兰州化物所芳香硝基化合物的选择性还原羰基化环化反应研究获进展

作者：writer 来源：中国科学院

本文原地址：https://www.iikx.com/news/progress/2556.html

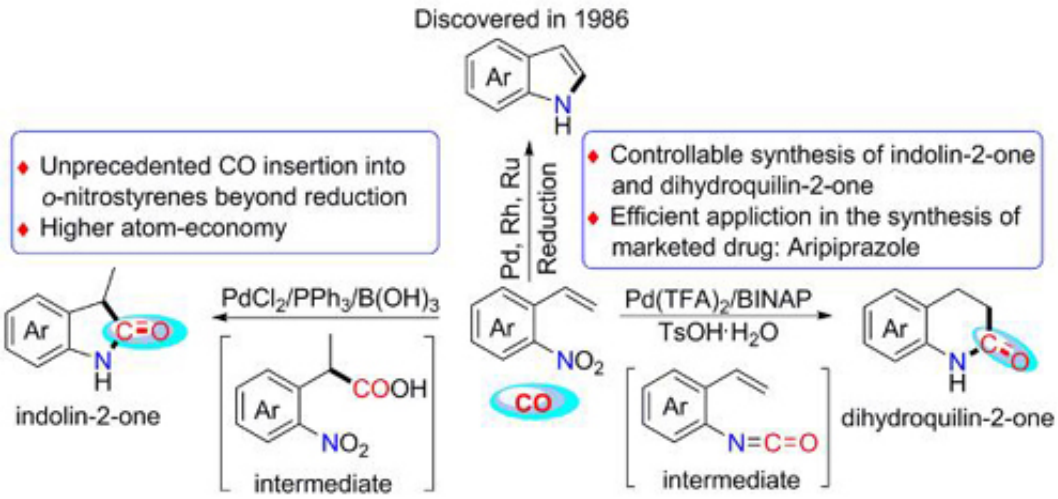
本文仅供学习交流之用，版权归原作者所有，请勿用于商业用途！

兰州化物所芳香硝基化合物的选择性还原羰基化环化反应研究获进展。近日，中国科学院兰州化学物理研究所羰基合成与选择氧化国家重点实验室李福伟研究小组发展了钯催化的CO选择性还原-插入邻硝基苯乙烯的反应新方法，成功实现了CO担任还原剂和羰基源的双重角色，具有较好的原子经济性。通过调控反应条件就可以选择性地制备吲哚啉-2-酮和喹啉-2-酮骨架化合物，这两类骨架化合物广泛存在于天然产物和药物分子中，例如褪黑素(Melatonin)衍生物、抗精神药物阿立哌唑(Aripiprazole)等。该工作为高效制备五元环和六元环内酰胺提供了一种新方法。

吲哚骨架化合物数量大、类型多，在生物、医药、农药、染料、香料等领域具有重要的应用价值。邻硝基苯乙烯还原环化是合成吲哚骨架化合物常用的方法之一，Cadogan-Soderberg反应就是以邻硝基苯乙烯衍生物为底物来合成吲哚，但需使用化学计量的有机膦作为脱氧剂，造成环境污染。1986年Cenini小组首次实现了金属催化一氧化碳(CO)还原邻硝基苯乙烯合成吲哚，在该催化体系中，一氧化碳担任Cadogan-Soderberg吲哚合成中有机膦的角色，大大提高了反应的原子经济性，解决了大量使用有机膦所带来的环境问题，但CO仅起还原剂的作用。三十余年来，Cenini、Driver、Soderberg等课题组为该反应发展了一系列高效催化剂，目前金属催化一氧化碳还原邻硝基苯乙烯法已成为合成吲哚的一个主要方法，但是实现CO同时作为羰基源插入一直是该领域的空白。

李福伟团队的研究结果表明，所用催化剂钯前驱物的抗衡阴离子对邻硝基苯乙烯转化为吲哚或含羰基化合物的化学选择性有重要影响，而配体控制CO插入邻硝基苯乙烯的区域选择性。利用该方法可以高效地实现克级合成抗精神药物阿立哌唑(Aripiprazole)，总产率高达77%。该研究结果近期发表于ACS Catalysis (2018, DOI:10.1021/acscatal.8b02863)。

该工作得到国家自然科学基金委优秀青年基金项目、兰州化物所“一三五”重点培育项目以及中科院前沿科学重点部署项目等的支持。



兰州化物所芳香硝基化合物的选择性还原羰基化环化反应研究获进展

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