

贵州天名精化学成分及抗菌活性研究

陈洁¹, 王丹¹, 张雄¹, 彭明友¹, 徐冉^{1,2}, 晏英^{1,2}, 王颖^{1,2*}¹ 贵州医科大学药学院, 贵阳 550025; ² 贵州医科大学 贵州省化学合成药物研发利用工程技术研究中心, 贵阳 550004

摘要: 为研究贵州天名精 (*Carpesium faberi*) 的化学成分和抗菌活性研究, 应用多种色谱方法从天名精全草的乙醇提取物中分离得到 14 个单体化合物, 并运用现代波谱技术其鉴定结构, 分别为大叶土木香内酯 (**1**)、4 α , 10 α -二羟基-1 β H, 5 β H-11(13)-烯-12, 8 α -愈创木酚 (**2**)、4 β , 10 β -二羟基-5 α (H)-1, 11(13)-二烯-8 α , 12-愈创木酚 (**3**)、4-表异粘性旋覆花内酯 (**4**)、11(13)-去氢腋生依瓦菊素 (**5**)、天名精内酯酮 (**6**)、吐叶醇 (**7**)、cassipourol (**8**)、4', 5'-dehydrodiodictyonema A (**9**)、(3R)-8-羟基香叶醇 (**10**)、胆甾-7-烯-3 β -醇 (**11**)、甾甾醇 (**12**)、5, 8-表双氧麦角甾-6, 22-二烯-3 β -醇 (**13**)、甾甾-5, 22-二烯-3 β , 7 α -二醇 (**14**)。其中化合物 **2** 和 **7**~**14** 为首次从该植物中得到。初步评估了化合物 **1**~**14** 的抗菌活性, 化合物 **1** 对枯草芽孢杆菌表现出弱活性; 化合物 **6** 和 **10** 对白色念珠菌显示出弱活性。

关键词: 贵州天名精; 化学成分; 分离鉴定; 抗菌活性

中图分类号: R284.1; R932

文献标识码: A

文章编号: 1001-6880(2022)4-0598-08

DOI: 10.16333/j.1001-6880.2022.4.007

Study on chemical constituents and antibacterial activity of *Carpesium faberi*CHEN Jie¹, WANG Dan¹, ZHANG Xiong¹, PENG Ming-you¹, XU Ran^{1,2}, YAN Ying^{1,2}, WANG Ying^{1,2*}¹ College of Pharmacy, Guizhou Medical University, Guiyang 550025, China;² Engineering Technology Research Center for Chemical Drug R&D, Guizhou Medical University, Guiyang 550004, China

Abstract: In order to study the chemical composition and antibacterial activity of *Carpesium faberi*, 14 compounds were obtained from the ethanol extract of *C. faberi* by applying various chromatographic techniques. Their structures were elucidated and identified as granilin (**1**), 4 α , 10 α -dihydroxy-1 β H, 5 β H-guai-11(13)-en-12, 8 α -olide (**2**), 4 β , 10 β -dihydroxy-5 α (H)-1, 11(13)-guaidien-8 α , 12-olide (**3**), 4-epi-isoinviscolide (**4**), 11(13)-dehydroivaxillin (**5**), carabrone (**6**), vomifoliol (**7**), cassipourol (**8**), 4', 5'-dehydrodiodictyonema A (**9**), (3R)-8-Hydroxylinalool (**10**), cholest-7-en-3 β -ol (**11**), stigmasterol (**12**), 5, 8-epidioxy-5 α , 8 α -ergosta-6, 22E-dien-3 β -ol (**13**), stigmasta-5, 22-diene-3 β , 7 α -diol (**14**). Among them, compounds **2** and **7**~**14** were obtained from this plant for the first time. The antibacterial activity of compounds **1**~**14** was preliminarily evaluated, and compound **1** showed weak activity against *Bacillus subtilis*; compounds **6** and **10** showed weak activity against *Candida albicans*.

Key words: *Carpesium faberi*; chemical constituents; isolation and identification; antibacterial activity

菊科天名精属 (*Carpesium*) 植物为多年生草本, 全世界约有 21 种, 其中少数种分布于欧亚大陆, 大部分分布于亚洲中部, 尤其是在我国的西南片区有丰富的植物资源, 其中的天名精、烟管头草和金挖耳已被列入中国法定药用植物, 贵州天名精 (*Carpesium faberi*) 因其止血、抗寄生虫、抗炎和解毒特性,

长期以来被用作民间药物^[1,2]。文献报道已从天名精属植物中至少分离得到 277 个化合物, 结构类型包括萜类, 黄酮, 酚类, 甾体等, 其中从贵州天名精中分离得到 37 个化合物, 其中倍半萜是其主要活性成分^[2]。药理研究显示倍半萜类化合物具有抗肿瘤、抗疟原虫、抗炎、抗菌等多种生物活性^[3]。近年来对于贵州天名精的活性报道主要是抗肿瘤活性^[4,6]以及抗炎活性^[7,8], 尚未对其抗菌活性进行报道。为促进天名精植物资源的综合开发与利用, 本研究对采自贵州凯里的天名精全草开展化学成分研究, 并对所得化合物进行抗菌活性测试。

收稿日期: 2021-07-16 接受日期: 2022-03-01

基金项目: 国家自然科学基金(31760089); 贵州省自然科学基金项目资助项目(黔科合基础[2017]1141); 贵阳市科技局计划项目(筑科合同[2017]30-28)

* 通信作者 Tel: 86-013511936608; E-mail: WY_70@163.com

1 材料与amp;方法

1.1 仪器与试剂

旋转蒸发仪(东京理化, N-1300D-WD); Bruker AV-600 MHz 核磁共振仪(德国布鲁克公司); 四甲基硅烷(TMS)为内标; Bruker HTC / Esquire 质谱仪(德国布鲁克公司); 高效液相色谱仪为 Agilent 1200 型(美国安捷伦科技司); 色谱柱 Waters sunfire C₁₈ (10 mm × 150 mm, 4.6 mm × 250 mm)(沃特世公司); BP211D 电子天平(Sartorius 公司); UV-2700 型紫外可见分光光度计(岛津仪器有限公司); FT-IR-650 傅里叶变换红外光谱仪(天津港东科技发展股份有限公司); 超低温保存箱(海尔医疗公司); 高压灭菌锅(上海博讯实业有限公司); 电热恒温培养箱(上海一恒科学仪器有限公司); 恒温振荡培养箱(上海跃进医疗器械有限公司); 96 孔一次性细胞培养板(耐思生命科技有限公司); 移液枪(Eppendorf 公司)。二甲基亚砜(索莱宝科技有限公司); MHB 培养基(北京奥博星生物技术公司); Sephadex LH-20(三菱公司); C₁₈ 反相硅胶(日本 YMC 公司); 正相硅胶和薄层色谱板(青岛海洋化工厂); 核磁用氘代试剂(美国 CIL 氘代试剂); 液相用水(娃哈哈纯净水 20181109); 色谱级甲醇、乙腈(科密欧试剂公司); 化学实验用溶剂为工业重蒸溶剂, 显色剂为 8% 的硫酸乙醇溶液。

