

---

# 复杂天然产物合成领域取得新进展

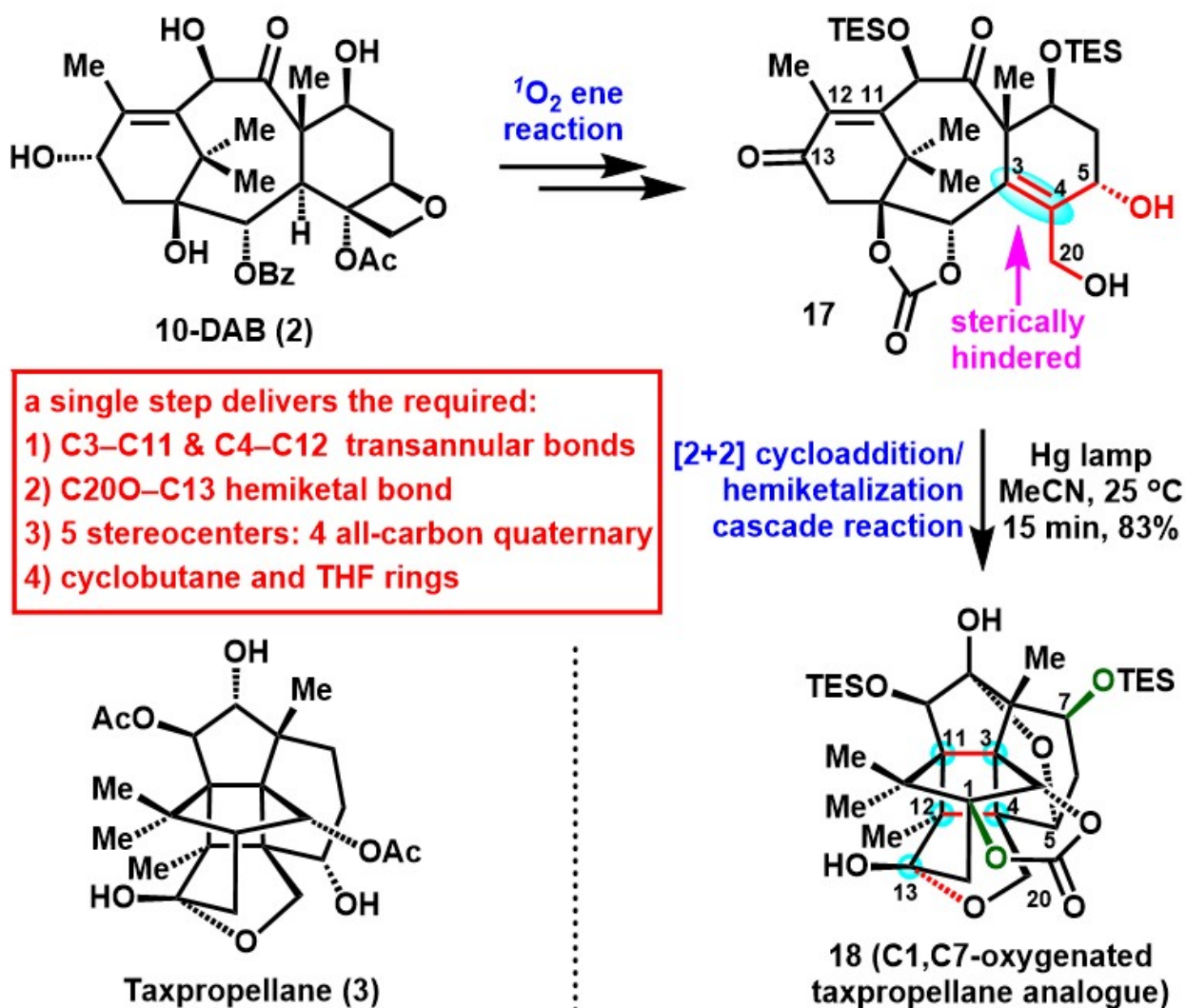
作者：writer 来源：科学网

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/40108.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！*

复杂天然产物合成领域取得新进展。近日，暨南大学先进与应用化学合成研究院副研究员胡亚剑、研究员何玉涛团队联合南方科技大学教授李闯创、江西科技师范大学讲师王进等合作者，在复杂天然产物合成领域取得重要进展。他们基于生物启发策略，成功实现了超复杂环紫杉烷Taxpopellane的C1,C7-氧取代类似物的高效半合成。相关成果发表于《德国应用化学》（Angewandte Chemie International Edition）。

紫杉烷是一大类二萜天然产物，目前已发现超过550个成员。许多天然紫杉烷具有重要的抗肿瘤活性，其中最著名的代表是抗癌药物紫杉醇（Taxol）。经典紫杉烷拥有[6-8-6]三环骨架，而非经典紫杉烷（如环紫杉烷）则通过额外的跨环键形成更为复杂的笼状结构。Taxpopellane是从红豆杉中分离出的一种环紫杉烷，其结构高度复杂：具有[6-4-5-5-6-5]六环骨架、11个手性中心、5个季碳，其中组成环丁烷的四个原子全部为季碳。这种结构在自然界中极为罕见，合成难度极大。目前尚无该天然产物的合成报道，但通过半合成获得其类似物，可为抗癌药物筛选提供新的先导化合物。



相关研究示意图。研究团队供图

在国家自然科学基金、广东省基础与应用基础研究基金等项目资助下，研究团队创新性地提出了一种新的仿生合成策略：利用单线态氧ene反应，从含有C4-C5双键和C20-羟基的前体出发，一步构建C3-C4四取代双键，绕过了传统的环氧化/开环两步过程。基于这一策略，以商业化的10-脱乙酰基巴卡亭III（10-DAB）为原料，经15步反应成功合成了Taxipopellane的C1,C7-氧取代类似物。关键步骤包括单线态氧ene反应和光诱导[2+2]环加成/半缩酮化串联反应，后者在15分钟内一步构建了两个跨环C-C键、一个C-O半缩酮键、四个季碳以及环丁烷和四氢呋喃环。利用该方法，研究团队快速制备了多个环紫杉烷衍生物。生物活性测试显示，多个合成的Taxipopellane类似物表现出明显的抗肿瘤活性。

该工作展示了仿生合成策略在复杂天然产物合成中的强大能力。所发展的单线态氧ene反应和光诱导[2+2]环加成/半缩酮化串联反应，不仅为Taxipopellane类似物的制备提供了高效路线，也为其他具有跨环键的复杂紫杉烷的合成提供了可借鉴的方法。此外，该研究揭示了经典紫杉烷与非经典紫杉烷之间的生源关联性，为进一步探索环紫杉烷这类复杂二萜天然产物的化学空间及生物学活性提供了科学依据。（来源：中国科学报 朱汉斌）

---

相关论文信息：<https://doi.org/10.1002/anie.9475391>

作者：胡亚剑等 来源：《德国应用化学》

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