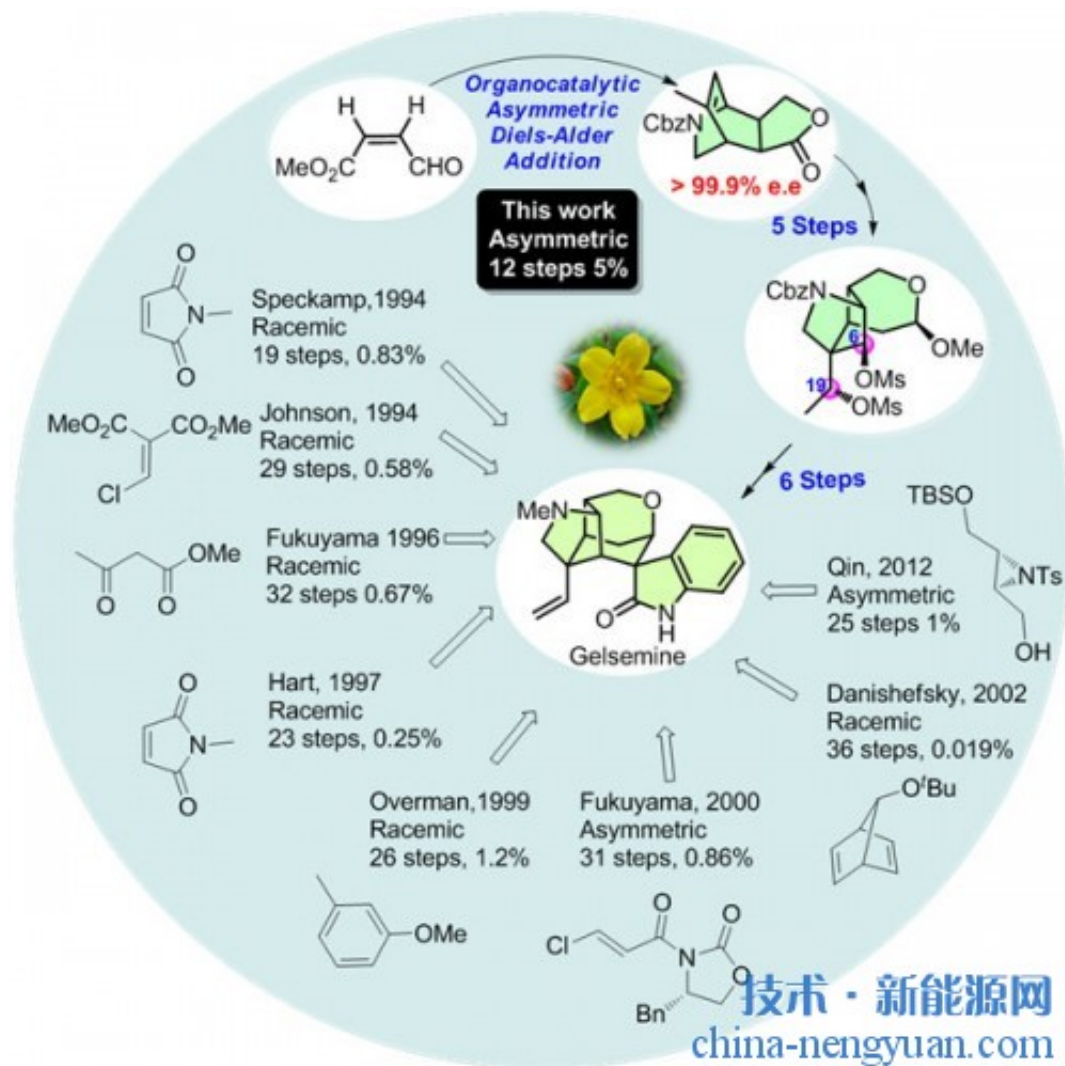


广州生物院合作完成高难度天然产物分子的全合成



中国科学院广州生物医药与健康研究院邱发洋研究组通过与兰州大学教授翟宏斌研究组合作，采用全新的合成路线设计，巧妙地完成了高难度的天然产物分子Gelsemine的全合成，这一研究成果已于5月21日发表在《自然·通讯》上。这一研究成果标志着我国在有机化学的核心，即高难度天然产物分子的全合成研究领域已经达到了国际先进水平。

天然产物的全合成是有机化学的核心研究领域，与新药发现中的结构修饰、药物合成、日用化工产品及农药的生产等领域息息相关，具有举足轻重的地位。高难度天然产物分子的全合成研究代表着有机化学核心研究领域的发展高度。

Gelsemine是一个从钩吻属植物中分离得到的结构非常复杂的生物碱。最近研究发现该生物碱具有类似吗啡的镇痛活性，但没有吗啡的副作用。因此，Gelsemine有可能成为新一代镇痛药物。由于Gelsemine结构复杂，如何立体选择性地构建Gelsemine一直是合成化学研究的热点和挑战。此前国际上已经有八个该天然产物分子的全合成，其中两个为不对称全合成。包括几个世界顶级的合成化学研究组所完成的全合成在内，这些全合成的共同问题是路线长，而且总产率偏低，合成效率不太理想。因此，Gelsemine的全合成依然是全世界合成化学家所面临的重大挑战。

邱发洋研究组通过与翟宏斌研究组合作，首次利用有机小分子催化的不对称Diels-Alder环加成、分子内跨环的羟醛缩合、氧化吲哚的加成偶联及分子内亲核取代等12步反应完成了Gelsemine的对映选择性全合成，总产率达到5%（参见X. Chen, S. Duan, C. Tao, H. Zhai, F. Qiu; Nat. Commun. DOI: 10.1038/ncomms8204）。这是迄今关于Gelsemine的最有效的全合成，不但合成路线大大缩短，而且总产率成倍提高。这项成果将Gelsemine的全合成研究推到了一个新的高度，为进一步研究Gelsemine的成药性能打下了坚实的基础。

原文地址：<http://www.china-nengyuan.com/tech/77888.html>