振谱法](#) [鉴定](#) [结构与性能关系](#) [立体异构](#) [三尖杉碱](#)

分类号 [0629](#)

Synthesis of homoisoharringtonine and separation of its stereomers

LI SHAOBAI, CUI YUXIN, LI YULIN, PAN XINFU, WANG YONGKENG, HUANG WENKUI

Abstract Cephalotaxine ester of 2-oxo-6-methylheptanoic acid was treated with lithium diisopropylamide and Me O-(1-methoxyisopropyl)glycolate to give a mixture of homoisoharringtonine (I) and its stereoisomers with 56% yield. The four stereoisomers separated by TLC showed identical mass spectra and almost superimposed IR but with different ¹H NMR spectra. The configuration of the 2'-C and 3'-C of the four isomers were postulated based upon their ¹H NMR spectra as compared with the ¹H NMR spectra of isoharringtonine and its stereoisomers. The mixture of four stereoisomers exhibited antitumor activity against Leukemia L-7712 by inhibiting the synthesis of DNA.

Key words [ALKALOID](#) [SEPARATION](#) [ANTICARCINOGEN](#) [PROTON MAGNETIC RESONANCE SPECTROMETRY](#) [IDENTIFICATION](#) [STRUCTURE AND PROPERTY CORRELATION](#) [STEREISOMERISM](#) [CEPHALOTOXINUM](#)

DOI:

通讯作者

扩展功能

本文信息

▶ [Supporting info](#)

▶ [PDF\(0KB\)](#)

▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)

▶ [参考文献](#)

服务与反馈

▶ [把本文推荐给朋友](#)

▶ [加入我的书架](#)

▶ [加入引用管理器](#)

▶ [复制索引](#)

▶ [Email Alert](#)

▶ [文章反馈](#)

▶ [浏览反馈信息](#)

相关信息

▶ [本刊中 包含“生物碱”的
相关文章](#)

▶ [本文作者相关文章](#)

- [李绍白](#)
- [崔育新](#)
- [李裕新林](#)
- [潘鑫复](#)
- [王永铿](#)
- [黄文魁](#)