

大连化物所催化吲哚杂环合成研究取得新进展

文章来源: 大连化学物理研究所 发布时间: 2015-07-20 【字号: 小 中 大】

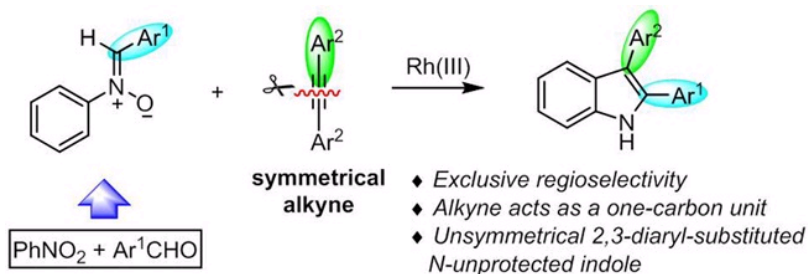
我要分享

近日, 中国科学院大连化学物理研究所催化杂环合成研究组(202组)万伯顺、王春翔等人成功实现了非对称2,3-二芳基吲哚的选择性合成, 相关结果以通讯的形式在线发表在《德国应用化学》上(*Angew. Chem. Int. Ed.* 2015, 54, DOI: 10.1002/anie.201503997)。

吲哚结构单元广泛存在于天然产物、药物和农药化学品中, 高效高选择性地合成吲哚及其衍生物受到有机合成化学家们越来越高度的重视。其中, 在吲哚化合物2,3-位上高选择性地引入取代基一直是研究的难点。已报道的研究通常通过预先官能化的原料或者多步反应来实现非对称2,3-二芳基取代吲哚的合成, 但步骤相对繁琐, 原子经济性差。更为直接的方法是通过苯胺衍生物与非对称炔烃反应, 然而反应的区域选择性很难控制, 通常得到两种区域异构体的混合物且很难分离。已有的研究表明, 非对称双芳基取代的炔烃上芳基取代基的电子效应对反应区域选择性的影响远大于位阻效应, 因而当使用非对称双芳基取代的炔烃作为反应原料时很难控制反应的区域选择性。

近年来, 万伯顺团队一直致力于发展催化杂环合成的新方法、新策略, 并成功实现了吡啶(*Angew. Chem. Int. Ed.* 2011, 50, 7162)、吡咯(*Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 1693)的选择性合成。该团队在研究炔烃与硝酮的[2+2+5]环加成反应中发现了原位生成的Rh(III)中间体, 并首次实现了氧桥联八元含氮杂环的合成和硝酮*M*-芳基上的C-H键活化(*Angew. Chem. Int. Ed.* 2014, 53, 11940)。为了解决吲哚合成中涉及的选择性问题, 研究组继续做了系统深入的研究, 使用对称的二芳基取代炔烃代替非对称的二芳基取代炔烃, 将其作为C1合成子引入到吲哚单元中(3-位取代基)。吲哚2-位的芳基取代基则来源于硝酮的*C*-芳基, 通过“剪切-拼接”的策略成功地实现了吲哚2,3-位上两个不同芳基取代基的引入, 反应具有高度专一选择性。该研究为吲哚的选择性合成以及进一步构建和发展其它杂环化合物提供了新的思路。

以上研究工作得到了国家自然科学基金项目的资助。



催化吲哚杂环合成研究取得新进展

(责任编辑: 任霄鹏)


附件:

热点新闻

李克强: 促进科技与大众创业万...

- 中科院“率先行动”计划组织实施方案
- “中国科学院科技创新年度巡展2015”在...
- 中科院与北京市海淀区领导会谈
- 中科院党组2015年夏季扩大会议在京召开
- 中科院党组专题学习“三严三实”

视频推荐



【新闻联播】“率先行动”计划 领跑科技体制改革

【东方卫视】中科院携手阿里共建量子实验室 研制量子计算机

专题推荐



相关新闻



© 1996 - 2015 中国科学院 版权所有 京ICP备05002857号 京公网安备110402500047号 可信网站身份验证 联系我们

地址：北京市三里河路52号 邮编：100864