1.2 实验材料

菌株: 大肠杆菌(*Escherichia coli*)、白色念珠菌(*Candida albicans*)、金黄色葡萄球菌(*Staphylococcus aureus*)、铜绿假单胞杆菌(*Pseudomonas aeruginosa*)、枯草芽孢杆菌(*Bacillus subtilis*), 均购于上海中科康泰生物有限公司, 保存于 -80 ℃。

样品采自贵州省凯里市, 经过贵阳中医学院孙庆文老师鉴定为贵州天名精(*Carpesium faberi*), 凭证标本(TMJ201909)保存于贵州医科大学药学实验室。

1.3 实验方法

1.3.1 化合物的提取与分离

将贵州天名精全草 30 kg 切碎后, 以乙醇在室温条件下浸泡 48 h 后提取, 每次提取时间为 3 h, 所得提取液在 55 ℃ 条件下用旋转蒸发仪浓缩, 将所得浸膏放置于通风橱中, 挥干至无醇味, 所得浸膏大约 12 kg。将上述所得浸膏加水充分混悬后用乙酸乙酯萃取 3 次。萃取液在旋转蒸发仪(温度: 55 ℃)上浓缩。所得萃取物放置于通风橱中, 待溶剂挥干, 最

后称取浸膏的重量为: 乙酸乙酯部分重 1.5 kg。取乙酸乙酯部位浸膏, 用乙酸乙酯充分溶解后, 加入适量正相硅胶(40 ~ 80 目)拌样。正相硅胶(100 ~ 200 目)用石油醚湿法装柱, 边加边敲打柱体, 以确保装柱结实无气泡, 反复利用石油醚冲洗, 待液面降至与硅胶面基本相平, 采用干法上样, 以石油醚-乙酸乙酯(50: 1 → 0: 1)梯度洗脱样品, 经 TLC 检测, 合并相似流分, 共得 10 个组分, 记为 Fr1 ~ Fr10。

其中 Fr5 (67.5 g) 经过 MCI(甲醇-水 50% → 100%) 得到 8 个亚馏分, 记为 Fr5-1 ~ Fr5-8, 其中 Fr5-3 (1 g) 经过反相(甲醇-水 40% → 100%), 得到 6 个亚馏分, 记为 Fr5-3a ~ Fr5-3f, 其中 Fr5-3e 再经过制备型 HPLC(流动相为 98% 甲醇-水, 流速 3 mL/min, 保留时间 23 min) 得到化合物 **11** (4 mg); Fr5-5 (10 g) 经过反相柱(甲醇-水 40% → 100%) 得到 8 个亚馏分, 记为 Fr55-1 ~ Fr55-8, 其中 Fr55-5 经过凝胶柱层析(甲醇)再经过硅胶柱层析(二氯甲烷: 甲醇 1: 0 → 100: 1), 得到化合物 **13** (4.6 mg); Fr55-6 经过凝胶柱层析(甲醇), 再经过硅胶柱层析(石油醚: 乙酸乙酯 35: 1 → 0: 1) 得到 6 个亚馏分, 记为 Fr55-6a ~ Fr55-6f, 其中 Fr55-6d 经过制备型 HPLC(流动相为 70% 甲醇-水, 流速 3 mL/min, 保留时间 25.6 min) 得到化合物 **10** (3 mg); Fr55-6b 经过制备型 HPLC(流动相为 100% 甲醇, 流速 3 mL/min, 保留时间 27.2 min) 得到化合物 **9** (5.5 mg); Fr55-7 经过凝胶柱层析(甲醇), 再经过硅胶柱层析(石油醚: 丙酮 20: 1 → 0: 1), 得到 3 个亚馏分 Fr55-7a ~ Fr55-7c, 其中 Fr55-7b 经过制备型 HPLC(流动相为 98% 甲醇-水, 流速 3 mL/min, 保留时间 21 min) 得到化合物 **14** (3 mg); Fr55-7a 经过制备型 HPLC(流动相为 100% 甲醇-水, 流速 3 mL/min, 保留时间 22 min) 得到化合物 **8** (4.9 mg); Fr55-8 经过 2 次硅胶柱(石油醚: 乙酸乙酯 40: 1 → 0: 1), 得到化合物 **12** (4.8 mg)。

Fr7 (78 g) 经过 MCI(甲醇-水 20% → 100%) 得到 9 个亚馏分, 记为 Fr7-1 ~ Fr7-9, 其中 Fr7-2 经过反相柱层析(甲醇-水 10% → 50%) 得到 5 个亚馏分, 记为 Fr7-2-1 ~ Fr7-2-5, 其中 Fr7-2-3 经硅胶柱层析(5: 1 → 0: 1) 得到 5 个亚馏分记为 Fr7-2-3a ~ Fr7-2-3e, 其中 Fr7-2-3b 经过制备型 HPLC(流动相为 30% 甲醇-水, 流速 3 mL/min, 保留时间 15 min) 得到化合物 **7** (10.9 mg); Fr7-2-3c 经过制备型 HPLC(流动相为 30% 甲醇-水, 流速 2.5 mL/min, 保留时间 18.2 min, 24 min), 得到化合物 **2** (6.8 mg)、化合

物 **3** (4.4 mg); Fr7-4 经过反相柱层析(甲醇-水 10% → 60%) 得到 10 个亚馏分, 记为 Fr7-4-1 ~ Fr7-4-10, 其中 Fr7-4-3、Fr7-4-6 用甲醇重结晶得到化合物 **5** (10 mg)、化合物 **1** (20 mg); Fr7-4-8 经过硅胶柱层析(二氯甲烷: 甲醇 200: 1 → 0: 1) 再经过制备型 HPLC(流动相为 40% 甲醇-水, 流速 2.5 mL/min, 保留时间 26 min), 得到化合物 **4** (5.1 mg); Fr7-7 用甲醇重结晶得到化合物 **6** (24 mg)。

