

| 有机合成反应原理丛书 |

# 氧化反应原理

孙昌俊 孙凤云 主编

YANGHUA  
FANYING  
YUANLI



化学工业出版社

| 有机合成反应原理丛书 |

# 氧化反应原理

孙昌俊 孙凤云

主编



化学工业出版社

· 北京 ·

## 图书在版编目 (CIP) 数据

氧化反应原理/孙昌俊, 孙风云主编. —北京: 化学工业出版社, 2017. 1

(有机合成反应原理丛书)

ISBN 978-7-122-28457-0

I. ①氧… II. ①孙… ②孙… III. ①氧化-有机化学-化学反应 IV. ①O621.25

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2016) 第 264727 号

---

责任编辑: 王湘民

装帧设计: 韩 飞

责任校对: 宋 玮

---

出版发行: 化学工业出版社 (北京市东城区青年湖南街 13 号 邮政编码 100011)

印 装: 三河市航远印刷有限公司

710mm×1000mm 1/16 印张 15¼ 字数 292 千字 2017 年 4 月北京第 1 版第 1 次印刷

---

购书咨询: 010-64518888 (传真: 010-64519686) 售后服务: 010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书, 如有缺损质量问题, 本社销售中心负责调换。

---

定 价: 88.00 元

版权所有 违者必究

## 前言

氧化反应是一类常见的有机化学反应，在有机合成、药物合成中占有非常重要的地位。有机化合物分子中，凡是失去电子或电子发生偏移，从而使碳原子上电子云密度降低的反应，统称为氧化反应。狭义上讲，则是指有机物分子中增加氧，失去氢或同时增加氧，失去氢的反应，而不涉及形成 C-X、C-N、C-S 等化学键形成的一类反应。

通过氧化反应可以合成种类繁多的化合物，例如醇、醛、酮、酸、酚、环氧化合物、脱氢化合物等，这些类型的化合物很多是有机合成、药物合成的中间体，而且很多药物分子本身就是其中的某一类化合物。

氧化反应通常是在氧化剂或氧化催化剂存在下实现的。氧化剂种类很多，既有无机氧化剂，又有有机氧化剂。一种氧化剂往往可以与多种不同的基团发生反应，而同一种基团也可以被多种氧化剂氧化，同时氧化过程伴随着很多副反应。在有机合成中，选择合适的氧化剂和反应条件是非常重要的。

氧化反应有各种不同的分类方法。本书将按照反应底物进行分类，逐一介绍各类有机化合物的氧化反应及其在合成中的应用。

关于氧化反应的反应机理，不同的反应底物、不同的氧化剂，其机理是不同的，本书在介绍各种具体的氧化反应时，将分别作简单介绍。

近年来有机化学、药物合成无论在理论研究方面，还是在具体的有机合成实践方面，都有了长足的发展。新的试剂不断被发现，原有的一些试剂，也不断开发出新的用途。为适应当前有机合成发展的新形式，我们组织编写一套有机合成反应原理丛书，主要包括氧化反应原理、还原反应原理、卤化反应原理、重排反应原理、缩合反应原理、杂环化反应原理、消除反应原理等，以期对有机化学的发展尽一份微薄之力。

本书有如下特点。

1. 有机氧化反应多种多样，氧化剂种类很多，本书尽量收集一些新的氧化剂，新的有机反应，并从反应机理上加以解释，以反映现代有机合成的特点。

2. 在编排方式上，按照有机化合物的类型，对每类化合物的各种氧化反应进行介绍，并对各种氧化剂的特点、适用范围进行了适当总结，尽量选用一些药物或药物中间体用作具体的反应实例。

3. 所选用的合成方法，真实可靠、可操作性强。加上我们四十年多年来的有机合成的实践和经验，对所选化合物进行了精心的筛选。

本书由孙昌俊、孙凤云主编。王秀菊、孙琪、马岚、孙中云、孙雪峰、张廷峰、张纪明、辛炳炜、连军、周峰岩、房士敏、曹晓冉、隋洁参与了部分内容的编写和资料收集工作。山东大学化学化工学院赵宝祥教授、化学工业出版社的有关同志给予了大力支持，在此一并表示感谢。

