

新闻网首页
交大首页主页新闻
综合新闻教育教学
科研动态外事活动
招生就业院部动态
多彩书院校园生活
思源讲堂人物风采
校友之声医疗在线
社会服务媒体交大
新闻纵横新闻专题
图片新闻视频交大
理论园地信息预告
校园随笔

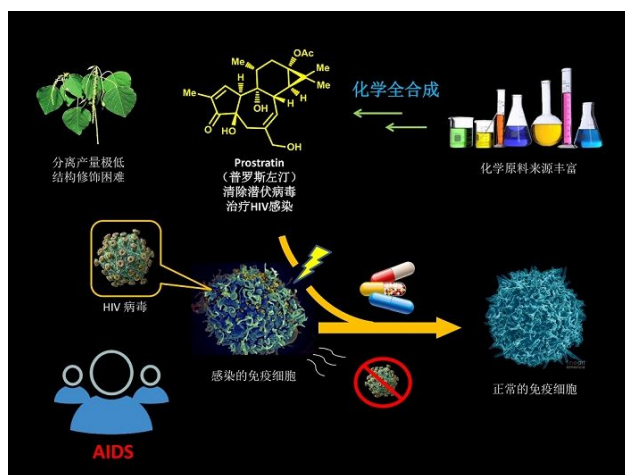
新闻网首页 > 科研动态 > 正文

西安交大科研人员在天然产物全合成方面取得重要进展

来源: 交大新闻网 日期: 2018-11-05 16:18 点击: 2290

在人类目前的研究中,对艾滋病最为有效的治疗途径就是“鸡尾酒疗法”,它既可以阻止艾滋病病毒繁殖,又可以防止体内产生抗药性的病毒,但它存在一个重大问题就是无法彻底根除潜藏在免疫细胞中的前病毒,这也导致艾滋病无法彻底根治。上世纪九十年代初,美国药物化学家们从萨摩亚的名为“马马拉”树的树皮中分离得到一种巴豆烷二萜天然产物普罗斯左汀(Prostratin),进一步研究发现其不仅可以有效激活蛋白激酶C,而且能有效激活潜伏在感染免疫细胞内的前病毒。在此基础上如果再配合使用“鸡尾酒疗法”的相关药物,将有望发展一种彻底根除艾滋病病毒的新疗法。但目前由于这种植物产量低,变异率高,来源有限,极大限制了对其作用机理和治疗功效的研究。

正因为普罗斯左汀所具有的独特生物活性和巨大的潜在药用价值,自其发现以来,吸引了国内外众多的研究组投入到普罗斯左汀的合成研究中,但由于该分子结构复杂,合成难度大等特点,仅有2008年的一篇半合成报道。



西安交大前沿院李鹏飞教授课题组一直致力于具有重要生理活性的复杂天然产物的全合成和过渡金属催化反应的相关研究。该课题组经过五年的不懈努力,以易得的环戊二烯为起始原料,经过环氧化开环反应、光照单线态氧氧化去芳化、钨催化偶联反应、大位阻路易斯酸促进下的乙烯基加成反应、溶剂和酸控制的立体选择性构建环丙烷、烯烃复分解关环反应、选择性氧化等关键反应,简洁高效地完成了巴豆烷二萜普罗斯左汀的全合成。其中模块化快速构筑三环核心骨架以及立体选择性构建多个连续手性中心的合成策略,将对未来相关二萜天然产物的合成研究以及药物化学研究具有重要意义。

相关论文以“Total Synthesis of (±)-Prostratin”(普罗斯左汀的全合成)为题,发表在Cell出版社的化学旗舰期刊*Chem*(影响因子14.104)上。西安交大前沿院博士生佟广虎为本论文的第一作者,西安交大前沿院为本文的第一作者单位和通讯作者单位。这是李鹏飞教授课题组在天然产物全合成领域继*Org. Lett.* 2014, 16, 2288之后的又一重要突破。

该项工作得到了国家自然科学基金面上项目和西安交通大学前沿科学技术研究院的支持。

文章链接: <https://www.sciencedirect.com/science/article/pii/S2451929418304765>

文字: 前沿院
编辑: 程洪莉

相关文章

读取内容中, 请等待...