1.3.2 化合物 **1** 单晶结构的测定

将化合物 **1** 在 1 mL 液相瓶中用甲醇溶解, 瓶口用塑料膜覆盖, 并在膜上扎 2 个小孔, 室温挥发, 得到若干晶体。对于单晶分析, 选择尺寸为 0.40 mm × 0.07 mm × 0.04 mm 的晶体。所有衍射数据均在装备铜靶的 Bruker Smart Apex CCD diffractometer 衍射仪上获得。

1.3.3 化合物活性筛选

1.3.3.1 样品供试液制备

精确称取一定量的化合物溶于二甲基亚砜中, 配制成浓度为 15.36 mg/mL 的溶液, 低温避光保存备用。

1.3.3.2 菌株活化

MHB 液体培养基: 称取 12 g 固体培养基, 加蒸馏水 1 000 mL, 加热使培养基完全溶解, 于高压灭菌锅中, 121 °C 灭菌 30 min。

将细菌接种在 MHB 液体培养基中, 于 37 °C、130 r/min 条件下活化培养 24 h; 利用平板划线法蘸取活化菌液于固体培养基, 37 °C 静置培养 12 ~ 24 h, 获得单个菌落。用接种环挑取单菌落于 MHB 液体培养基中, 37 °C、130 r/min 条件下培养 24 h, 制得菌悬液, 用 MHB 培养液将菌悬液浓度稀释至 $1 \times 10^6 \sim 1 \times 10^7$ CFU/mL 备用。

1.3.3.3 最小抑菌浓度(MIC)的测定

使用无菌 96 孔一次性细胞培养板, 做好标记后, 在 1 号孔中加入 300 μL 培养基溶液为空白对照, 在 2 号孔中加入 10 μL DMSO, 140 μL 培养基溶液, 在 3 号孔中加入 10 μL 硫酸庆大霉素, 140 μL 培养基溶液, 5 ~ 12 号孔预先加入 150 μL 培养基溶液, 4 号孔加入 290 μL 培养基溶液, 再加入 10 μL 样品溶液混匀后吸取 150 μL 至 5 号孔, 采用二倍稀释法依次进行稀释至 12 号孔, 每个梯度重复 3 次; 2 ~ 12 孔均加入 $100 \mu\text{L}$, $1 \times 10^6 \sim 10^7$ CFU/mL 菌悬液, 接种后, 置于 37 °C 摇床培养 24 h 后取出观察。如小孔内澄清即视为细菌生长受到了抑制, 澄清小

孔中所对应的最低药物浓度为对该菌的最低抑菌浓度。实验方法参考 Wang 等^[9]的研究。

2 实验结果

2.1 结构鉴定

化合物 1 白色晶体; mp. 199 ~ 202 °C; $[\alpha]_{\text{D}}^{26} + 93.3^\circ$ (c 0.21, CH₃OH); ESI-MS: m/z 287 $[M + Na]^+$, 确定分子质量 264, 分子式 C₁₅H₂₀O₄; ¹H NMR (600 MHz, CD₃OD) δ : 6.08 (1H, br s, H-13 α), 5.72 (1H, br s, H-13 β), 5.03 (1H, br s, H-15 α), 4.68 (1H, br s, H-15 β), 4.67 (1H, m, H-8), 4.31 (1H, br s, $J = 2.8$ Hz, H-3), 3.40 (1H, br s, $J = 3.4$ Hz, H-1), 3.15 (1H, m, H-7), 2.79 (1H, d, $J = 11.2$ Hz, H-5), 2.52 (1H, dd, $J = 16.2, 1.8$ Hz, H-9 α), 2.02 (1H, br d, $J = 14.3$ Hz, H-2 α), 1.97 (1H, br d, $J = 14.3$ Hz, H-2 β), 1.84 (1H, m, H-9 β), 1.82 (1H, m, H-6 α), 1.41 (1H, br dd, $J = 11.2, 15.6$ Hz, H-6 β), 0.79 (3H, s, H-14); ¹³C NMR (150 MHz, CD₃OD) δ : 172.4 (C-12), 151.3 (C-4), 143.8 (C-11), 120.9 (C-13), 110.1 (C-15), 79.3 (C-8), 76.2 (C-1), 75.2 (C-3), 41.2 (C-7), 40.1 (C-10), 35.1 (C-5), 34.5 (C-9), 34.5 (C-2), 27.8 (C-6), 17.8 (C-14)。以上数据与文献^[10]报道基本一致, 故鉴定化合物 **1** 为大叶土木香内酯。并首次报道其单晶结构, 晶体数据: 可在剑桥晶体中心免费下载(网址: <http://www.ccdc.cam.ac.uk/>), 晶体号: CCDC-2122868。

化合物 1 的晶体数据: C₁₅H₂₀O₄, $M = 264.31$, 晶胞参数: $a = 6.4621(2)$ nm, $b = 6.4621(2)$ nm, $c = 62.496(2)$ nm, $\alpha = 90^\circ$, $\beta = 90^\circ$, $\gamma = 90^\circ$; 晶胞体积: $V = 2609.75(18)$ nm³; 晶胞内分子数: $Z = 8$; $T = 100(2)$ K, 空间群 P41 212, μ (Cu K α) = 0.790 mm⁻¹, 共收集 24 445 个衍射点, 对其中 2 548 个独立点 ($R_{\text{int}} = 0.0279$) 进行分析。 $R_1 = 0.0335$, $wR_2 = 0.0898$, Flack 参数为 0.02(2), 如图 2 所示。

化合物 2 无色油状; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} - 6.38^\circ$ (c 0.5, CHCl₃:CH₃OH 1:1); ESI-MS: m/z 289 $[M + Na]^+$, 确定分子质量 266, 分子式 C₁₅H₂₂O₄; ¹H NMR (600 MHz, CDCl₃) δ : 6.15 (1H, d, $J = 3.4$ Hz, H-13 α), 5.47 (1H, d, $J = 3.1$ Hz, H-13 β), 4.32 (1H, ddd, $J = 11.6, 9.9, 1.8$ Hz, H-8), 2.50 (1H, m, H-7), 2.30 (1H, ddd, $J = 12.8, 4.1, 2.3$ Hz, H-9 α), 1.99 (1H, dd, $J = 14.7, 11.6$ Hz, H-6 α), 1.94 (1H, m, H-9 β),

