
上海有机所在活性小分子高效创制方面取得进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/26862.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！

孕甾皂苷大量存在于夹竹桃科植物，具有多样的生理活性。它们由孕甾和糖链组成，糖链部分含有大量2,6-二脱氧糖。此前，中国科学院上海有机化学研究所俞飏团队完成了一系列结构复杂的孕甾皂苷化学全合成。

中药酸叶胶藤具有消炎功效，其相关植物中含有大量孕甾皂苷，被分离鉴定的包括ecdysosides A、B、F及同系物ecdysantheroside A等。这些分子具有独特的18,20-内酯结构及高度氧化的D环。俞飏团队基于汇聚式合成策略，分别合成了其中的孕甾苷元和2,6-二脱氧糖链片段，利用俞氏糖苷化反应进行组装，完成了目标分子的全合成。然而，合成化合物与报道的天然产物的谱学数据并不吻合。

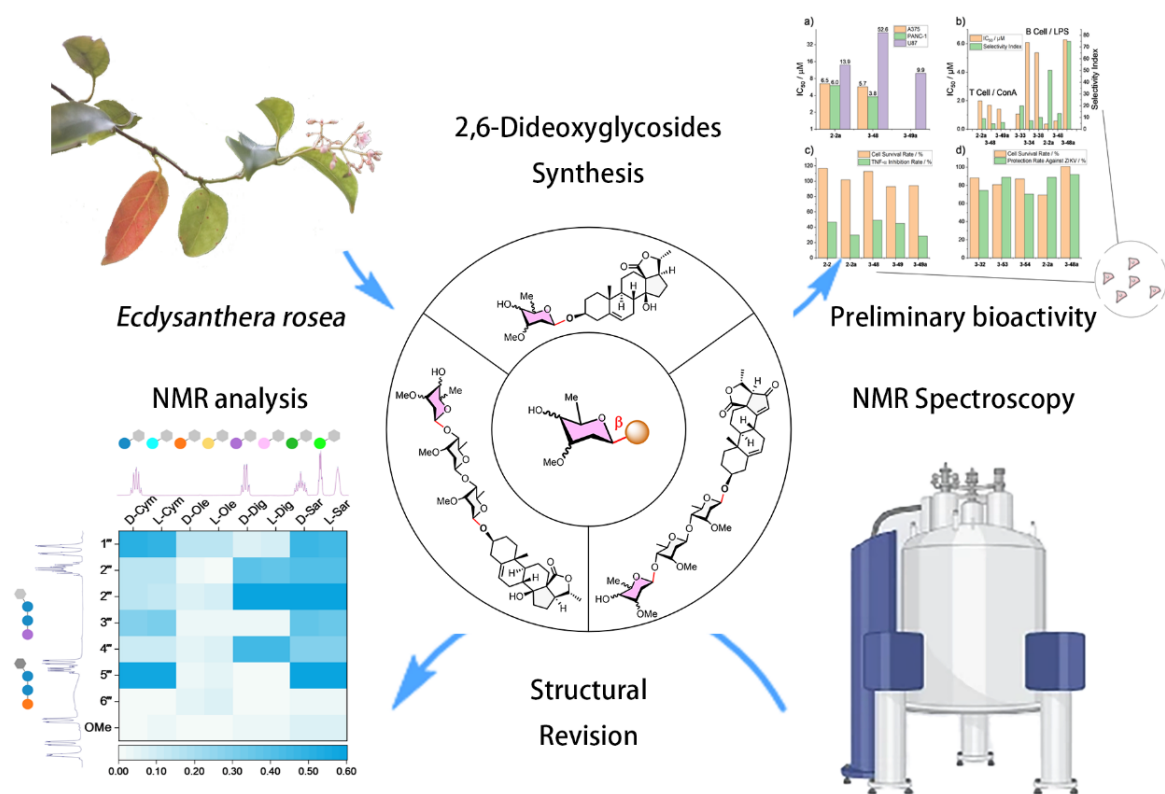
为了确证该天然分子的结构，团队合成了对应ecdysantheroside A的所有可能的八个2,6-二脱氧糖苷立体异构体。通过核磁数据比对，研究人员将ecdysantheroside A的报道结构从d-磁麻糖苷修正为d-齐墩果糖苷。进一步，研究通过核磁数据分析和全合成，解析了三糖苷ecdysosides B和F的真实结构，揭示其末端糖基分别为d-齐墩果糖和d-迪吉糖。在标准的活性筛选实验中，部分合成的天然产物和类似物表现出显著的抗肿瘤、免疫抑制、抗炎及抗ZIKV病毒活性等特性。

该工作合成的2,6-二脱氧-β-吡喃糖苷的所有八个立体异构体的核磁数据将为天然孕甾糖苷及相关分子的结构鉴定提供可靠参照。

酸叶胶藤孕甾皂苷展现的多种生物活性为下一步化学生物学研究奠定了基础。

近日，相关成果以Merging total synthesis and NMR technology for deciphering the realistic structure of natural 2,6-dideoxyglycosides为题发表在《科学进展》(Science Advances)上。

相关工作得到国家自然科学基金委员会、科学技术部、中国科学院和上海市科学技术委员会的支持。



酸叶胶藤孕甾皂苷的结构修正和活性评价

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