本书实用性强，适合从事医药、化学、应化、生化、农药、染料、颜料、日用化工、助剂、试剂等行业的生产、科研、教学、实验室工作者以及大专院校的教师、研究生、本科生使用。

限于水平有限，书中疏漏和不妥之处在所难免，恳请读者批评指正。

孙昌俊

2016年8月 于济南

## 符号说明

|                |                                           |                       |
|----------------|-------------------------------------------|-----------------------|
| Ac             | acetyl                                    | 乙酰基                   |
| AcOH           | acetic acide                              | 乙酸                    |
| AIBN           | 2,2'-azobisisobutyronitrile               | 偶氮二异丁腈                |
| Ar             | aryl                                      | 芳基                    |
| 9-BBN          | 9-borabicyclo[3. 3. 1]nonane              | 9-硼双环[3. 3. 1]壬烷      |
| Bn             | benzyl                                    | 苄基                    |
| BOC            | <i>t</i> -butoxycarbonyl                  | 叔丁氧羰基                 |
| bp             | boiling point                             | 沸点                    |
| Bu             | butyl                                     | 丁基                    |
| Bz             | benzoyl                                   | 苯甲酰基                  |
| Cbz            | benzyloxycarbonyl                         | 苄氧羰基                  |
| CDI            | 1,1'-Carbonyldiimidazole                  | 1,1'-羰基二咪唑            |
| <i>m</i> -CPBA | <i>m</i> -chloropetoxycarboxylic acid     | 间氯过氧苯甲酸               |
| cymene         |                                           | 异丙基甲苯                 |
| DABCO          | 1,4-diazabicyclo[2. 2. 2]octane           | 1,4 二氮杂二环[2. 2. 2]辛烷  |
| DCC            | dicyclohexyl carbodiimide                 | 二环己基碳二亚胺              |
| DDQ            | 2,3-dichloro-5,6-dicyano-1,4-benzoquinone | 2,3-二氯-5,6-二氰基-1,4-苯醌 |
| DEAD           | diethyl azodicarboxylate                  | 偶氮二甲酸二乙酯              |
| dioxane        | 1,4-dioxane                               | 1,4-二氧六环              |
| DMAC           | <i>N,N</i> -dimethylacetamide             | <i>N,N</i> -二甲基乙酰胺    |
| DMAP           | 4-dimethylaminopyridine                   | 4-二甲氨基吡啶              |
| DME            | 1,2-dimethoxyethane                       | 1,2-二甲氧基乙烷            |
| DMF            | <i>N,N</i> -dimethylformamide             | <i>N,N</i> -二甲基甲酰胺    |
| DMSO           | dimetyl sulfoxide                         | 二甲亚砜                  |
| dppb           | 1,4-bis(diphenylphosphino)butane          | 1,4-双(二苯膦基)丁烷         |
| dppe           | 1,4-bis(diphenylphosphino)ethane          | 1,4-双(二苯膦基)乙烷         |
| Ee             | enantiomeric excess                       | 对映体过量                 |
| <i>endo</i>    |                                           | 内型                    |
| <i>exo</i>     |                                           | 外型                    |
| Et             | ethyl                                     | 乙基                    |
| EtOH           | ethyl alcohol                             | 乙醇                    |
| <i>hν</i>      | irradiation                               | 光照                    |
| HMPA           | hexamethylphosphorictriamide              | 六甲基磷酰三胺               |
| HOBt           | 1-hydroxybenzotriazole                    | 1-羟基苯并三唑              |
| HOMO           | highest occupied molecular orbital        | 最高占有轨道                |
| <i>i</i> -     | iso-                                      | 异                     |
| LAH            | lithium aluminum hydride                  | 氢化铝锂                  |