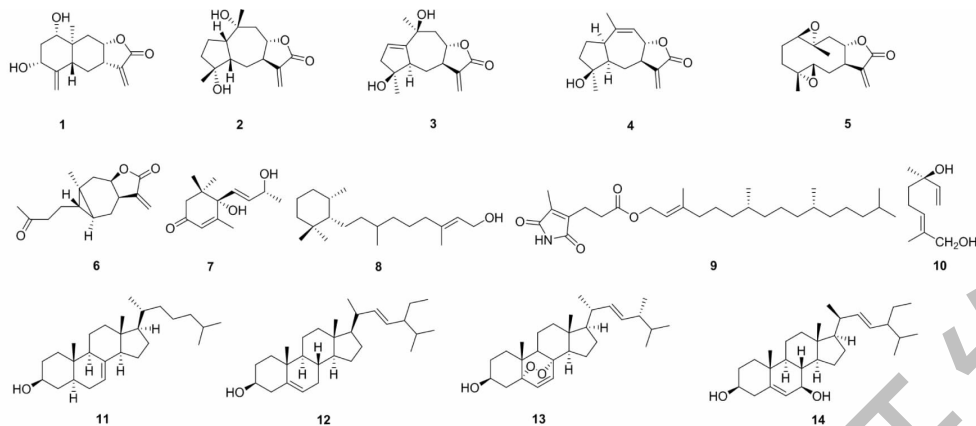


图1 化合物1~14化学结构

Fig. 1 Chemical structures of compounds 1-14

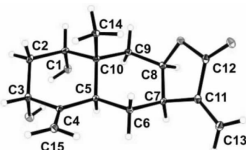


图2 化合物1的单晶X射线衍射结构

Fig. 2 Single crystal X-ray diffraction structure of compound 1

1.80 (1H, m, H-1), 1.70 (1H, d, $J = 8.7$ Hz, H-2 α), 1.68 (1H, d, $J = 4.8$ Hz, H-2 β), 1.67 (1H, s, H-3 α), 1.65 (1H, d, $J = 3.9$ Hz, H-3 β), 1.57 (1H, ddd, $J = 11.8, 9.5, 2.2$ Hz, H-5), 1.33 (3H, s, H-14), 1.22 (3H, d, $J = 5.6$ Hz, H-15), 1.18 (1H, m, H-6 β); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 52.1 (C-1), 23.6 (C-2), 41.2 (C-3), 80.5 (C-4), 50.1 (C-5), 29.2 (C-6), 50.8 (C-7), 79.2 (C-8), 48.7 (C-9), 73.4 (C-10), 140.1 (C-11), 170.3 (C-12), 119.0 (C-13), 25.6 (C-14), 23.1 (C-15)。以上数据与文献^[11]报道一致,故鉴定化合物2为4 α ,10 α -二羟基-1 β H,5 β H-11(13)-烯-12,8 α -愈创木酚。

化合物3 白色晶体; mp. 197-198 $^{\circ}\text{C}$; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} -8.73^{\circ}$ (c 0.6, CH_3OH); ESI-MS: m/z 287 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量264, 分子式 $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{O}_4$; ^1H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ : 6.07 (1H, d, $J = 3.4$ Hz, H-13 α), 5.79 (1H, d, $J = 1.5$ Hz, H-2), 5.57 (1H, d, $J = 3.1$ Hz, H-13 β), 4.01 (1H, t, $J = 10.5$ Hz, H-8), 2.74 (1H, m, H-7), 2.45 (1H, d, $J = 16.9$ Hz, H-3 α), 2.38 (1H, d, $J = 14.1$ Hz, H-9 α), 2.32 (1H, dd, $J = 12.4, 2.9$ Hz, H-5), 2.27 (1H, dt, $J = 12.5, 3.3$ Hz, H-3 β), 2.22 (1H, dd, $J = 16.9, 3.2$ Hz, H-6 α), 2.12 (1H, dd, $J = 14.0, 11.4$ Hz, H-

9 β), 1.39 (3H, s, H-14), 1.37 (3H, s, H-15), 1.04 (1H, q, $J = 12.3$ Hz, H-6 β); ^{13}C NMR (150 MHz, CD_3OD) δ : 172.6 (C-12), 155.3 (C-1), 142.5 (C-11), 125.6 (C-2), 119.7 (C-13), 83.2 (C-8), 82.4 (C-4), 72.9 (C-10), 57.1 (C-5), 51.6 (C-7), 48.5 (C-9), 45.8 (C-3), 32.7 (C-6), 32.2 (C-14), 24.6 (C-15)。以上数据与文献^[12]报道一致,故鉴定化合物3为4 β ,10 β -二羟基-5 α (H)-1,11(13)-二烯-8 α ,12-愈创木酚。

化合物4 无色晶体; mp. 140 $^{\circ}\text{C}$; $[\alpha]_{\text{D}}^{20} -59.2^{\circ}$ (c 0.5, CHCl_3); ESI-MS: m/z 271 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量248, 分子式 $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{O}_3$; ^1H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ : 6.12 (1H, d, $J = 3.3$ Hz, H-13 α), 5.82 (1H, m, H-13 β), 5.59 (1H, d, $J = 3.1$ Hz, H-9), 4.83 (1H, m, H-8), 2.59 (1H, q, $J = 8.9$ Hz, H-7), 2.54 (1H, m, H-1), 2.51 (1H, m, H-6 α), 1.94 (1H, ddd, $J = 17.1, 12.3, 7.7$ Hz, H-5), 1.83 (3H, d, $J = 0.7$ Hz, H-14), 1.78 (1H, m, H-2 α), 1.72 (1H, m, H-2 β), 1.61 (1H, m, H-3 α), 1.53 (1H, m, H-3 β), 1.47 (1H, dd, $J = 17.8, 6.7$ Hz, H-6 β), 1.20 (3H, s, H-15); ^{13}C NMR (150 MHz, CD_3OD) δ : 172.7 (C-12), 143.4 (C-11), 141.9 (C-10), 127.0 (C-9), 119.9 (C-13), 84.0 (C-4), 80.7 (C-8), 53.8 (C-5), 48.2 (C-7), 47.5 (C-1), 42.3 (C-3), 32.3 (C-6), 26.2 (C-2), 24.1 (C-15), 21.7 (C-14)。以上数据与文献^[13]报道基本一致,故鉴定化合物4为4-表异粘性旋覆花内酯。

