

昆明植物所完成霍山石斛多糖11糖和龙眼多糖 α -葡萄糖苷高达30糖的首次化学全合成

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/13571.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！

糖类化合物是生命的三大基础物质之一，在生命过程中具有重要作用，如细菌和病毒的感染、细胞生长和增殖、免疫反应等。从自然界中分离提取纯的和结构均一的糖类化合物是一项艰巨的工作。化学合成是一种有效的和可规模化的方法来得到纯的和结构确定的糖类化合物，从而可以深入研究其功能和发展新的治疗药物。然而，由于糖类化合物合成中的区域和立体选择性问题，高效化学合成长的，含有许多1, 2-顺式糖苷键，糖单元超过10的糖类化合物的例子还非常稀少。因此，发展合成策略来实现该类化合物的高效合成依然重要，也是化学合成中长期存在的问题。

中国科学院昆明植物研究所天然产物合成化学团队肖国志课题组主要从两方面开展糖化学合成研究工作：发展糖化学合成的新方法和新策略；对具有重要生物活性的糖类天然产物进行化学合成和生物活性研究。

2019年，课题组报道了基于俞氏糖苷化反应的正交一锅糖苷化反应新策略（Org. Lett. 2019, 21,

Angew. Chem. Int. Ed. 2020, 59, 7576）。2020年初，课题组发展出一种基于糖基邻1-苯基烯基苯甲酸酯（PVB）给体同时适用于氧苷和核苷高效合成的糖苷化反应新方法（Nat. Commun. 2020, 11, 405）。2021年初，课题组首次发展了基于糖基PVB给体同时适用于氧苷和核苷的一锅糖苷化反应糖组装新策略，并应用于TMG-chitotriomycin、糖脂寡糖和核苷抗生素Capuramycin的高效合成（Chem. Sci. 2021, DOI: 10.1039/D0SC06815B）。近日，该课题组完成了霍山石斛多糖11糖和龙眼多糖 α -葡萄糖苷高达30糖的首次化学全合成。

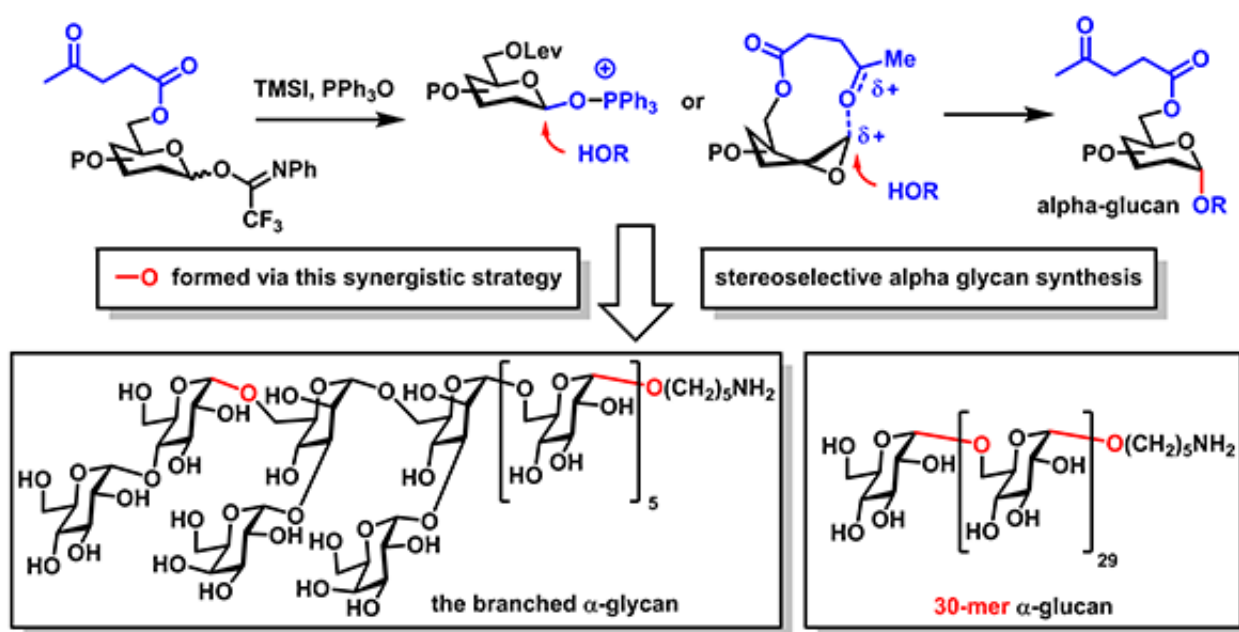
课题组在进行立体选择性构建1, 2-顺式的葡萄糖糖苷键的反应优化中发现，6-O-乙酰丙酰基保护的葡萄糖给体要比6-O-乙酰基或苯甲酰基保护的给体得到更好的立体选择性（a:b> 20:1）。为了理解乙酰丙酰基比乙酰基或苯甲酰基具有更好立体选择性的原因，课题组和山东大学教授陆刚团队合作，进行密度泛函理论（DFT）计算，解释了得到更好的立体选择性原因。该课题组考察了底物适用范围，研究发现多种脂肪伯醇、糖环上伯醇和仲醇、胆固醇均可以高立体选择性的构建1, 2-顺式的葡萄糖糖苷键。

进一步，该课题组应用该策略实现了具有免疫活性的分支的霍山石斛11糖和具有抗癌活性的线性的龙眼 α -葡萄糖苷含有高达30个1, 2-顺式的葡萄糖糖苷键的高立体选择性首次化学全合成。相关

研究成果以Merging reagent modulation and remote anchimeric assistance for glycosylation: highly stereoselective synthesis of α -glycans up to a 30-mer

为题，发表在《德国应用化学》上，博士研究生张云琴为论文第一作者，研究员肖国志与陆刚为论文通讯作者。

[论文链接](#)



Angew. Chem. Int. Ed. 2021, DOI:10.1002/anie.202103826

昆明植物所完成霍山石斛多糖11糖和龙眼多糖 α -葡萄糖苷高达30糖的首次化学全合成

研究团队单位：昆明植物研究所

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