

昆明植物所在糖化学合成研究中取得系列进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：<https://www.iikx.com/news/progress/8708.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！

糖类化合物在许多生命过程中扮演了非常重要的角色，如细菌和病毒的感染、细胞生长和增殖、免疫反应等。与通过基因调控的生物合成蛋白质和脱氧核糖核酸（DNA）相比，糖类化合物的生物合成不是基因调控的，而是在内质网和高尔基体中通过逐步的和酶的后翻译修饰的过程，从而导致了糖类化合物的非均一性和极其多样的结构。从自然界中分离提取纯的和结构均一的多糖是一项非常艰巨的工作。化学合成是一种有效的和可规模化的方法来得到纯的和结构确定的糖类化合物，从而可以深入研究其功能和发展新的治疗药物。然而，与通过自动化固相合成仪方便制备核苷酸和多肽相比，糖类分子的化学合成要落后得多，困难得多。

中国科学院昆明植物研究所天然产物合成化学团队肖国志课题组主要从以下两方面开展糖化学合成研究工作：（1）发展糖化学合成的新方法和新策略；（2）对具有重要生物活性的糖类天然产物进行化学合成和生物活性研究。

2019年该课题组报道了基于糖基邻炔基苯甲酸酯（俞氏糖苷化反应）的正交一锅糖苷化反应策略（*Org. Lett.* 2019, 21, 2335）。此策略解决了之前基于硫苷的正交一锅法合成所存在的硫苷苷元转移，离去基团干扰和硫醇味道大的问题，大大扩宽了其应用范围。此研究成果第一作者为博士研究生张云琴。

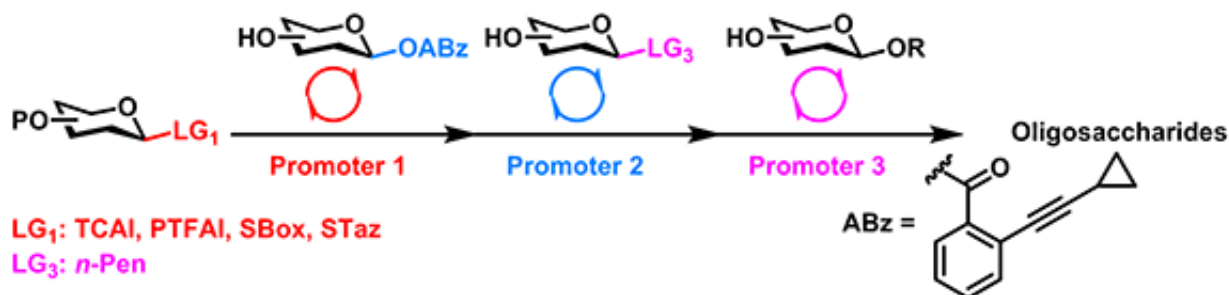
今年初，该课题组发展了一种新颖的糖苷化反应，可以实现对氧苷和核苷的高效合成（*Nat. Commun.* 2020, 11, 405）。此方法采用易于制备而且稳定的糖基邻1-苯基烯基苯甲酸酯(PVB)为新颖的糖基给体，N-碘代丁二酰亚胺（NIS）和三氟甲磺酸三甲基硅酯（TMSOTf）为便宜易得的促进剂，同时，具有反应条件温和、宽广的底物范围和良好到优秀的糖苷化反应收率。值得一提的是，PVB给体可以与三氯乙酰亚胺酯(TCAI)给体(Schmidt糖苷化反应)、糖基邻炔基苯甲酸酯（ABz）给体（俞氏糖苷化反应）结合进行正交一锅糖苷化反应，实现各种具有重要生理活性的寡糖的高效合成。同时，PVB给体也可以成功应用于核苷类抗生素药物卡培他滨、加洛他滨和去氧氟尿苷高效合成中。此研究成果第一作者为博士研究生李朋华、博士何海清和博士研究生张云琴。

近日，肖国志课题组报道了采用之前发展的正交一锅糖苷化反应策略实现了具有强抗糖尿病番石榴多糖的19糖重复单元和子结构的高效合成，从而可以深入研究其生物活性，为将来开发治疗糖尿病药物打下坚实基础。此研究成果在线发表于*Angew. Chem. Int. Ed.* (DOI: 10.1002/anie.202000992)。此研究成果第一作者为博士研究生张云琴、陈子汐和黄盈盈。

以上研究成果得到中科院“百人计划”、昆明植物所启动基金和国家自然科学基金（21907097）资助。

论文链接：[123](#)