化合物5 白色晶体; mp. 166 ~ 167 $^{\circ}\text{C}$; $[\alpha]_{\text{D}}^{18} -57.0^{\circ}$ (c 0.33, CHCl_3); ESI-MS: m/z 287 $[\text{M} +$

$\text{Na}]^+$, 确定分子质量 264, 分子式 $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{O}_4$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 2.82 (1H, m, H-1), 2.28 (1H, ddd, $J = 13.4, 4.4, 2.1$ Hz, H-2 α), 1.50 (1H, m, H-2 β), 1.57 (1H, dd, $J = 13.1, 8.6$ Hz, H-3 α), 1.34 (1H, dd, $J = 13.4, 5.4$ Hz, H-3 β), 2.80 (1H, d, $J = 5.7$ Hz, H-5), 2.15 (1H, dd, $J = 14.4, 5.3$ Hz, H-6 α), 1.69 (1H, s, H-6 β), 2.86 (1H, dd, $J = 7.1, 3.5$ Hz, H-7), 4.18 (1H, dd, $J = 10.0, 7.0$ Hz, H-8), 2.43 (1H, d, $J = 15.0$ Hz, H-9 α), 1.53 (1H, t, $J = 3.7$ Hz, H-9 β), 6.36 (1H, d, $J = 3.3$ Hz, H-13 α), 5.68 (1H, d, $J = 2.9$ Hz, H-13 β), 1.45 (3H, m, H-14), 1.29 (3H, m, H-15); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 64.3 (C-1), 31.8 (C-6), 35.6 (C-3), 63.4 (C-4), 60.9 (C-5), 23.4 (C-2), 46.1 (C-7), 82.1 (C-8), 45.8 (C-9), 57.8 (C-10), 138.5 (C-11), 168.7 (C-12), 122.6 (C-13), 17.9 (C-14), 15.9 (C-15)。以上数据与文献^[14]报道一致, 故鉴定化合物 **5** 为 11(13)-去氢腋生依瓦菊素。

化合物 6 白色晶体; mp. 90 ~ 92 °C; $[\alpha]_{\text{D}}^{24} + 123^\circ$ (c 0.35, CH_3OH); ESI-MS: m/z 271 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 248, 分子式 $\text{C}_{15}\text{H}_{20}\text{O}_3$; ^1H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ : 6.15 (1H, d, $J = 2.9$ Hz, H-13 α), 5.65 (1H, d, $J = 2.5$ Hz, H-13 β), 4.87 (1H, dd, $J = 7.0, 4.4$ Hz, H-8), 3.23 (1H, m, H-7), 2.57 (2H, t, $J = 7.4$ Hz, H-3), 2.37 (1H, dt, $J = 14.0, 6.9$ Hz, H-6 α), 2.28 (1H, dd, $J = 13.6, 6.1$ Hz, H-6 β), 2.15 (3H, s, H-15), 1.60 (1H, dq, $J = 14.3, 7.2$ Hz, H-9 α), 1.53 (1H, dq, $J = 14.9, 7.6$ Hz, H-9 β), 1.11 (3H, s, H-14), 0.98 (1H, dd, $J = 16.8, 5.3$ Hz, H-2 α), 0.92 (1H, m, H-2 β), 0.52 (1H, td, $J = 7.3, 4.2$ Hz, H-1), 0.43 (1H, ddd, $J = 8.7, 7.3, 4.2$ Hz, H-5); ^{13}C NMR (150 MHz, CD_3OD) δ : 212.1 (C-4), 173.0 (C-12), 141.4 (C-11), 123.3 (C-13), 77.9 (C-8), 44.5 (C-3), 39.2 (C-7), 38.4 (C-9), 35.6 (C-1), 32.0 (C-6), 30.3 (C-15), 24.8 (C-2), 24.6 (C-5), 18.7 (C-14), 18.7 (C-10)。以上数据与文献^[15]报道基本一致, 故鉴定化合物 **6** 为天名精内酯酮。

化合物 7 无色结晶; mp. 102 ~ 104 °C; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 105^\circ$ (c 0.25, CH_3OH); ESI-MS: m/z 247 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 224, 分子式 $\text{C}_{13}\text{H}_{20}\text{O}_3$; ^1H NMR (600 MHz, CD_3OD) δ : 5.88 (1H, s, H-4), 5.78 (2H, m, H-7, H-8), 4.33 (1H, m, H-9), 2.49 (1H, d, $J =$

16.9 Hz, H-2 α), 2.17 (1H, d, $J = 16.9$ Hz, H-2 β), 1.92 (3H, t, $J = 2.6$ Hz, H-13), 1.25 (3H, d, $J = 6.5$ Hz, H-10), 1.05 (3H, s, H-11), 1.02 (3H, d, $J = 5.2$ Hz, H-12); ^{13}C NMR (150 MHz, CD_3OD) δ : 201.5 (C-3), 167.8 (C-5), 137.2 (C-7), 130.2 (C-8), 127.4 (C-4), 80.3 (C-6), 68.9 (C-9), 51.0 (C-2), 42.7 (C-1), 24.8 (C-10), 24.1 (C-11), 23.8 (C-12), 19.9 (C-13)。以上数据与文献^[16]报道一致, 故鉴定化合物 **7** 为吐叶醇。

化合物 8 无色黏性液体; $[\alpha]_{\text{D}}^{25} + 123^\circ$ (c 0.35, CH_3OH); ESI-MS: m/z 317 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 294, 分子式 $\text{C}_{20}\text{H}_{38}\text{O}$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.41 (1H, td, $J = 6.9, 1.1$ Hz, H-14), 4.15 (2H, d, $J = 6.3$ Hz, H-15), 1.99 (2H, m, H-12), 1.67 (3H, s, H-20), 0.87 (3H, s, H-16), 0.85 (9H, m, H-17, 18, 19); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 140.3 (C-13), 123.1 (C-14), 59.4 (C-15), 39.9 (C-12), 39.4 (C-2), 37.4 (C-10), 37.4 (C-8), 37.3 (C-4), 36.7 (C-1), 32.8 (C-6), 32.7 (C-9), 28.0 (C-5), 25.1 (C-11), 24.8 (C-3), 24.5 (C-7), 22.7 (C-16), 22.6 (C-17), 19.7 (C-18), 19.7 (C-19), 16.2 (C-20)。以上数据与文献^[17]报道一致, 故鉴定化合物 **8** 为 cassipourol。

