50多年前发现的天然分子首度人工合成

作者：writer 来源：科学网

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/37554.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！

50多年前发现的天然分子首度人工合成

。科技日报讯（记者刘霞）美国麻省理工学院与丹娜法伯癌症研究院的科学家合作，首次在实验室成功合成了天然真菌分子“轮枝孢菌素A”。该分子50多年前被首次发现，因其显著的抗癌潜力备受关注，但复杂的结构令其人工合成一直未能实现。相关研究成果发表于《美国化学会志》，有望开辟一类全新的抗癌药物研发路径。

在最新研究中，研究团队不仅实现了轮枝孢菌素A的全合成，还以此为基础设计出多种新型衍生物。初步测试显示，部分衍生物对一种罕见的儿童脑癌——弥漫性中线神经胶质瘤表现出强大的抗肿瘤活性。

轮枝孢菌素A于1970年首次从真菌中分离获得，是真菌用于抵御病原体的天然武器。

2009年，团队成功合成与之结构相近的“脱氧轮枝孢菌素A”。两者关键差异仅在于两个氧原子，但正是这“两氧之别”，使得轮枝孢菌素A的合成难度大幅增加——添加两个氧原子会导致分子稳定性下降，更加脆弱，所以更难合成。

为解决这一难题，团队从氨基酸衍生物β-羟色氨酸出发，逐步引入醇、酮、酰胺等化学官能团，并精准控制每一步的立体构型。历经16步精密反应，他们最终构建出轮枝孢菌素A分子。

在此基础上，团队进一步制备了多种轮枝孢菌素A变体。实验室细胞实验表明，其中一种衍生物对弥漫性中线神经胶质瘤细胞具有显著抑制效果。不过研究人员表示，仍需进一步研究以评估其临床应用潜力。

作者：刘霞 来源：科技日报

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