



兰州化物所吡啶类杂环化合物羰基化反应研究获进展

文章来源：兰州化学物理研究所

发布时间：2012-11-07

【字号：小 中 大】

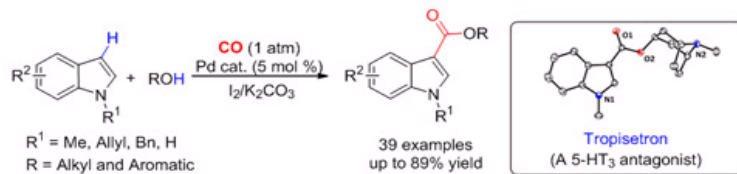
中国科学院兰州化学物理研究所羰基合成与选择氧化国家重点实验室在吡啶类化合物的直接羰基化转化研究方面取得新进展。

研究人员以钯为金属催化剂，碘为氧化剂，在一个大气压的一氧化碳压力下，高效地实现了各种吡啶与醇类、酚类化合物直接氢酯基化得到相应的吡啶-3-甲酸酯。在现有的C-H键直接氧化羰基化中，氧化剂多用于氧化金属有机催化剂中间体；而该体系的不同之处在于以碘为氧化剂定向氧化反应底物，生成相应的碘代物中间体，这样既可以完全抑制含有N-H官能团的底物发生副反应（如生成相应氨基甲酸酯），又能够避免传统C-H键氧化羰基化反应体系中，一氧化碳对金属催化剂的还原与氧化剂对催化剂活性中间体的氧化的矛盾，从而进一步提高催化效率。同时，利用该方法首次实现了由吡啶和托品醇一步羰基化合成具有生理活性的5-羟色胺拮抗剂(tropisetron)。研究成果发表于*Org. Lett.* (2012, 14, 4130 - 4133)。

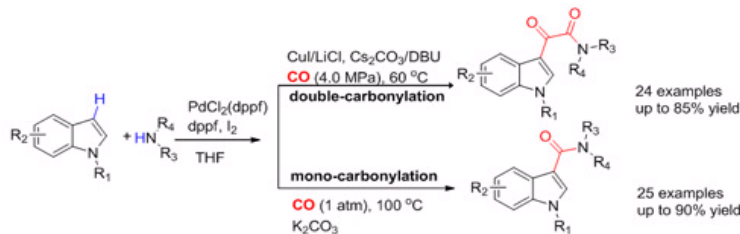
通过分子内胺基官能团的导向控制，实现分子内直接羰基化酰胺化的反应已有实例，但分子间、无导向基团控制的芳烃化合物的羰基化酰胺化反应还鲜有报道。该课题组研究人员利用上述氧化底物的策略，以PdCl₂(dppf)为催化剂，通过改变反应条件，可高效、高选择性地实现并调控吡啶-3-酰胺和吡啶-3-酮酰胺类化合物的催化合成。此外，该方法也能够用于一步制备具有药理活性的吡啶酮酰胺分子。研究成果发表于*Chem. Commun.* (2012, 48, 11023 - 11025)。

相关工作在第十七届全国金属有机化学学术讨论会上荣获优秀墙报奖。

上述研究工作得到了中科院“百人计划”和国家自然科学基金(21002106, 21133011)的支持。



钯催化羰基化合成吡啶-3-甲酸酯



钯催化合成吡啶单羰/双羰酰胺类化合物

