

---

# 天津工生所在酶促对映选择性还原 $\alpha,\beta$ -不饱和亚胺

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/3474.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！*

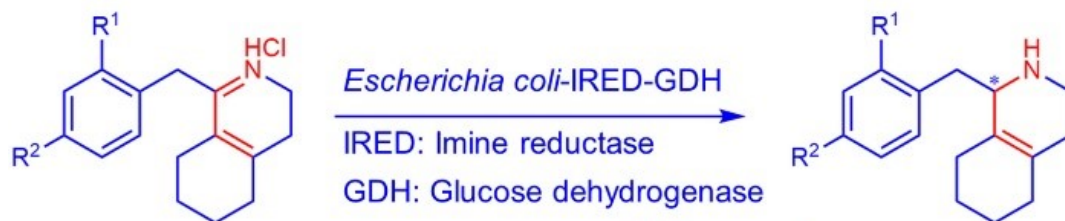
天津工生所在酶促对映选择性还原  $\alpha,\beta$ -不饱和亚胺。吗啡烷是许多具有生物活性的天然产物及药物(如镇咳药物右美沙芬)的骨架结构，可以由关键中间体1-苄基八氢异喹啉衍生物经三步化学反应获得。该中间体的合成方法有经典的拆分法、过渡金属不对称催化氢化法以及环己胺氧化酶与硼胺结合的去消旋化法，但是这些方法普遍存在立体选择性差、生产成本低、原子经济性差或环境污染严重等缺点。

中国科学院天津工业生物技术研究所研究员朱敦明、吴洽庆带领的生物催化与绿色化工团队，利用亚胺还原酶(Imine Reductase, IRED)对映选择性还原了一系列  $\alpha,\beta$ -不饱和亚胺(1-苄基六氢异喹啉衍生物)，成功有效制备了相应的1-苄基八氢异喹啉衍生物，为该类化合物的合成提供了一种有效的生物催化方法。该研究通过利用右美沙芬前体底物对亚胺还原酶库进行筛选，发现其中有两个酶表现出最高且互补的立体选择性，对映体过量值达到98%(S)和>99%(R)，催化效率分别为 $5.4 \times 10^{-2}$  及  $24.1 \times 10^{-2}$  S<sup>-1</sup> mM<sup>-1</sup>；在此基础上建立了实验室规模制备反应，产物分离收率分别为74%及80%。其后在对前体底物对位及邻位含不同取代基的衍生物的制备反应中，得到一个更高空间适应性的酶，对8种底物均能获得很高的立体选择性及分离产率，相对该类化合物现有合成方法具有显著竞争优势。

该研究工作得到国家自然科学基金(21778072)、天津市科学技术委员会(15PTCYSY00020 和 15PTGCCX00060)的支持。相关研究成果近日发表在Advanced Synthesis & Catalysis期刊上，并被选为生物催化Hot Topic文章。天津工生所副研究员姚培圆和研究生徐泽菲为论文的共同第一作者。

文章链接

Hot Topic: Biocatalysis链接



R<sup>1</sup> = H, R<sup>2</sup> = F, Cl, Me or MeO  
R<sup>2</sup> = H, R<sup>1</sup> = F, Cl, Me or MeO

- 10 examples
- Up to 100% conversion
- High chemoselectivity
- R- or S- specific
- 94% to >99% ee

酶促对映选择性还原，-不饱和亚胺合成吗啡烷关键中间体

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