
上海有机所阿扎菲酮型天然产物合成研究获进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/25214.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！

阿扎菲酮 (azaphilone) 是一类含有吡喃醌母核或其变体的聚酮天然产物，具有抗肿瘤、抗菌、抗炎等生物活性。Acremolactone B (1) 是Sassa等在真菌 *Acremonium roseum* 14267中发现的结构独特的阿扎菲酮型天然产物，含有一个四取代吡啶环和五个连续手性中心。该分子具有良好的除草活性，但它的自然稀缺性限制了进一步的生物学研究。

中国科学院上海有机化学研究所生命过程小分子调控全国重点实验室李昂课题组致力于芳香天然产物的合成研究，系统发展了电环化-芳构化策略，用于构建多取代芳环，实现了daphenylline、rubriflordilactone A、xiamycin A、clostrubin、rubriflordilactone B、aflavazole、ileabethoxazole、pseudorubriflordilactone B等天然产物的合成。

近期，该课题组运用氮杂-6 电环化-芳构化策略，实现了acremolactone

2；将该烯醛转化为相应的肟（3），并与烯基硼酸酯4进行Suzuki-Miyaura偶联，得到氮杂三烯5

6。2与4直接偶联所得的共轭二烯醛7

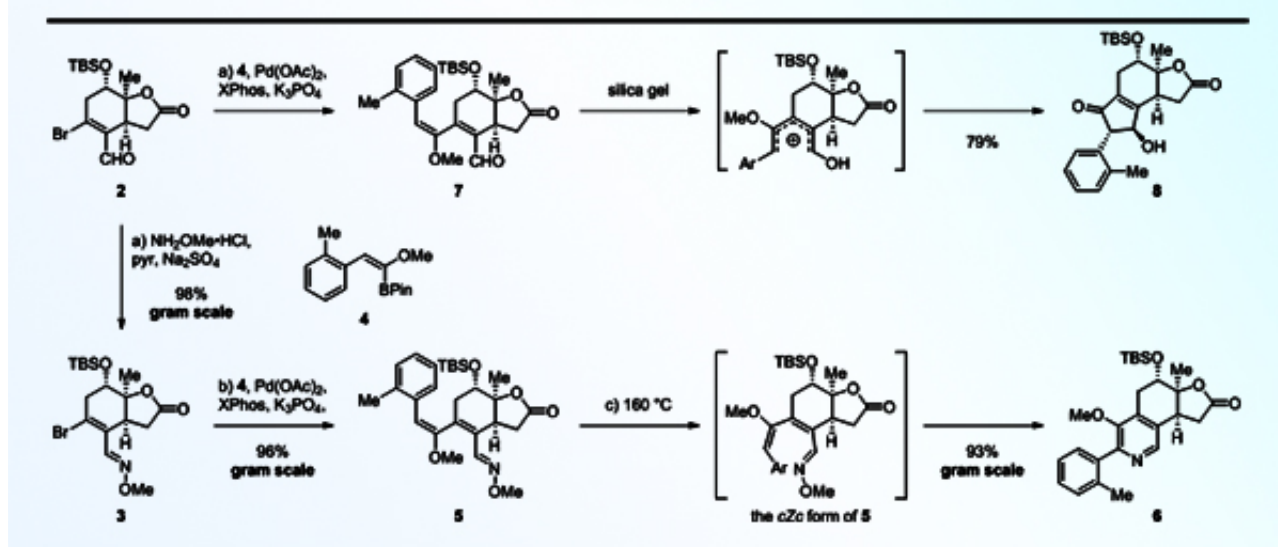
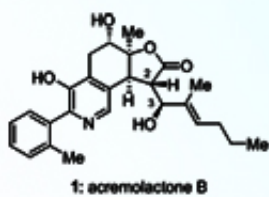
易于发生iso-

Nazarov环化反应进而转化为环戊烯酮8

。环化途径的不同源自于醛和肟在亲电性方面的差异。研究通过C2位酰基化和C3羰基的非对映选择性还原引入侧链并建立所需的立体化学，完成了acremolactone B的克级规模合成。该工作展示了电环化-芳构化策略在杂芳香天然产物合成中的作用，为acremolactone B生物学功能研究奠定了物质基础。

研究工作得到国家自然科学基金委员会、中国科学院、科学技术部和上海市科学技术委员会等的支持。

[论文链接](#)



阿扎菲酮型天然产物acremolactone B合成的关键步骤

研究团队单位：上海有机化学研究所

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](http://www.iikx.com)转发