



지스트(광주과학기술원) 보도자료

<http://www.gist.ac.kr>

보도 일시

배포 즉시 보도 부탁드립니다.

보도자료

홍보팀 김효정 팀장

062-715-2061 / 010-3644-0356

담당

홍보팀 이나영 선임행정원

062-715-2062 / 010-2008-2809

자료 문의

화학과 홍석원 교수

062-715-2346 / 010-5096-9220

지스트-칼텍 국제공동연구팀,

에이즈 치료제 합성에 적용 가능한 촉매 개발

- 에이즈 바이러스(HIV) 역전사효소 억제제인 에파비렌즈(Efavirenz) 합성 적용에 기대
- 지스트 홍석원 교수와 칼텍의 브라이언 스톨츠 공동연구팀, 국제공동연구 프로그램의 결실 맺어

□ GIST(지스트, 총장 김기선) 화학과 홍석원 교수와 캘리포니아 공대(Caltech) 브라이언 스톨츠(Brian M. Stoltz) 교수 공동연구팀이 에이즈 바이러스(HIV) 치료제를 비롯한 많은 의약품에서 보이는 트리플루오로메틸기를 함유한 삼차원적 분자구조를 효율적으로 합성할 수 있는 촉매를 개발했다.

○ 이번에 개발된 촉매는 에이즈를 예방하고 치료하는데 사용되는 항레트로바이러스(抗retrovirus: 레트로바이러스에 저항하는 데 효과적인 성질, 또는 그러한 성질을 가지고 있는 물질) 약물인 에파비렌즈(efavirenz: 인체 면역 결핍 바이러스 감염 치료에 사용) 합성에 응용될 수 있다는 점에서 중요한 의의를 갖는다.

* 역전사효소: RNA를 주형으로 해서 DNA를 합성하는데 이것은 일반적으로 유전정보가 전달되는 방향과는 반대방향인 독특한 현상으로, 레트로바이러스가 특이적으로 가지고 있는 효소이다.

□ 개발된 촉매는 니켈 중심금속과 폴리에테르 유닛을 포함하는 다기능 살렌 리간드로 구성되어 있으며, 폴리에테르 유닛과 알칼리 금속의 배위결합으로 인하여 협조 기능형(cooperative) 촉매가 생성된다. 이와 같이 하나의 금속 촉매가 두 반응물 들을 동시에 협조적으로 활성화시켜 뛰어난 촉매 활성(수율 99%)과 입체선택성(97% ee)을 보였다.

- 또한 지스트 화학과 한민수 교수연구팀과의 공동연구를 통해 UV-vis 흡수 분광법 실험을 수행하여 촉매와 칼륨 양이온이 화학양론적으로 1:1 결합을 한다는 것을 나타낸다는 결과(결합 정수 $K_a = 6.6 \times 10^5 \text{ M}^{-1}$)를 통해 의 양이온 결합 능력이 촉매 반응에서 중요한 역할을 한다는 것을 보였다.
- 홍석원 교수와 브라이언 스톨츠(Brian M. Stoltz) 교수는 “이번 연구성과는 생체 효소와 같이 두 반응물을 동시에 인식할 수 있는 촉매를 개발하여 반응물이 의도하는 방향으로만 선택적으로 반응하게 하는 새로운 합성법을 개발했다”는데 가장 큰 연구의 의의가 있으며, “향후 HIV 역전사효소 억제제인 에파비렌즈 관련 유도체 합성에도 적용할 수 있기를 기대한다”라고 말했다.
- 본 연구는 지스트-칼텍 공동연구 과제와 한국연구재단 기초연구사업의 지원을 받아 수행되었으며, 연구의 중요성을 인정받아 화학분야 세계적 학술지인 ‘앙게반테케미’(Angewandte Chemie International Edition)에 11월 12일자로 게재되었다.
- 한편 지스트-Caltech 공동연구 프로젝트는 2012년부터 지스트와 Caltech 교수가 짝을 이뤄 연구그룹을 구성해 혁신적이고 창의적인 공동연구를 수행하는 연구협력 프로그램이다. 지스트 홍석원 교수와 칼텍 브라이언 스톨츠 교수팀은 “혁신적 유기합성을 위한 협조기능형 촉매의 개발”을 공동연구 과제로 수행하여 이번 성과를 발표하였다. <끝>

