

贾彦兴团队实现了天然产物蓝萼甲素的首次全合成

天然药物仿生药物国家重点实验室 2020-06-16

Angewandte
International Edition
Chemie

GDCh

A Journal of the
German
Chemical Society

Communication | Full Access

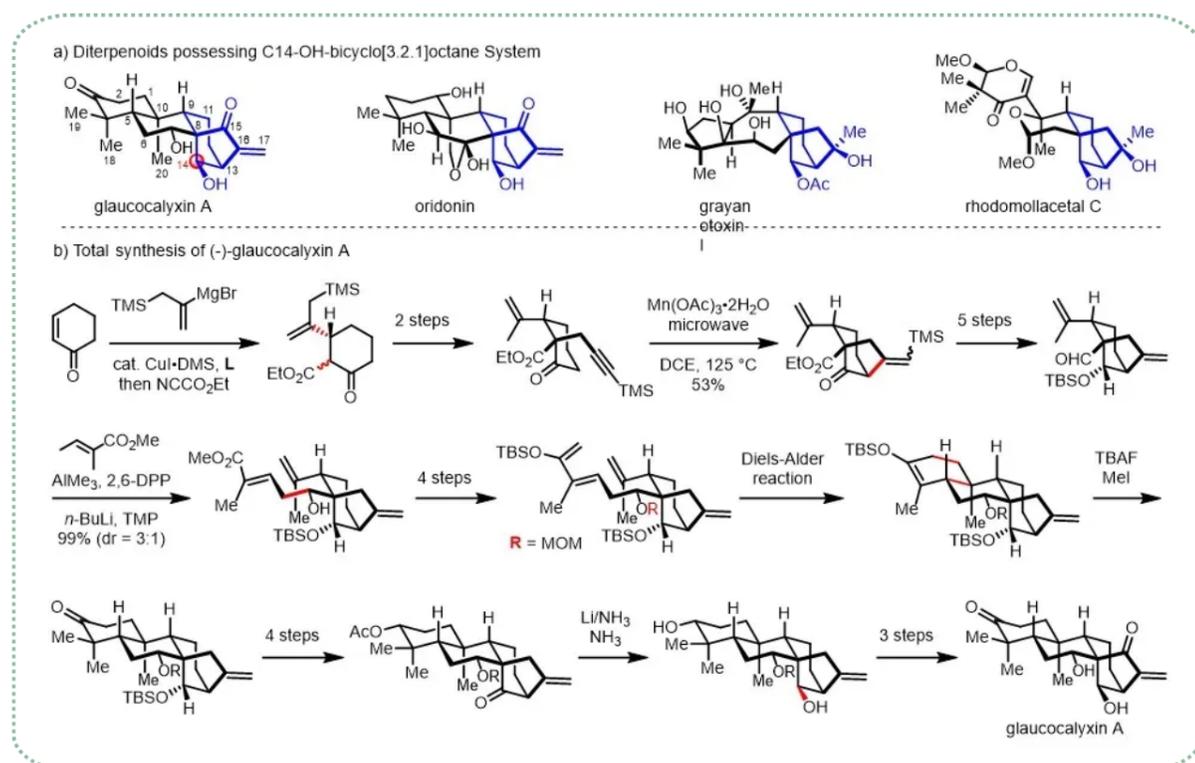
Total Synthesis of (-)-Glaucocalyxin A

Jiuzhou Guo, Bo Li, Weihao Ma, Dr. Mallesham Pitchakuntla, Prof. Yanxing Jia

First published: 19 May 2020 | <https://doi.org/10.1002/anie.202005932>

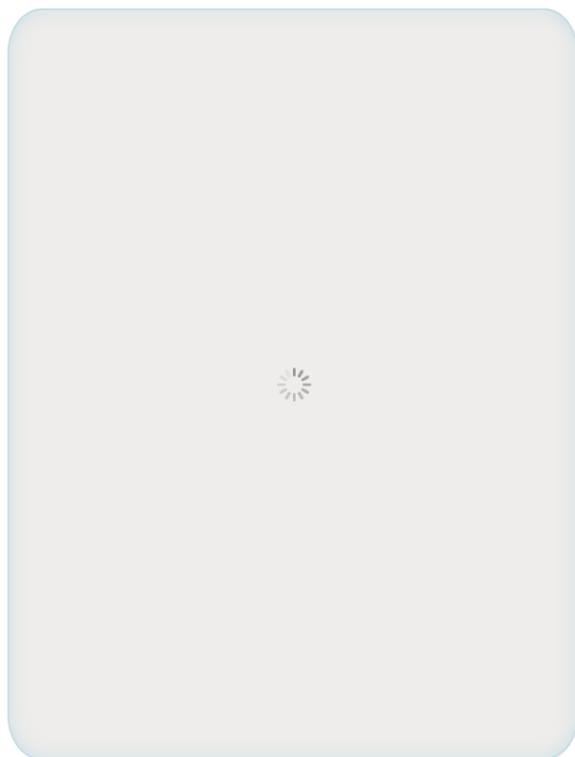
6月15日,《德国应用化学》(*Angew. Chem. Int. Ed.*) 期刊在线刊登了我室贾彦兴教授团队在天然产物全合成领域的最新研究成果:“Total Synthesis of (-)-glaucocalyxin A”。该工作同时被编辑选为Hot Paper。

二萜类天然产物由于具有复杂的化学结构和良好的生物活性,其全合成一直是合成化学的热门研究领域。然而,具有14-羟基[3.2.1]桥环结构的二萜(图a),由于其连续手性中心多、合成挑战性更高,而鲜有全合成报道。蓝萼甲素(Glaucocalyxin A)则是该类二萜的代表分子之一,其不仅具有良好的抗肿瘤与抗炎活性,而且结构复杂,包含四个全碳环和7个连续的手性中心,至今没有全合成报道。



