

---

# 研究开发出一种糖环双位点选择性C-烷芳基化反应

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/36951.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！

## 研究开发出一种糖环双位点选择性C-烷芳基化反应

。众多临床药物和活性分子均以糖结构为核心骨架，

药物研发往往需要对糖环多个位点进行差异化修饰，构建具有三维结构多样性的分子库，从而筛选出更高活性的候选药物。现有糖烯双碳官能化技术既难以实现差异化碳基官能团的同步引入，也无法对最终产物的立体构型进行精准构筑。

针对这一难题，

中国科学院成都生物研究所提出了双重立体控制反应机制的解决方案：通过糖烯C3位取代基的“空间导向”作用，以及自由基Smiles重排过程中的顺式耦合双环过渡态，使反应高效生成1,2-顺式、2,3-反式构型的产物。以葡萄糖烯为模型底物时，目标产物2-C-支链芳苷的产率达84%，且仅生成 $\alpha$ -构型，解决了传统反应“立体混乱”的难题。

通过该策略，研究团队实现了对不同保护基烯糖的精准C-烷芳基化，制备了一

系列结构多样性的2-C-

支链芳苷。从葡萄糖、半乳糖等单糖到纤维二糖、乳糖等

二糖衍生的糖烯，均能高效参与反应，甚至含游离羟基的糖烯也能转化为目标产物，省去了繁琐的保护基操作。此外，反应还兼容卤素、酮基、酰胺基、磷酸酯基等多种官能团，可轻松引入糖、氨基酸、肽等复杂结构片段，芳基范围也涵盖苯环、吡啶、嘧啶、噻吩等，为构建多样化糖衍生物库提供了充足原料。

为验证该方法的实用价值，研究团队开展了系统的下游衍生化与生物活性评估。初步生物活性测试显示，合成的2-C-烷基磷酸酯芳苷表现出优异的抗肿瘤潜力。

研究团队创新性地将光氧化还原催化与自由基Smiles重排相结合，开发出一种糖烯区域和立体选择性1,2-烷芳基化反应

，实现了糖环双位点的精准同步碳官能团化修饰，

为构建结构多样的复杂糖衍生物提供了模块化解决方案，有望加速糖基抗肿瘤药物、降糖药物等的研发进程。

相关研究成果以 *Streamlined Sugar Diversification via Photoredox-Catalyzed Regio- and Stereoselective*

---

*1,2-Alkylarylation of Glycals*为题，发表在《德国应用化学》上。

[论文链接](#)

糖环双位点高区域与立体选择性C-烷芳基化

研究团队单位：成都生物研究所

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