

[首页](#) > [科研进展](#)

科研进展

Chemical Science | 可见光催化不对称Minisci反应最新进展

时间: 2023-02-15 来源: 医药所

文本大小: [【大】](#) | [【中】](#) | [【小】](#) [【打印】](#)

近日,中国科学院深圳先进技术研究院王守国团队通过巧妙的反应设计,从易得的 β -咔啉出发,应用手性Brønsted酸与可见光协同催化体系,实现了 β -咔啉C1位的不对称Minisci反应,直接高对映选择性地构建了一系列C1位氨基烷基取代 β -咔啉骨架化合物。并且,通过后续简单的转化,实现了一系列具有重要生物活性的 β -咔啉类海洋生物碱的高效全合成。该项工作以“Photocatalytic Enantioselective Minisci Reaction of β -Carbolines and the Application to Natural Product Synthesis”为题发表在英国皇家化学会期刊 *Chemical Science* 上。

Chemical Science

ROYAL SOCIETY OF CHEMISTRY

EDGE ARTICLE

View Article Online
View Journal | View Issue

Check for updates

Cite this: *Chem. Sci.*, 2023, 14, 251

All publication charges for this article have been paid for by the Royal Society of Chemistry

Received 23rd September 2022
Accepted 23rd November 2022
DOI: 10.1039/d2sc05313f
rsc.li/chemical-science

Photocatalytic enantioselective Minisci reaction of β -carbolines and application to natural product synthesis†

Mu-Peng Luo,^a Yi-Jie Gu^a and Shou-Guo Wang^{a,b}

A highly efficient enantioselective direct C–H functionalization of β -carbolines via a Minisci-type radical process under a photo-redox and chiral phosphoric acid cooperative catalytic system has been disclosed. Through this protocol, a wide range of C1 aminoalkylated β -carbolines were constructed directly with high levels of enantioselectivities from readily available β -carbolines and alanine-derived redox-active esters. This transformation allows straightforward access to highly valuable enantioenriched β -carbolines, which are an intriguing structural motif in valuable natural products and synthetic bio-active compounds. This protocol has been utilized as a highly efficient synthetic strategy for the concise asymmetric total synthesis of marine alkaloids eudistomin X, (+)-eudistomin B and (+)-eudistomin I.

[文章上线截图](#)[原文链接](#)

自由基反应具有独特的反应性、广泛的底物适用范围以及温和的反应条件等优势,被广泛应用于精细化工、药物研发等领域,尤其是可见光催化领域的快速发展,进一步拓宽了自由基化学的研究空间。可见光催化与自由基化学的有效结合,为具有重要应用价值复杂化合物的合成提供了新的手段。

其中,可见光/手性磷酸协同催化的不对称 Minisci 反应在手性缺电子氮杂芳烃骨架化合物的构建中发挥了重要作用。国内外学者在该领域做出了杰出的工作,但现有的底物主要局限于吡啶、喹啉、喹啉和异喹啉等缺电子氮杂芳烃,对于相对较富电子的底物,如 β -咔啉却鲜有报道。

β -咔啉以及四氢 β -咔啉骨架结构广泛存在于活性天然产物和药物活性分子中,展现出了良好的新药开发潜能。从1841年分离出第一个 β -咔啉生物碱以来,各种结构以及生物活性多样的 β -咔啉生物碱被陆续分离,关于该类骨架化合物的合成及其成药性研究也是当下研究热点。特别是近年来研究发现,许多 β -咔啉类生物碱具有显著的抗肿瘤、抗阿尔茨海默、抗感染以及抗疟原虫等活性。例如,C1位连有手性氨基烷基的 β -咔啉、四氢 β -咔啉骨架海洋生物碱 eudistomin 家族展现出了良好的抗病毒和抗肿瘤活性。

因此,发展更加简便、高效的合成方法来构建该类骨架化合物及其衍生物,对该类化合物的进一步研究具有重要意义。

在该项工作中,活性羧酸酯自由基前体在光氧化还原催化剂作用下,产生 α -氨基烷基自由基中间体,并在手性磷酸的精准调控下,有序地与 β -咔啉C1位反应,从而实现该自由基反应的优良化学、区域、立体选择性控制。该反应具有反应条件温和、收率高、立体选择性好以及底物适用范围广等优点。并且,在此基础上,通过后续官能团转化,实现了一系列具有重要生物活性的 β -咔啉类海洋生物碱的高效全合成。

