# 科学家提出钯催化戊烯基化反应中亲核与亲电位点的正交调控新策略

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/12691.html

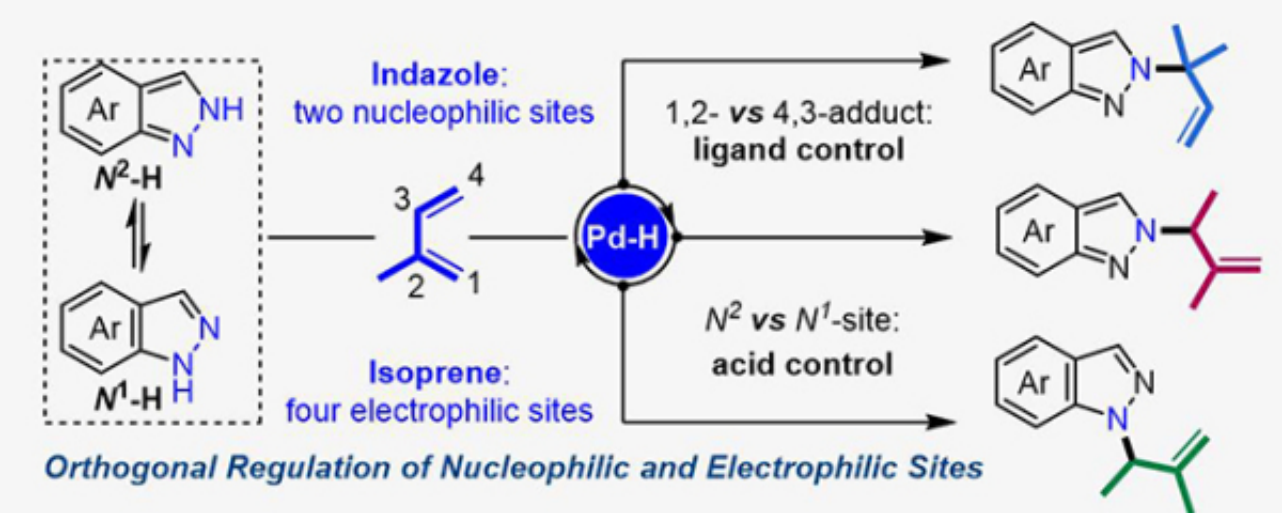
*本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！*

近日，中国科学院大连化学物理研究所研究员陈庆安团队和沈阳药科大学副教授蒋旭亮在钯催化吲唑与异戊二烯区域多样性偶联反应方面取得进展，发展了通过改变配体和添加剂实现正交调控的新策略，可构建结构丰富的N-烯丙基化的吲唑产物。

二甲基烯丙基相关的结构单元在增强药物分子的亲脂性和促进分子的跨细胞膜渗透方面具有重要应用。异戊二烯是一类价格低廉，广泛使用的大宗化学品，通过对异戊二烯的氢官能团化反应可以实现二甲基烯丙基化产物的快速构建，且反应具有较高原子经济性。然而，异戊二烯的四个碳原子在电性上差别较小，在氢官能团化反应中区域选择性调控困难。吲唑类化合物通常具有重要的生物活性，可作为吲哚的生物电子等排体，在生物和药物研究领域中有重要应用。由于吲唑类化合物存在一对互变异构体，对应有两个亲核反应位点，因此吲唑类化合物的选择性烯丙基化反应具有一定挑战。

*Angewandte Chemie International Edition*，2019；*Chemical Science*，2019；*Chinese Journal of Catalysis*，2020；*Angewandte Chemie International Edition*，2020）基础上，科研人员发展了钯催化的正交调控策略，实现了吲唑与异戊二烯的区域多样性偶联。在钯—氢催化体系中，通过改变配体控制异戊二烯的亲电反应位点，实现异戊二烯的1,2-或4,3-选择性加成；通过变化酸添加剂控制吲唑上两个氮亲核位点反应活性，实现吲唑N1和N2位置的选择性烯丙基化。该研究中的亲核与亲电位点正交调控策略对复杂体系中区域选择性的精准调控具有重要借鉴意义。

相关研究成果发表在《德国应用化学》上。研究工作得到国家自然科学基金、辽宁省“兴辽英才计划”等的资助。




大连化物所提出钯催化戊烯基化反应中亲核与亲电位点的正交调控新策略

研究团队单位：大连化学物理研究所

更多 科学进展 请访问 https://www.iikx.com/news/progress/

本文版权归原作者所有，请勿用于商业用途，爱科学iikx.com转发