논문의 주요 내용

1. 논문명, 저자정보

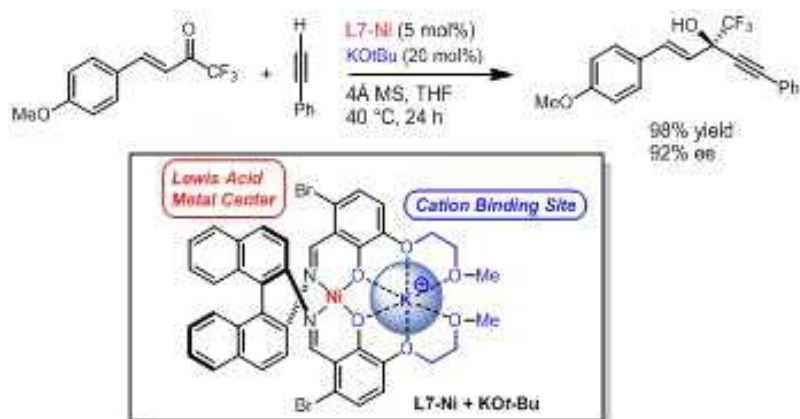
- 저널명 : Angewandte Chemie International Edition(2018 JCR Impact Factor: 12.257)
- 논문명 : Enantioselective Alkynylation of Trifluoromethyl Ketones Catalyzed by Cation-Binding Salen Nickel Complexes.

- 저자 정보 : 박동성(GIST 박사과정, 공동 제1저자), Carina I. Jette(caltech, 공동 제1저자), 김지윤(GIST, 공동 제1저자), 정우옥(GIST), 이용민(GIST), 박종우(플로리다 대학교), 강승윤(GIST), 한민수 교수(GIST), Brian M. Stoltz 교수(caltech, 공동 교신저자), 홍석원 교수(GIST, 교신저자)

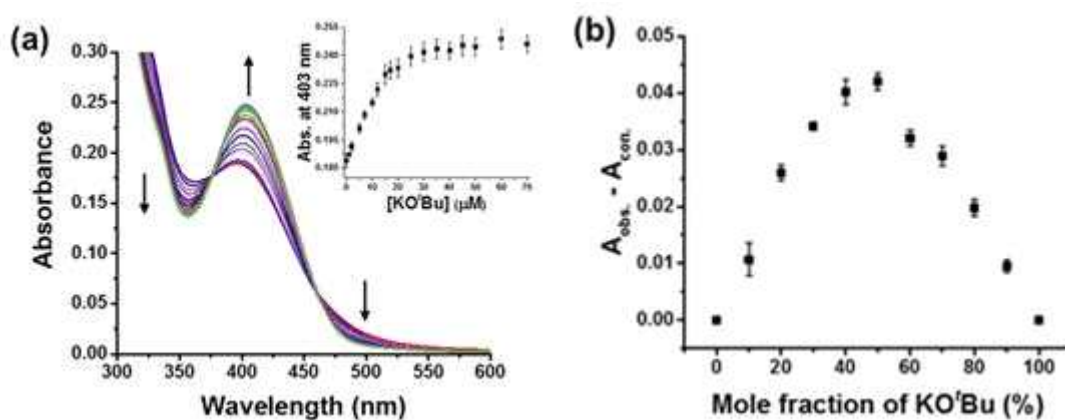
용 어 설 명

- 키랄 화합물: 키랄 화합물의 합성 시 삼차원 구조를 정확히 조절하여 거울상 이성질체 중 하나만을 선택적으로 합성하는 것이 현대 유기 합성분야에서 중요한 이슈로 다루어져 왔다. 얼핏 보기에 큰 차이가 없어 보이는 두 거울상 이성질체가 때로는 매우 다른 생체활성을 보이기도 하기 때문에, 신약 합성 시 실제 약효를 내는 광학 이성질체만 순수하게 얻어내는 것이 중요하다.
- 협조 기능형 금속 촉매: 두 반응물을 동시에 협조적으로 활성화시킬 수 있는 비대칭 금속 촉매로 두 개의 금속을 포함하는 두금속 촉매(bimetallic catalyst), 루이스 산/염기의 조합과 같은 다기능 촉매(bifunctional catalyst)로 분류된다.

그림 설명



(그림 1) 트리플루오로메틸케톤의 입체선택적 알킨 첨가반응을 위해 연구팀이 개발한 양이온 인식 다기능 협조 촉매



(그림 2) (a) THF에서 KO^tBu (0~70 μM)의 다양한 농도의 존재하에 L7-Ni (20 μM)의 UV-Vis 스펙트럼. 삽화: 403 nm에서 흡수도 versus KO^tBu의 농도에 관한 plot (b) THF에서 L7-Ni과 K⁺ 사이에 결합모드에 대한 Job plot. A_{obs}: 다양한 비율의 KO^tBu 존재 하에, 403 nm에서 L7-Ni의 흡수도; [L7-Ni] + [KO^tBu] = 40 μM, A_{con}: KO^tBu 없이, 403 nm에서 L7-Ni (40에서 0 μM)의 흡수도

사 진 설 명



(사진 1) 왼쪽부터 브라이언 스톨츠 교수(Brian M. Stoltz)와 홍석원 교수



(사진 2) 왼쪽부터 홍석원 교수와 브라이언 스톨츠 교수(Brian M. Stoltz)