

รหัสโครงการ: MRG5580039

โครงการ: การสังเคราะห์ 1,3-Azoles และอนุพันธ์เฮเทอโรไซเคิล โดยใช้เบสและไอโอดีนเป็นตัวกลางในการเปลี่ยนพันธะคาร์บอน-ไฮโดรเจนเป็นพันธะคาร์บอน-เฮเทอโรอะตอม

นักวิจัย: อ.ดร.ศิริลดา ยศแผ่น ภาควิชาเคมี คณะวิทยาศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

E-mail Address: sirilata.yot@mahidol.ac.th

ระยะเวลาโครงการ: 2 กรกฎาคม 2555 – 1 กรกฎาคม 2557

Abstract

Many 2-Aminoazoles and their derivatives possess important biological and pharmaceutical properties. They are employed widely in medicinal chemistry, particularly in the treatment of brain diseases. In this research, two practical protocols for the synthesis of N-substituted 2-aminoazole derivatives are described. The first method is employing simple azole substrates, nitrogen nucleophiles, lithium *tert*-butoxide as the base, and iodine to mediate carbon–nitrogen bond formation. Another method is to employ CuCl catalyst, PPh₃ ligand, and LiOtBu base in the electrophilic amination reaction of benzoxazoles with O-benzoyl hydroxylamines. These two methods proceed at room temperature under an air atmosphere using a normal benchtop set-up, and enable the convenient preparation of various 2-aminobenzoxazole derivatives in good yields.

Keywords azole, 2-aminoazole, iodine, copper catalysis

บทคัดย่อ

สารอนุพันธ์ของ azole ที่มีหมู่ไนโตรเจนแทนที่ที่ตำแหน่งที่ C-2 (2-aminoazole) เป็นสารที่ออกฤทธิ์ทางชีวภาพ และมีการนำมาใช้ในการรักษาโรคเกี่ยวกับสมอง งานวิจัยนี้ได้ศึกษาและพัฒนาการสังเคราะห์สารในกลุ่มนี้โดยวิธีที่ง่าย ๆ ทำได้สะดวกและมีประสิทธิภาพ 2 วิธีคือ วิธีที่ใช้ azole, เอมีน, เบส, ไอโอดีนที่อุณหภูมิและความดันปกติ และอีกวิธีคือการสังเคราะห์ด้วยปฏิกิริยาที่ใช้โลหะทองแดงเป็นตัวเร่งปฏิกิริยาอิลิกโทรฟิลิกแอมิเนชันจากสารตั้งต้น benzoxazole และ O-benzoyl hydroxylamine โดยใช้ lithium *tert*-butoxide เบส วิธีการสังเคราะห์ทั้งสองวิธีนี้การสังเคราะห์นี้สามารถให้อนุพันธ์ของ benzoxazole หลายๆชนิดในปริมาณที่มากอย่างสะดวกและมีประสิทธิภาพ

คำหลัก: สาร azole, สาร 2-aminoazole, ไอโอดีน, การเร่งปฏิกิริยาโดยโลหะทองแดง