|                  |                                        |                   |
|------------------|----------------------------------------|-------------------|
| LDA              | lithium diisopropyl amine              | 二异丙基氨基锂           |
| LHMDS            | lithium hexamethyldisilazane           | 六甲基二硅胺锂           |
| LUMO             | lowest unoccupied molecular orbital    | 最低空轨道             |
| <i>m</i> -       | meta-                                  | 间位                |
| mp               | melting point                          | 熔点                |
| MW               | microwave                              | 微波                |
| <i>n</i> -       | normal                                 | 正                 |
| NBA              | <i>N</i> -bromo acetamide              | <i>N</i> -溴代乙酰胺   |
| NBS              | <i>N</i> -brobo succinimide            | <i>N</i> -溴代丁二酰亚胺 |
| NCA              | <i>N</i> -chlorosuccinimide            | <i>N</i> -氯代乙酰胺   |
| NCS              | <i>N</i> -chloro succinimide           | <i>N</i> -氯代丁二酰亚胺 |
| NIS              | <i>N</i> -iodo succinimide             | <i>N</i> -碘代丁二酰亚胺 |
| NMM              | <i>N</i> -methylmorpholine             | <i>N</i> -甲基吗啉    |
| NMP              | <i>N</i> -methyl-2-pyrrolidinone       | <i>N</i> -甲基吡咯烷酮  |
| TEBA             | triethyl benzyl ammonium salt          | 三乙基苄基铵盐           |
| <i>o</i> -       | ortho                                  | 邻位                |
| <i>p</i> -       | para                                   | 对位                |
| Ph               | phenyl                                 | 苯基                |
| PPA              | poly phosphoric acid                   | 多聚磷酸              |
| Pr               | propyl                                 | 丙基                |
| Py               | pyridine                               | 吡啶                |
| R                | alkyl etc.                             | 烷基等               |
| rt               | room temperature                       | 室温                |
| <i>t</i> -       | tert-                                  | 叔-                |
| S <sub>N</sub> 1 | unimolecular nucleophilic substitution | 单分子亲核取代           |
| S <sub>N</sub> 2 | bimolecular nucleophilic substitution  | 双分子亲核取代           |
| TBAB             | tetrabutylammonium bromide             | 四丁基溴化铵            |
| TEA              | triethylamine                          | 三乙胺               |
| TEBA             | triethylbenzylammonium salt            | 三乙基苄基铵盐           |
| Tf               | trifluoromethanesulfonyl (triflyl)     | 三氟甲磺酰基            |
| TFA              | trifluoroacetic acid                   | 三氟乙酸              |
| TFAA             | trifluoroacetic anhydride              | 三氟乙酸酐             |
| THF              | tetrahydrofurane                       | 四氢呋喃              |
| TMP              | 2,2,6,6-tetramethylpiperidine          | 2,2,6,6-四甲基哌啶     |
| Tol              | toluene or tolyl                       | 甲苯或甲苯基            |
| triglyme         | triethylene glycol dimethyl ether      | 三甘醇二甲醚            |
| Ts               | tosyl                                  | 对甲苯磺酰基            |
| TsOH             | tosic acid                             | 对甲苯磺酸             |
| Xyl              | xylene                                 | 二甲苯               |

