



深研院化生院叶涛课题组完成了Kopsane家族多个天然产物的不对称全合成

2020/05/17 信息来源：深圳研究生院
编辑：山石 |

Greshoff课题组在1890年首次报道了kopsine的分离，随后，于上世纪60年代初，kopsane家族的其他成员kopsanone、10,22-dioxokopsane、kopsanol、epi-kopsanol和N-methyl-10,22-dioxokopsane等相继被分离报道。由于kopsane家族生物碱都具有三个季碳手性中心以及高度修饰的七环笼状骨架结构，它们吸引了众多有机化学家的关注。

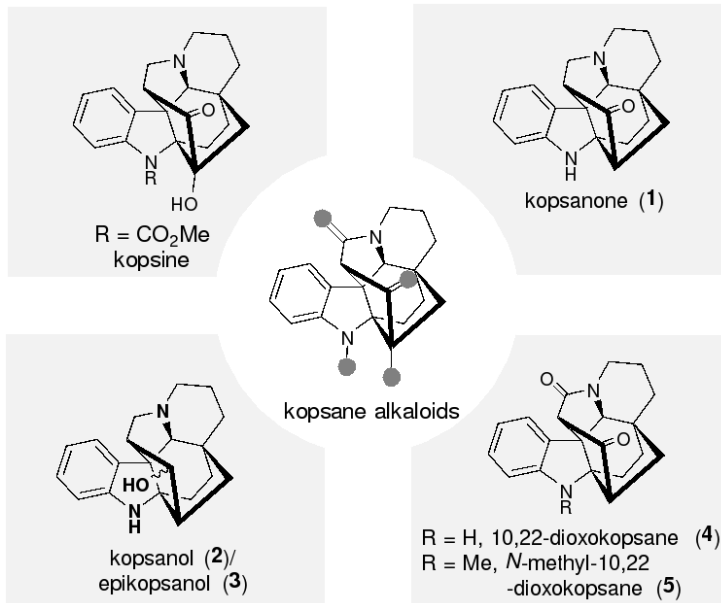


图1.生物碱kopsane家族分子结构

北京大学深圳研究生院叶涛课题组长期致力于具有显著结构特征和优良生物活性天然产物及其类似物的全合成研究。近期，该课题组开发了一类PtCl₂催化的分子内[3+2]环加成反应，并将该[3+2]环加成反应应用到生物碱kopsane家族分子的不对称全合成中，完成了kopsanone、kopsanol、epi-kopsanol、10,22-dioxokopsane和N-methyl-10,22-dioxokopsane以及衍生物N-methyl-kopsanone的全合成。

最新

- 19
2021.01 北京大学学位评
- 18
2021.01 北京大学共青团系
- 18
2021.01 鲁安怀教授就任
- 18
2021.01 民进北京大学委员
设先进集体
- 18
2021.01 第六届“推动行业
人民医院多位专家

专题



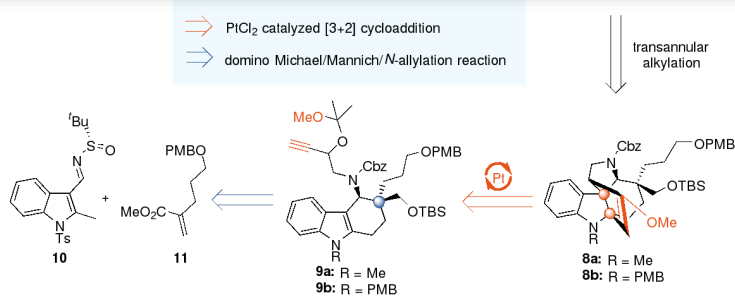


图2.生物碱kopsane家族分子的合成思路

具体的合成思路如图2中所示，其合成亮点如下：1) 通过同一中间体完成多个天然产物的合成；2) 在合成后期通过还原氨化反应来构建kopsane家族分子中的D环；3) 笼状环系中的G环采用跨环的S_N2-type环化反应组装；4) 利用开发的一类PtCl₂催化的分子内[3+2]环加成反应，一步高效构建分子中合成难度较大的2个五元环以及2个季碳手性中心；5) 采用Michael-Mannich-N-烷基化串联反应构建C环和2个手性中心。同时该课题组还与韩国梨花女子大学的Sun Choi教授课题组合作，通过计算化学的方法进一步揭示了PtCl₂催化的分子内[3+2]环加成反应的历程。

以上工作依托于省部共建肿瘤化学基因组学国家重点实验室展开，由化学生物学与生物技术学院叶涛教授和郭益安博士共同指导，由贾雪雷博士和雷鸿辉博士（共同一作）完成，该研究论文以“[Asymmetric Total Syntheses of Kopsane Alkaloids via a PtCl₂-Catalyzed Intramolecular \[3+2\] Cycloaddition](#)”为题发表在国际顶级化学期刊《德国应用化学》（*Angewandte Chemie International Edition*）上（IF=12.257）。该研究工作得到了深圳市孔雀团队计划（Shenzhen Peacock Plan）的支持。

转载本网文章请注明出处