

糖类化合物合成的难度有望大大降低

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/27881.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！

糖类化合物合成的难度有望大大降低。近日，四川大学华西生物治疗全国重点实验室/化工学院教授钮大文团队联合北京大学深圳研究生院教授吴云东在《自然》上发表文章。研究开发了一个通用平台，用于未保护或受保护程度极低的供体和受体之间进行位点、立体和化学选择性O-糖基化反应。

糖被称为第三生命链，在生理病理过程、重大疾病诊断、小分子药物研发、大分子靶向药物递送、免疫治疗等领域都发挥着不可或缺的作用。要研究和开发糖的功能，亟需高效、简洁的方法对这些结构复杂的分子进行化学合成。然而，由于糖类结构复杂，具有多个手性中心和羟基，如何实现选择性控制是糖类合成长期面临的挑战。多年来，化学家们一般通过繁琐的保护基操作来控制O-糖苷化过程中的选择性，这极大地增加了合成工作的复杂性。而如何摆脱保护基的依赖，实现糖苷键直接高效、高选择性构建，是该领域长期悬而未决的科学难题。

研究团队设想通过催化剂控制策略来实现未保护糖之间的精准O-糖苷化。在前期工作中，团队建立了通过自由基策略将稳定易得的烯丙基糖基砜转化为活性糖基亲电试剂的方法。这个糖供体活化策略已被证明能够兼容包括游离羟基在内的大多数极性官能团，为开发不依赖保护基的催化体系提供了可能。团队进一步设想设计催化剂将原位产生的亲电糖供体2和糖受体5通过可逆相互作用（如多个非共价和可逆共价作用）组装在一起，像酶催化过程一样限制底物的运动自由度，实现未受保护的糖受体和供体间选择性O-糖苷化。

基于这一设想，研究团队设计开发了一类氨基硼酸催化剂，通过与糖的非共价氢键和可逆共价B-O键的相互作用，结合自由基活化烯丙基糖基砜形成糖基溴化物的策略，实现了不依赖保护基的选择性O-糖苷化。此外，通过调控氨基硼酸催化剂的结构，能够精准调控O-糖苷化的位置选择性。

该研究利用催化剂实现了高选择性糖基化反应，为糖化学领域中选择性控制这一长期挑战带来了全新思路，有望极大降低糖类化合物合成的难度，为探索糖类化合物的功能提供技术支撑，代表了糖化学领域的重大进展。（来源：中国科学报 杨晨）

相关论文信息：<https://doi.org/10.1038/s41586-024-07695-4>

作者：钮大文等 来源：《自然》

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](https://www.iikx.com)转发