# 长春应化所吲哚类天然产物全合成研究获进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/12198.html

*本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！*

Dippinine-Chippiine类天然产物（图1，1－11）是依波加天然产物次级代谢物中的一个亚家族，具有独特的强刚性[6.5.6.6.7]稠环骨架，尤其是所含的手性氮杂[3.3.1]桥环骨架，在吲哚类天然产物中较为罕见。此外，分子中含有包括桥头手性季碳在内的多个手性中心，且受C20位绝对构型的影响，Dippinine类分子（2－6）中的全碳六元环为椅式构象，而Chippiine分子（8－10）中的六元环为船式构象。活性方面，该类天然产物对逆转肿瘤细胞的耐药性，具有潜在的良好活性。基于其独特、新颖、复杂的结构特征带来合成上的挑战性以及潜在的生物活性，开展此类天然产物的全合成研究，对推动有机合成新方法、新策略的发展，对深入开展相关天然产物及其新型类似物生物活性的研究，均有重要科学意义。

近日，中国科学院长春应用化学研究所所韩福社课题组在报道了Dippinine-
C
hip
piine同
系天然产物(+)-Tronocarpine（图1，1）的首次不对称全合成及其绝对构型确定后（*Angewandte Chemie International Edition*, Frontispiece cover; Tetrahedron），在该领域的研究中再次取得重要进展。研究设计并发展出以吲哚-内酰胺衍生物12（图2）与丙烯醛衍生物的不对称Michael/aldol串联反应构建手性氮杂[3.3.1]
桥环骨架衍生物（13和14）、分子内氮杂$S_N$
2’反应构建含氮七元杂环（15→16；18→19）、Stille偶联引入[3.3.1]桥环侧基官能团（16→17）及催化剂控制的立体选择性氢化（19→9－11）等为关键反应的发散式合成路线策略，实现了系列依波加次级代谢天然产物dippinine B（4）和C（5），10,11-demethoxychippiine（9），3-O-methyl-10,11-demethoxychippiine（10）、3-hydroxy-3,4-secocoronaridine（11）五个天然产物的首次不对称多样性全合成，以及C11位脱甲氧基demethoxydippinine A（3）和demethoxydippinine D（7）两个类似物的不对称合成。该研究发展建立的合成新策略和方法对该家族中其他天然产物的合成具有重要参考价值，对于深入开展此类天然产物及其类似物生物活性研究奠定了重要基础。

相关研究成果发表在*Angewandte Chemie International Edition*上，并被*JACS*主编Carreira在*Synfacts*
上进行亮点工作介绍。长春应化所博士生周杰、谈东兴（共同第一作者）为论文第一作者，研究工作得到国家自然科学基金委员会的资助。