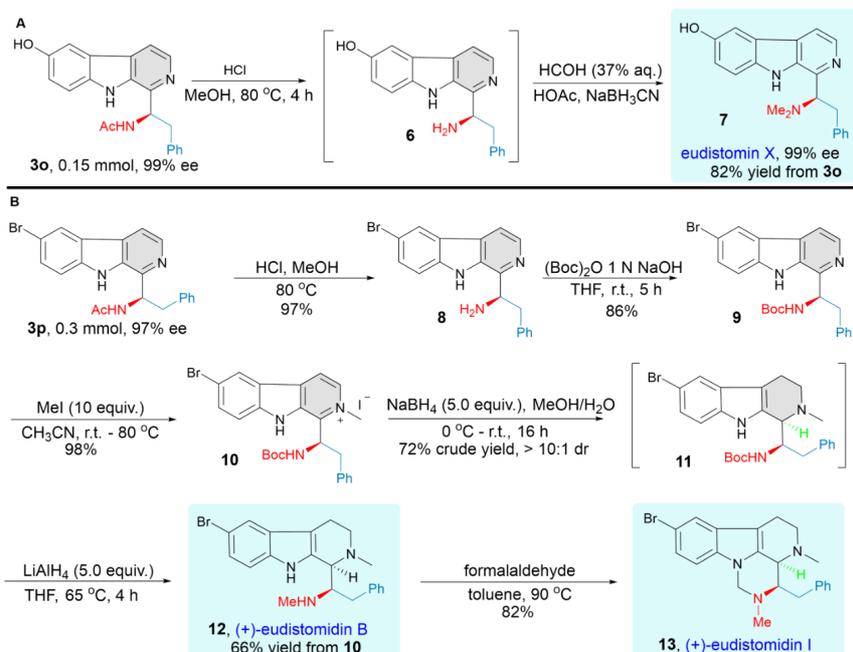
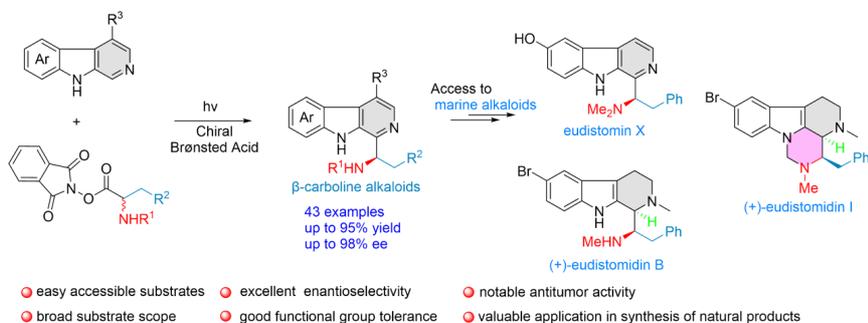


Fig 1. Total synthesis of β -carboline marine alkaloids. (A) Total synthesis of eudistomin X. (B) Total synthesis of (+)-eudistomin B and (+)-eudistomin I.

机构设置	研究队伍	学院	科学研究	合作交流	研究生/博士后	科研支撑	产业化	科学传播
机构简介	人才概况	计算机科学与控制工程学院	IBT介绍	国际合作	教育概况	实验动物管理	运行结构	工作动态
院长致辞	人才招聘	生物医学工程学院	论文	院地合作	招生信息	分析测试中心	转移转化	科普园地
理事会	人才动态	生命健康学院	专利		教学培养	实验室建设...	投资基金	科学教育
现任领导		药学院	项目		联合培养	日常环保工作	案例分享	
历任领导		合成生物学院	科研道德与伦理		学生活动		专利运营	
机构导航		材料科学与能源工程学院	集成技术期刊		博士后			



中国科学院
CHINESE ACADEMY OF SCIENCES

版权所有 中国科学院深圳先进技术研究院 粤ICP备09184136号-3

地址: 深圳市南山区西丽深圳大学城学苑大道1068号 邮编: 518055 电子邮箱: info@siat.ac.cn