贾彦兴教授团队通过一系列高立体、化学选择性反应实现了蓝萼甲素的首次不对称全合成(图b)。该研究从环己烯酮出发,经不对称迈克尔加成串联酰基化、Mn(OAc)₃介导的自由基环化构筑关键氧代[3.2.1]桥环、分子内Diels-Alder反应构筑天然产物骨架和后期升高氧化态,最终实现了蓝萼甲素的首次全合成;该研究不仅为蓝萼甲素及其衍生物的药学研究提供了物质基础,也为更多含有氧代[3.2.1]桥环结构天然产物的合成开辟了新思路。

2012级六年制硕士郭九州与2018级博士生李波为该论文的共同第一作者。该工作得到了国家自然科学基金委项目的资助。



贾彦兴教授长期从事天然产物合成及药物化学方面的研究，聚焦于具有重要生物活性且来源稀缺的复杂天然产物高效全合成研究。为了解决具有重要生物活性且来源稀缺的复杂天然产物的来源问题，建立了多个仿生合成新策略和新方法，实现了60多个天然产物的高效全合成，大幅度提升了部分目标产物的合成效率，解决了天然来源稀缺的难题，为深入研究其生物学功能及药物开发提供了物质保障，取得一系列具有国际影响力的原创性成果，服务国家药物创新重大需求。在此基础上，发现角蒿酯碱和它的两个类似物有望开发成新型治疗神经性疼痛的药物。

以通讯作者在国际高水平期刊发表论文60余篇，获批4项专利。曾获2019年国家自然科学基金委杰出青年基金、2019年第四届中国药学会-以岭生物医药创新奖、2011年中美化学与化学生物学教授联合会“杰出青年教授奖”、2010年和2013年两次亚洲核心计划学术报告奖、2009年入选教育部新世纪优秀人才支持计划和2008年第十一届中国药学会-施维雅青年药物化学奖等。

扫描二维码获取更多信息

编辑：宋书香
排版：周 林

[阅读原文](#)