



面向世界科技前沿, 面向国家重大需求, 面向国民经济主战场, 率先实现科学技术跨越发展,  
率先建成国家创新人才高地, 率先建成国家高水平科技智库, 率先建设国际一流科研机构。

——中国科学院办院方针



官方微博



官方微信

首页 组织机构 科学研究 人才教育 学部与院士 资源条件 科学普及 党建与创新文化 信息公开 专题

搜索

首页 > 科研进展

## 上海有机所在亚硝基-烯反应和天然产物合成应用方面取得进展

文章来源: 上海有机化学研究所 发布时间: 2017-08-15 【字号: 小 中 大】

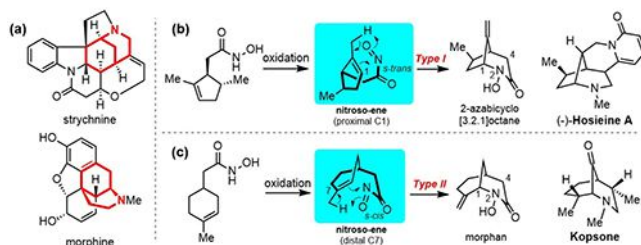
我要分享

吗啡烷 (morphin, 或称 2-azabicyclo[3.3.1]nonane) 结构一直以来是合成化学的研究热点。在著名的生物碱 morphine 和 strychnine 以及近年来 akuammiline 家族系列生物碱的全合成中, 该核心骨架是新方法和新策略研究的方向标。尽管吗啡烷的合成方法众多, 但如何快速构建天然产物的核心骨架并设置易于后续转化的官能团, 依然是当前合成研究的重点。

中国科学院上海有机化学研究所天然产物有机合成化学重点实验室的洪然课题组从设计新颖的反应类型入手, 巧妙地将亚硝基-烯反应 (nitroso-ene) 应用于 2-azabicyclo[3.2.1]octane 环系的构建, 完成了具有显著生理活性的 Hosieine A 的首次不对称合成 (*Angew. Chem., Int. Ed.* 2015, 54, 10940)。这是亚硝基-烯反应首次含氮桥环化合物合成中的应用, 也开辟了合成该类独特骨架的新方法。最近, 他们拓展了亚硝基-烯反应的反应模式, 用于构建吗啡烷 (*Angew. Chem., Int. Ed.* 2017, 56, doi:10.1002/anie.200706018)。该反应条件温和 (0°C 或室温), 收率高, 具有优异的区域选择性, 有很好的官能团容忍度, 且对氮、氧杂环的底物同样适用, 为吗啡烷类活性筛选提供系列药物先导化合物。与理论化学家的合作研究表明该类酰基亚硝基化合物在反应过程中, 不仅可以经历双自由基中间体, 也可能有两性离子中间体参与, 也揭示了后续快速攫氢过程需要满足一定的构象要求。这些计算结果为实验现象提供了有力的理论支持。该方法学也在生物碱 kopsone 的首次合成中得到成功的应用。洪然课题组在合成方法学和全合成相结合的领域所取得的研究成果也获得同行的关注, 受邀发表了研究专题 (*Synlett* 2017, 28, 762) 和专著章节的撰写。目前他们正致力于反应类型的拓展和应对复杂天然产物合成应用中的挑战。

上述研究工作得到国家自然科学基金委、中科院前沿科学重点研究项目、中科院战略性先导科技专项 (B类) 和上海市科委的经费支持。

论文链接: [1](#) [2](#) [3](#)



含吗啡烷结构类型的代表性天然产物和亚硝基-烯反应构建桥环体系

(责任编辑: 叶瑞优)



© 1996 - 2018 中国科学院 版权所有 京ICP备05002857号 京公网安备110402500047号 联系我们  
地址: 北京市三里河路52号 邮编: 100864

### 热点新闻

#### 2018年诺贝尔生理学或医学奖、...

“时代楷模”天眼巨匠南仁东事迹展暨...  
中科院A类先导专项“泛第三极环境变化与...  
中国科大建校60周年纪念大会举行  
中科院召开党建工作推进会  
中科院党组学习贯彻习近平总书记在全国...

### 视频推荐



【新闻联播】“率先行动”  
计划 领跑科技体制改革



【新闻直播间】物种演化新  
发现 软舌螺与腕足动物有  
亲缘关系

### 专题推荐