## 目 录

### 第一章 烷烃的氧化与脱氢

1

第一节 烷烃的氧化 ..... 1

第二节 烷烃的脱氢反应 ..... 4

### 第二章 烯烃的氧化

7

第一节 双键的氧化断裂反应 ..... 7

一、烯烃的高锰酸钾氧化 ..... 7

二、烯烃的重铬酸盐氧化 ..... 10

三、烯烃的臭氧氧化 ..... 11

四、双键的其他氧化剂氧化断裂 ..... 15

第二节 烯烃的二羟基化 ..... 15

一、烯烃的高锰酸钾氧化 ..... 16

二、烯烃的四氧化锇 ( $\text{OsO}_4$ ) 氧化 ..... 18

三、烯烃的过酸氧化水解 ..... 22

四、Woodward 反应和 Prevost 反应 ..... 23

第三节 烯烃的环氧化反应 ..... 24

一、氧气氧化 ..... 25

二、过氧化氢氧化 ..... 27

三、烷基过氧化物氧化 ..... 28

四、有机过酸氧化 ..... 30

五、二甲基二氧杂环丙烷 (DMDO) 氧化 ..... 33

|                                     |    |
|-------------------------------------|----|
| 六、Katsuki-Sharpleess 不对称环氧化反应 ..... | 37 |
| 七、Jacobsen-Katsuki 不对称环氧化反应 .....   | 39 |
| 八、Shi 不对称环氧化反应 .....                | 41 |
| 第四节 烯烃的催化氧化 .....                   | 44 |
| 第五节 烯烃的其他氧化反应 .....                 | 46 |
| 第六节 烯烃 $\alpha$ -H 的氧化反应 .....      | 49 |

### 第三章

### 炔烃的氧化

55

|                              |    |
|------------------------------|----|
| 第一节 炔键的氧化断裂反应 .....          | 55 |
| 第二节 端基炔的氧化偶联反应 .....         | 57 |
| 第三节 炔烃氧化生成酮 .....            | 58 |
| 第四节 炔键 $\alpha$ -H 的氧化 ..... | 61 |

### 第四章

### 芳烃的氧化

62

|                     |    |
|---------------------|----|
| 第一节 芳烃的侧链氧化 .....   | 62 |
| 一、芳环侧链氧化为芳基羧酸 ..... | 62 |
| 二、侧链氧化为羰基化合物 .....  | 67 |
| 三、氧化为醇 .....        | 71 |
| 第二节 芳环的氧化 .....     | 72 |
| 一、芳烃氧化生成酚 .....     | 72 |
| 二、芳环的氧化偶联反应 .....   | 74 |
| 三、芳环被破坏的氧化 .....    | 75 |

### 第五章

### 卤代烃的氧化

80

|                            |    |
|----------------------------|----|
| 第一节 卤代烷被含氮试剂氧化为羰基化合物 ..... | 80 |
| 一、Sommelet 反应 .....        | 80 |
| 二、Kröhnke 氧化反应 .....       | 82 |
| 第二节 卤代烷被二甲亚砷氧化为羰基化合物 ..... | 85 |
| 第三节 卤代烷的其他氧化法 .....        | 86 |

|                  |    |
|------------------|----|
| 一、硝酸酯的水解 .....   | 86 |
| 二、2-硝基丙烷法 .....  | 87 |
| 三、其他氧化剂氧化法 ..... | 88 |

## 第六章 醇的氧化和脱氢 90

|                       |     |
|-----------------------|-----|
| 第一节 化学法氧化为羰基化合物 ..... | 90  |
| 一、无机氧化剂 .....         | 90  |
| 二、有机氧化剂 .....         | 100 |
| 第二节 醇的催化氧化和脱氢 .....   | 110 |
| 第三节 叔醇的氧化 .....       | 113 |
| 第四节 二元醇的氧化 .....      | 113 |
| 第五节 醇氧化为羧酸 .....      | 119 |

## 第七章 酚的氧化 122

|                     |     |
|---------------------|-----|
| 第一节 Elbs 氧化反应 ..... | 122 |
| 第二节 氧化生成醌类化合物 ..... | 124 |
| 第三节 酚的氧化偶联反应 .....  | 128 |
| 第四节 酚的开环氧化 .....    | 129 |

## 第八章 醚的氧化反应 131

|                         |     |
|-------------------------|-----|
| 第一节 醚类化合物氧化成酯 .....     | 131 |
| 第二节 醚类化合物氧化为羰基化合物 ..... | 133 |
| 第三节 醚类化合物氧化为羧酸 .....    | 134 |