论文链接

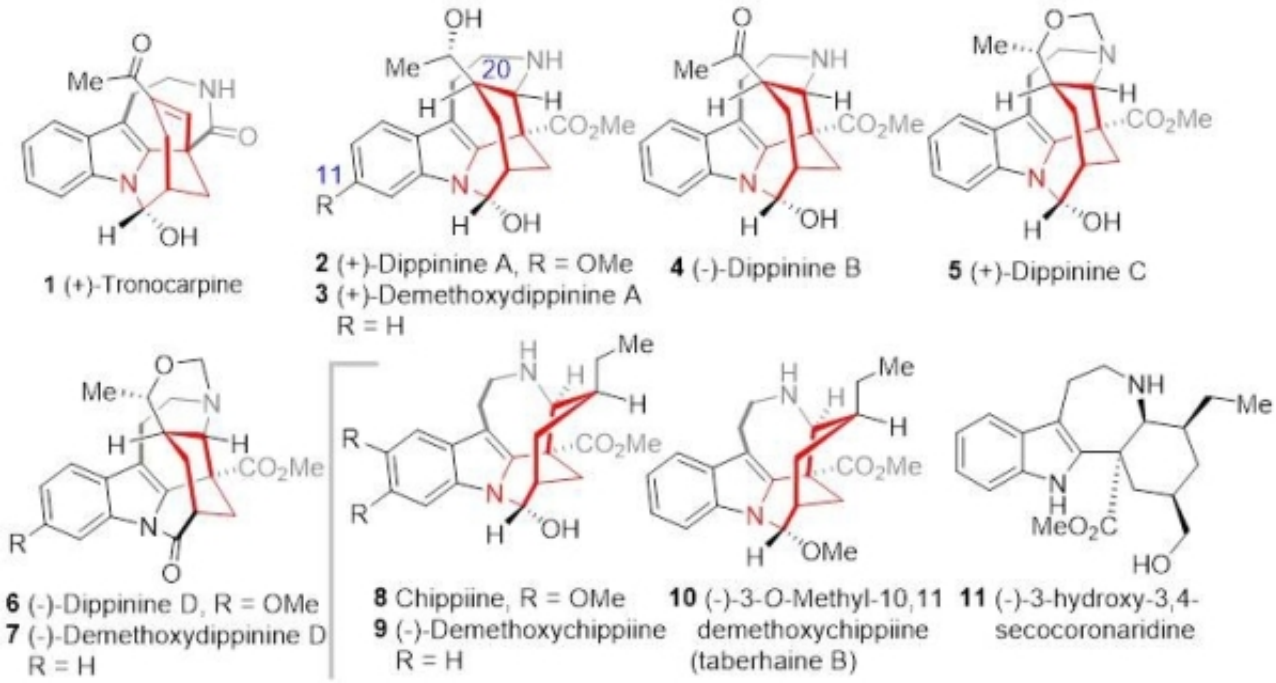



图1.部分Dippinine-Chippiine类天然产物的结构

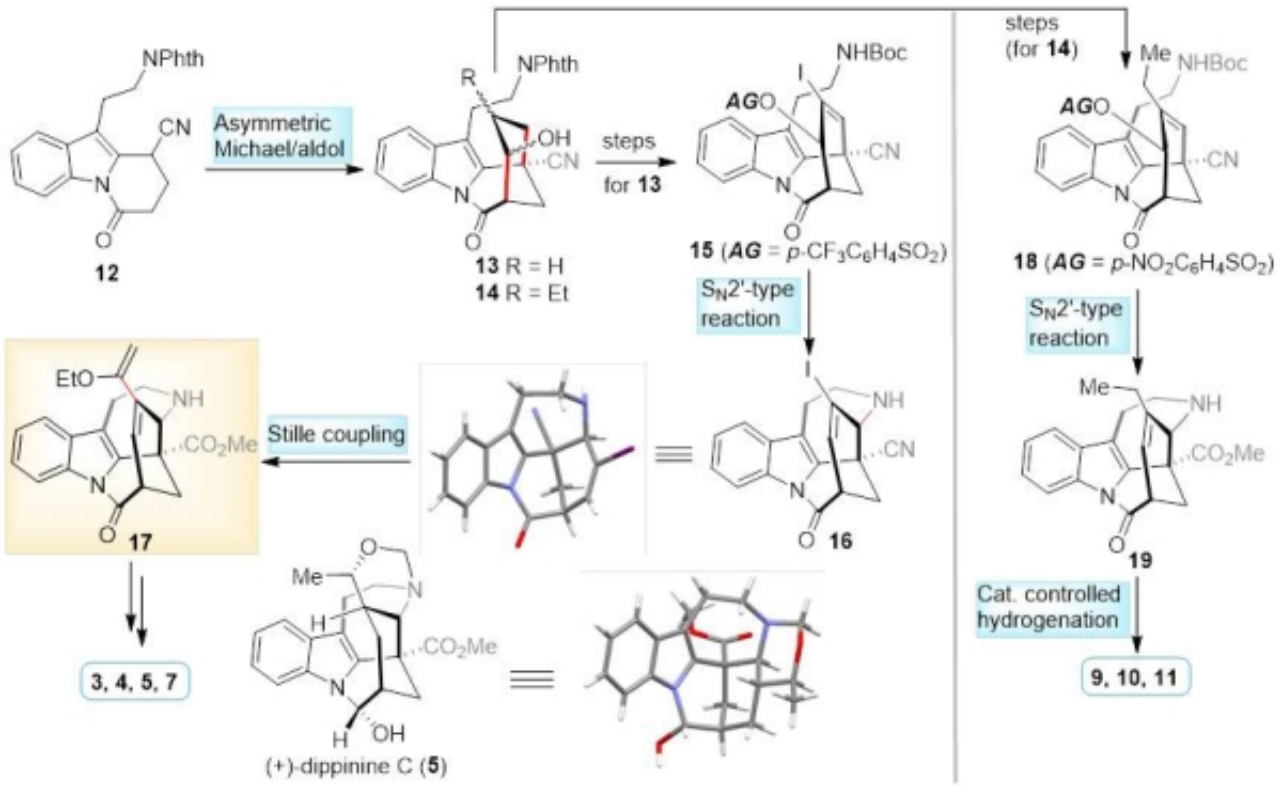



图2.部分Dippinine-Chippiine类天然产物的合成路线

研究团队单位：长春应用化学研究所

更多 科学进展 请访问 https://www.iikx.com/news/progress/

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，爱科学iikx.com转发