化合物 9 无色油状; $[\alpha]_{\text{D}}^{20} - 22.0^\circ$ (c 0.23, CHCl_3); ESI-MS: m/z 484 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 461, 分子式 $\text{C}_{28}\text{H}_{47}\text{NO}_4$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.30 (1H, dd, $J = 7.2, 6.2$ Hz, H-2), 4.59 (2H, d, $J = 7.2$ Hz, H-1), 2.69 (2H, d, $J = 7.2$ Hz, H-3'), 2.63 (2H, d, $J = 6.8$ Hz, H-2'), 2.00 (3H, s, H-7'), 1.98 (2H, d, $J = 6.0$ Hz, H-4), 1.68 (3H, s, H-20), 1.60 (4H, s, H-5, 7, 11), 1.52 (1H, dt, $J = 13.3, 6.6$ Hz, H-15), 1.35 (2H, d, $J = 6.7$ Hz, H-13), 1.30 (2H, m, H-9), 1.27 (2H, d, $J = 3.8$ Hz, H-6), 1.25 (2H, d, $J = 3.6$ Hz, H-8), 1.24 (2H, d, $J = 5.1$ Hz, H-10), 1.12 (2H, dd, $J = 6.3, 2.9$ Hz, H-12), 1.06 (2H, dd, $J = 5.1, 2.7$ Hz, H-14), 0.87 (3H, s, H-16), 0.85 (3H, s, H-17), 0.84 (3H, s, H-18), 0.84 (3H, d, $J = 4.3$ Hz, H-19); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 172.1 (C-1'), 171.3 (C-6'), 171.1 (C-8'), 143.2 (C-3), 139.9 (C-4'), 139.7 (C-5'), 117.6 (C-2), 61.8 (C-1), 39.9 (C-4), 39.4 (C-14), 37.4 (C-8), 37.3 (C-10), 37.2 (C-12), 36.6 (C-6), 32.8 (C-7), 32.7 (C-11), 31.9 (C-2'), 28.0 (C-

15), 25.0 (C-5), 24.8 (C-9), 24.5 (C-13), 22.7 (C-17), 22.6 (C-16), 19.7 (C-19), 19.7 (C-18), 19.3 (C-3'), 16.4 (C-20), 8.71 (C-7')。以上数据与文献^[18]报道一致, 故鉴定化合物 **9** 为 4', 5'-dehydro-diodictyonema A。

化合物 10 无色油状; $[\alpha]_D^{25} -5.70^\circ$ (c 0.05, CHCl_3); ESI-MS: m/z 193 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 170, 分子式 $\text{C}_{10}\text{H}_{18}\text{O}_2$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.91 (1H, dd, $J = 17.3, 10.8$ Hz, H-2), 5.41 (1H, td, $J = 7.2, 1.1$ Hz, H-6), 5.22 (1H, dd, $J = 17.4, 1.0$ Hz, H-1 β), 5.07 (1H, dd, $J = 10.8, 1.0$ Hz, H-1 α), 3.99 (2H, s, H-8), 2.08 (2H, ddd, $J = 19.6, 13.0, 6.6$ Hz, H-5), 1.66 (3H, s, H-9), 1.62 (2H, m, H-4), 1.29 (3H, s, H-10); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 144.8 (C-2), 135.0 (C-7), 125.9 (C-6), 111.9 (C-1), 73.3 (C-3), 68.9 (C-8), 41.7 (C-4), 27.9 (C-10), 22.3 (C-5), 13.6 (C-9)。以上数据与文献^[19]报道一致, 故鉴定化合物 **10** 为 (3*R*)-8-羟基香叶醇。

化合物 11 白色无定形粉末; mp. 123 ~ 123.5 $^\circ\text{C}$; $[\alpha]_D^{24} +9^\circ$ (c 1.6, CHCl_3); ESI-MS: m/z 409 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 386, 分子式 $\text{C}_{27}\text{H}_{46}\text{O}$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.15 (1H, m, $J = 2.6$ Hz, H-7), 3.59 (1H, m, H-3), 0.92 (3H, d, $J = 6.5$ Hz, H-21), 0.87 (3H, d, $J = 2.9$ Hz, H-26), 0.86 (3H, d, $J = 2.9$ Hz, H-27), 0.79 (3H, s, H-19), 0.53 (3H, s, H-18); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 139.6 (C-8), 117.4 (C-7), 71.1 (C-3), 56.1 (C-17), 55.0 (C-14), 49.4 (C-9), 43.4 (C-13), 40.2 (C-5), 39.6 (C-12), 39.5 (C-24), 38.0 (C-4), 37.1 (C-1), 36.2 (C-20), 36.1 (C-22), 34.2 (C-10), 31.5 (C-2), 29.6 (C-6), 28.0 (C-25), 27.9 (C-16), 23.9 (C-23), 23.0 (C-15), 22.8 (C-27), 22.5 (C-26), 21.5 (C-11), 18.8 (C-21), 13.0 (C-19), 11.8 (C-18)。以上数据与文献^[20]报道一致, 故鉴定化合物 **11** 为胆甾-7-烯-3 β -醇。

化合物 12 无色针晶; mp. 175 $^\circ\text{C}$; $[\alpha]_D^{25} -35^\circ$ (c 0.16, CHCl_3); ESI-MS: m/z 435 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 412, 分子式 $\text{C}_{29}\text{H}_{48}\text{O}$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.37 (1H, s, H-6), 5.15 (1H, dd, $J = 15.2, 8.7$ Hz, H-22), 5.02 (1H, dd, $J = 15.2, 8.7$ Hz, H-23), 3.52 (1H, s, H-3); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 140.8 (C-5), 138.3 (C-22), 129.3 (C-23), 121.7

(C-6), 71.8 (C-3), 56.9 (C-17), 55.9 (C-14), 51.2 (C-24), 50.1 (C-9), 42.3 (C-4), 42.2 (C-13), 40.5 (C-20), 39.7 (C-12), 37.2 (C-1), 36.5 (C-10), 31.9 (C-2, 8, 25), 31.7 (C-7), 28.9 (C-16), 25.4 (C-28), 24.4 (C-15), 21.2 (C-21), 21.1 (C-11), 21.2 (C-27), 19.4 (C-19), 19.0 (C-26), 12.2 (C-29), 12.0 (C-18)。以上数据与文献^[21]报道一致, 故鉴定化合物 **12** 为豆甾醇。