Two-step or multistep orthogonal one-pot glycosylation based on glycosyl ABz (new strategy)

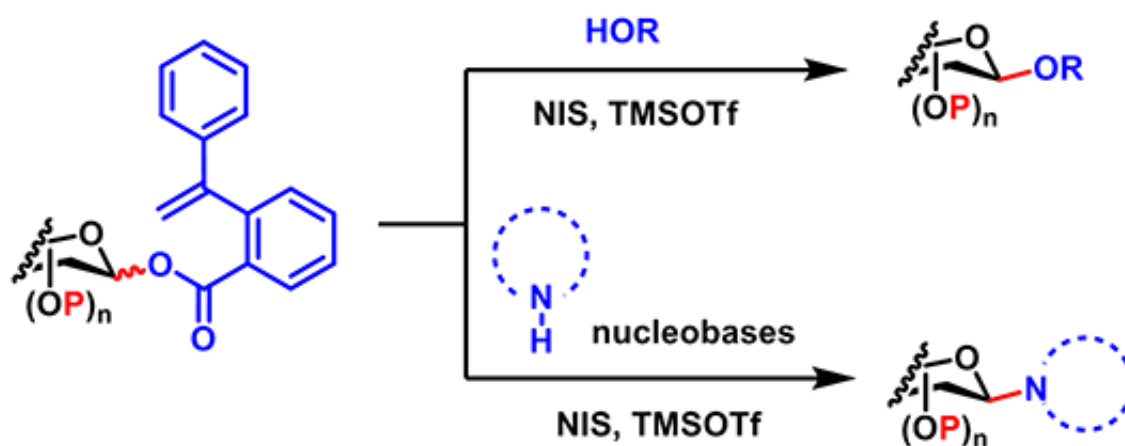


Glycosyl ABz:

- no aglycon transfers
- no undesired interference of departing species
- no unpleasant odor

Org. Lett. 2019, 21, 2335

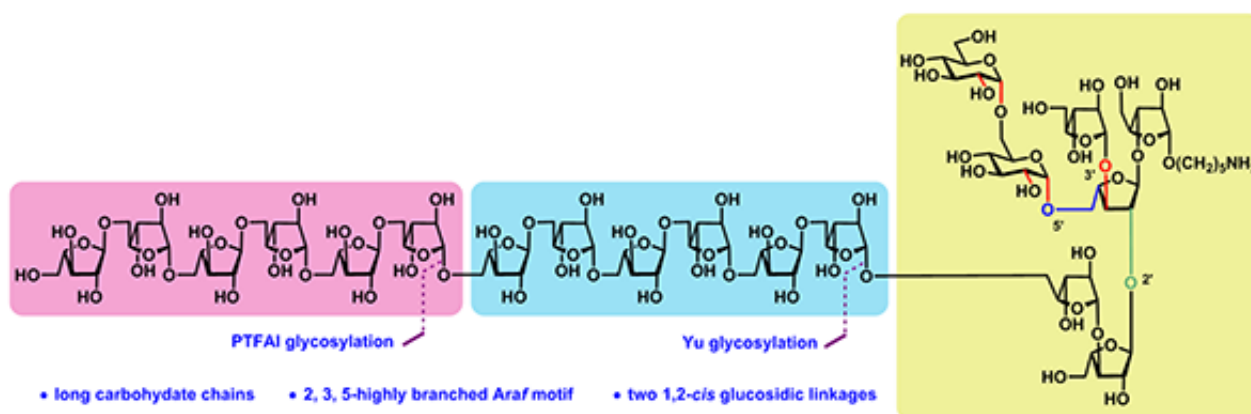
Glycosyl PVB for O-glycosides and nucleosides synthesis (new method)



PVB: *ortho*-(1-phenylvinyl)benzoates

- ✓ Readily prepared and stable donors
- ✓ Cheap and readily available promoters, and mild reaction conditions
- ✓ Good to excellent glycosylation yields
- ✓ Broad substrate scopes
- ✓ Suitable for O-glycosides and nucleosides synthesis
- ✓ Suitable for one-pot synthesis of oligosaccharides

Nat. Commun 2020, 11, 405



nonadecasaccharide from *Psidium guajava* polysaccharides with antidiabetic activity

Angew. Chem. Int. Ed. 2020, DOI: 10.1002/anie.202000992

研究团队单位：昆明植物研究所

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](https://www.iikx.com)转发