



广州生物院完成天然产物Aspidophytine全合成

文章来源：广州生物医药与健康研究院

发布时间：2013-06-08

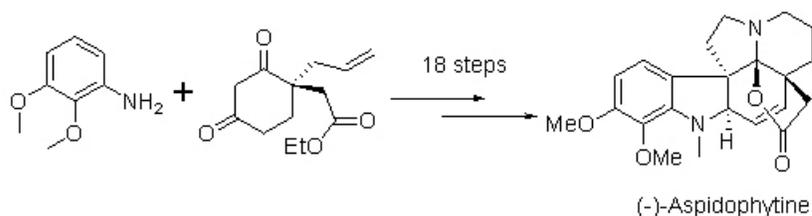
【字号：小 中 大】

Aspidophytine属于Aspidosperma类生物碱的一种。由于结构新颖，引起了合成化学家的广泛兴趣。但直到1999年，哈佛大学的诺贝尔奖得主E. J. Corey才率先完成了其全合成，随后许多著名的学者也相继报道了其全合成。截至目前，已有四位著名学者完成了其不对称全合成，一位完成了消旋体的全合成，但是所有文献报道的合成路线都存在一定的局限性。

中科院广州生物医药与健康研究院邱发洋研究组，根据aspidosperma类生物碱均含有共同的ABCDE五环基本骨架，且这类生物碱数目众多、生物活性良好等特点，开发了一条合成Aspidosperma类生物碱的通用路线，并且以aspidophytine为例诠释了通用合成路线的具体内容。以市售的2,3-二甲氧基苯胺和1,3-环己二酮为起始原料经过碳氢活化首先高效率地构建ABC三环，然后通过C环的季碳手性中心诱导DE环的不对称合成，最后引入C环双键和五元内酯环。

该合成路线对起始原料具有普遍性，是合成aspidosperma类生物碱的通用方法。在构建该分子的过程中，高效率引入手性、碳氢活化合成咪唑环以及可靠的手性控制方法使得合成效率大幅度提高。因此，该合成路线不仅具有较高的学术价值，还为aspidosperma类生物碱的结构改造和开发利用奠定了基础。

相关论文发表在*Angewandte Chemie International Edition*(Vol 52, pp 6015-6018)杂志上。



广州生物院完成天然产物Aspidophytine全合成

[打印本页](#)
[关闭本页](#)