化合物 13 无色晶体; mp. 172 ~ 173 $^\circ\text{C}$; $[\alpha]_D^{23} +59^\circ$ (c 0.2, CHCl_3); ESI-MS: m/z 451 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 428, 分子式 $\text{C}_{28}\text{H}_{44}\text{O}_3$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 6.60 (1H, d, $J = 8.5$ Hz, H-7), 6.29 (1H, d, $J = 8.5$ Hz, H-6), 5.24 (1H, dd, $J = 15.3, 7.7$ Hz, H-23), 5.16 (1H, dd, $J = 15.3, 8.5$ Hz, H-22), 4.01 (1H, dt, $J = 11.5, 5.5$ Hz, H-3), 1.09 (3H, s, H-21), 1.00 (3H, dd, $J = 6.6, 2.4$ Hz, H-19), 0.91 (3H, m, H-28), 0.84 (3H, m, H-26), 0.82 (3H, m, H-18), 0.74 (3H, m, H-27); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 135.4 (C-6), 135.1 (C-22), 132.4 (C-23), 130.7 (C-7), 82.7 (C-5), 78.3 (C-8), 66.3 (C-3), 55.8 (C-17), 51.7 (C-14), 51.1 (C-9), 48.2 (C-13), 43.6 (C-24), 42.7 (C-20), 41.2 (C-12), 39.9 (C-4), 37.9 (C-10), 36.1 (C-1), 33.0 (C-25), 32.6 (C-2), 30.6 (C-16), 28.6 (C-15), 25.5 (C-21), 20.9 (C-11), 20.7 (C-27), 19.9 (C-26), 19.6 (C-19), 17.5 (C-28), 13.0 (C-18)。以上数据与文献^[22]报道一致, 故鉴定化合物 **13** 为 5, 8-表双氧麦角甾-6, 22-二烯-3 β -醇。

化合物 14 白色片状结晶; mp. 169 ~ 171 $^\circ\text{C}$; $[\alpha]_D^{23} +42^\circ$ (c 0.2, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OH}$); ESI-MS: m/z 451 $[\text{M} + \text{Na}]^+$, 确定分子质量 428, 分子式 $\text{C}_{29}\text{H}_{48}\text{O}_2$; ^1H NMR (600 MHz, CDCl_3) δ : 5.73 (1H, dd, $J = 4.8, 1.5$ Hz, H-6), 5.16 (1H, dd, $J = 15.2, 8.7$ Hz, H-22), 5.01 (1H, dd, $J = 15.1, 8.8$ Hz, H-23), 3.66 (1H, m, H-7), 3.28 (1H, t, $J = 3.5$ Hz, H-3), 1.02 (3H, d, $J = 6.6$ Hz, H-21), 0.98 (3H, s, H-19), 0.67 (3H, d, $J = 11.5$ Hz, H-18); ^{13}C NMR (150 MHz, CDCl_3) δ : 146.1 (C-5), 138.4 (C-22), 129.2 (C-23), 120.8 (C-6), 73.9 (C-3), 71.4 (C-7), 56.8 (C-17), 55.7 (C-24), 51.2 (C-14), 49.1 (C-9), 42.8 (C-13), 42.3 (C-4), 42.0 (C-20), 40.6 (C-12), 39.0 (C-8), 37.4 (C-10), 37.2 (C-1), 36.7 (C-25), 31.2 (C-2), 31.2 (C-28), 29.0 (C-16), 25.4 (C-15), 24.3 (C-21), 21.2 (C-

27), 21.1 (C-11), 19.0 (C-26), 18.2 (C-19), 12.2 (C-29), 11.7 (C-18)。以上数据与文献^[23]报道一致,故鉴定化合物 **14** 为豆甾-5,22-二烯-3 β ,7 α -二醇。

2.2 最小抑菌浓度 (MIC) 的测定结果

评估了化合物 **1** ~ **14** 对金黄色葡萄球菌、铜绿假单胞菌、大肠杆菌、枯草芽孢菌和白色念珠菌的抑菌活性。结果表明,化合物 **1** 对枯草芽孢杆菌表现出微弱抑菌活性,化合物 **1** 的 MIC 值为 256 $\mu\text{g}/\text{mL}$,化合物 **10** 和化合物 **6** 对白色念珠菌显示出弱活性,化合物 **10** 的 MIC 值为 128 $\mu\text{g}/\text{mL}$,化合物 **6** 的 MIC 值为 128 $\mu\text{g}/\text{mL}$,其余化合物则未显示抗菌活性。

3 结论

利用多种色谱方法,从黔产天名精中分离鉴定得到 14 个化合物,如图 1 所示,包括倍半萜、二萜、甾体类等成分,其中化合物 **2**、**7** ~ **14** 为首次从该植物中得到。针对分离得到的化合物进行抗菌活性筛选。采用二倍稀释法,测定化合物对金黄色葡萄球菌、铜绿假单胞菌、大肠杆菌、枯草芽孢菌和白色念珠菌的抑菌活性,使用处于对数生长期的菌种,所有样品均使用 DMSO 溶解配制成 15.36 mg/mL 的药液。活性测试结果显示,抗菌活性测试表明,化合物 **1** 对枯草芽孢杆菌有微弱抑菌活性,化合物 **1** 的 MIC 值为 256 $\mu\text{g}/\text{mL}$,化合物 **10**、化合物 **6** 对白色念珠菌显示出弱活性,化合物 **10** 的 MIC 值为 128 $\mu\text{g}/\text{mL}$,化合物 **6** 的 MIC 值为 128 $\mu\text{g}/\text{mL}$,其余化合物则未显示出抗菌活性。本研究成果丰富了贵州天名精中的化学成分及生物活性内容,为其进一步的研究开发提供参考资料。

参考文献

- 1 Editorial Committee of Flora of China. Flora of China(中国植物志)[M]. Beijing: Science Press, 1977: 293-313.
- 2 Dong XQ, Zhang ZY. Research progress on chemical constituents and pharmacological effect of *Carpesium* L. plant[J]. Drug Eval Res(药物评价研究), 2020, 43: 949-953.
- 3 Chen DL, Li X, Zhou XJ. Research progress on sesquiterpenes and its pharmacological activities in genus *Carpesium* [J]. China J Chin Mater Med(中国中药杂志), 2020, 45(1): 37-51.
- 4 Xu XK, Ye J, Chen LP, et al. Three new sesquiterpene lactone dimers from *Carpesium faberi* [J]. Phytochem Lett, 2016, 16: 277-282.
- 5 Yang BJ, Zeng ZQ, Li SL, et al. Terpenes from *Carpesium*

- 6 *abrotanoides* L. and their anti-tumor activity [J]. Nat Prod Res Dev(天然产物研究与开发), 2021, 33: 951-955.
- 6 Yang YX, Lei, et al. Carpedilactones A-D, four new isomeric sesquiterpene lactone dimers with potent cytotoxicity from *Carpesium faberi* [J]. Org Lett, 2014, 16: 4216-4219.
- 7 Yang YX, Gao S, Zhang SD, et al. Cytotoxic 2,4-linked sesquiterpene lactone dimers from *Carpesium faberi* exhibiting NF- κ B inhibitory activity [J]. RSC Adv, 2015, 5: 55285-55289.
- 8 Yuan J, Wen X, Ke CQ, et al. Tricarabrols A-C, three anti-inflammatory sesquiterpene lactone trimers featuring a methylene-tethered linkage from *Carpesium faberi* [J]. Org Chem Front, 2020, 7: 1374-1382.
- 9 Wang XH, Guo R, Nie XB, et al. Antibacterial activity of citri sarcodactylis fructus and its antibacterial mechanism against *Staphylococcus aureus* [J]. Chin J Antibiot(中国抗生素杂志), 2021, 46: 437-441.
- 10 Vichnewski W, Shuhama IK, Rasanske RC, et al. Granilin and ivasperin from *Ambrosia polystachya* ¹³C NMR spectra of hydroxylated isoalantones [J]. Phytochemistry, 1976, 15: 1531-1532.
- 11 Liu LL, Wang R, Yang JL, et al. Diversity of sesquiterpenoids from *Carpesium cernuum* [J]. Helv Chim Acta, 2010, 93: 595-601.
- 12 Kim MR, Kim CS, Hwang KH, et al. Isolation and structures of guaianolides from *Carpesium macrocephalum* [J]. J Nat Prod, 2002, 65(4): 583.
- 13 Rustaiyan A, Zare K, Biniyaz T, et al. A seco-guaianolide and other sesquiterpene lactones from *Postia bombycina* [J]. Phytochemistry, 1989, 28: 3127-3129.
- 14 Maruyama M, Karube A, Sato K. Sesquiterpene lactones from *Carpesium abrotanoides* [J]. Phytochemistry, 1983, 22: 2773-2774.
- 15 Kim MR, Lee SK, Kim CS, et al. Phytochemical constituents of *Carpesium macrocephalum* F(R) et S(AV) [J]. Arch Pharm Res, 2004, 27: 1029-1033.
- 16 Wang GK, Zheng J, Yu Y, et al. Chemical constituents of ethyl acetate fraction from *Dioscorea bulbifera* [J]. Chin Pharm J(中国药学杂志), 2018, 53(21): 16-21.
- 17 Chaturvedula VS, Norris A, Miller JS, et al. Cytotoxic diterpenes from *Cassipourea madagascariensis* from the Madagascar rainforest [J]. J Nat Prod, 2006, 69: 287-289.
- 18 Peng Y, Liu DQ, Liang TJ, et al. Bioactive constituents from the green alga *Caulerpa racemosa* [J]. Bioorg Med Chem, 2015, 23(1): 38-45.
- 19 Chen H, Zhou YZ, Qiao L, et al. Androstane and monoterpene glucoside sinapoyl ester from *Cynanchum amplexicaule* Sieb

- et Zucc[J]. Chem Pharm Bull, 2007, 55:1416-1418.
- 20 Li ZQ, Chen G, Wang HF, et al. Separation, identification and activity of chemical constituents from *Asterina pectinifera* [J]. J Shenyang Pharm Univ(沈阳药科大学学报), 2013, 30:677-682.
- 21 Zhang XQ, Qi J, Ye WC, et al. Study on the chemical constituents of *Xanthium stem*[J]. J Chin Pharm Univ(中国药科大学学报), 2004, 35:404-404.
- 22 Jing B, Zhang QS, Peng LY, et al. Constituents from *Thamno-lia vermicularis* [J]. Acta Bot Yunnan(云南植物研究), 2002, 24:525-530.
- 23 Xu Y, Liang JY. Research on the chemical composition of *Zea mays* L. beard [J]. Chin Tradit Herb Drugs(中草药), 2006, 37:831-833.

酶促不对称合成 *N*-取代 1,2-氨基醇的新方法

手性 *N*-取代 1,2-氨基醇是许多天然产物和药物的关键结构单元,也作为手性催化剂、手性配体或手性助剂广泛应用于重要复杂分子的不对称合成。但是,现有的合成方法存在反应条件比较苛刻、区域/立体选择性较差等不足,因此,开发高效、绿色不对称合成手性 *N*-取代 1,2-氨基醇的新方法具有重要的应用价值。

来自中国科学院天津工业生物技术研究所的朱敦明及其团队利用亚胺还原酶和苯甲醛裂解酶建立了基于 C1 化合物(甲醛)的一锅两步酶法不对称合成手性 *N*-取代 1,2-氨基醇的新途径。首先,该团队从大量亚胺还原酶中筛选出 10 个立体选择性互补的亚胺还原酶进行底物特异性的研究,发现部分亚胺还原酶对不同类型的芳香族及脂肪族 α -羟甲基酮和胺类供体具有很高的活性和立体选择性,实现了对映选择性互补的 *N*-取代 1,2-氨基醇的不对称合成;其次,通过对焦磷酸硫酸素依赖型酶的挖掘及筛选,获得一个苯甲醛裂解酶,其可以催化芳香基/烷基醛与甲醛的高效、选择性转化合成 α -羟甲基酮类化合物;在此基础上,构建了“一锅两步”酶催化反应体系,以甲醛、简单醛类化合物和胺类化合物为底物,直接合成了光学纯 *N*-取代 1,2-氨基醇,极大简化了合成路径;最后,利用化学-酶催化相结合的方法,通过羟甲基化、还原胺化以及分子内碳氮耦合反应合成了抗疟疾和细胞毒性四氢喹啉生物碱的重要前体。该工作作为手性 *N*-取代 1,2-氨基醇的合成提供了新的方法。相关研究发表在《Angewandte Chemie International Edition》杂志上。

胡乃华编译自: <https://onlinelibrary.wiley.com/doi/10.1002/anie.202116344>

原文标题: Asymmetric Synthesis of *N*-Substituted 1,2-Amino Alcohols from Simple Aldehydes and Amines by One-Pot Sequential Enzymatic Hydroxymethylation and Asymmetric Reductive Amination