## 第九章 醛、酮的氧化反应 135

|                    |     |
|--------------------|-----|
| 第一节 醛的氧化 .....     | 135 |
| 一、氧化成羧酸 .....      | 135 |
| 二、Dakin 氧化反应 ..... | 138 |

|                                         |     |
|-----------------------------------------|-----|
| 三、Cannizzaro 反应 .....                   | 140 |
| 第二节 酮的氧化 .....                          | 141 |
| 一、Baeyer-Villiger 反应 (拜耶尔-魏立格反应) .....  | 142 |
| 二、羰基化合物 $\alpha$ -氢的氧化和脱氢 .....         | 145 |
| 三、酮氧化生成过氧化物 .....                       | 147 |
| 四、卤仿反应 .....                            | 148 |
| 五、 $\alpha$ -羟基酮和 $\alpha$ -二酮的氧化 ..... | 149 |
| 六、氧化为羧酸 .....                           | 151 |

## 第十章 羧酸的氧化 153

|                      |     |
|----------------------|-----|
| 第一节 有机过氧酸 .....      | 153 |
| 第二节 氧化脱羧反应 .....     | 154 |
| 一、羧酸金属盐的脱羧 .....     | 154 |
| 二、四醋酸铅催化下的脱羧反应 ..... | 157 |
| 三、卤化脱羧反应 .....       | 161 |
| 第三节 取代羧酸的脱羧 .....    | 163 |

## 第十一章 羧酸衍生物的氧化 165

|                 |     |
|-----------------|-----|
| 第一节 酰氯的氧化 ..... | 165 |
| 第二节 酸酐的氧化 ..... | 167 |
| 第三节 酯的氧化 .....  | 168 |
| 一、酯的热裂解反应 ..... | 168 |
| 二、脱酯基反应 .....   | 170 |
| 第四节 酰胺的氧化 ..... | 172 |

## 第十二章 含氮化合物的氧化 176

|                               |     |
|-------------------------------|-----|
| 第一节 硝基化合物的氧化 .....            | 176 |
| 一、硝基烷烃的氧化 .....               | 176 |
| 二、 $\alpha$ -硝基羧酸的制备和脱羧 ..... | 179 |

|                       |     |
|-----------------------|-----|
| 第二节 胺的氧化 .....        | 180 |
| 一、胺氧化为硝基化合物 .....     | 180 |
| 二、叔胺氧化物 .....         | 183 |
| 三、氧化为酰胺 .....         | 187 |
| 四、芳香胺氧化为醌 .....       | 188 |
| 五、氧化为腈 .....          | 189 |
| 六、氧化为羰基化合物或羧酸 .....   | 191 |
| 七、芳香胺氧化为偶氮化合物 .....   | 193 |
| 八、胺氧化为亚硝基化合物和羟胺 ..... | 194 |
| 九、芳香胺芳环上的氧化反应 .....   | 195 |
| 十、亚胺的氧化 .....         | 196 |
| 第三节 肟的氧化 .....        | 197 |
| 一、肟氧化为硝基化合物 .....     | 198 |
| 二、肟氧化为羰基化合物 .....     | 199 |
| 第四节 亚硝基化合物的氧化 .....   | 200 |
| 第五节 偶氮和偶氮氧化物的氧化 ..... | 202 |
| 第六节 腈的氧化 .....        | 203 |
| 第七节 肼的氧化 .....        | 205 |
| 第八节 胂的氧化 .....        | 206 |

## 第十三章 糖类化合物的氧化

209

|                  |     |
|------------------|-----|
| 第一节 糖羰基的氧化 ..... | 210 |
| 第二节 糖羟基的氧化 ..... | 212 |

## 第十四章 $\alpha$ -氨基酸的氧化

216

|                                     |     |
|-------------------------------------|-----|
| 第一节 $\alpha$ -氨基酸脱羧脱氨基生成羰基化合物 ..... | 216 |
| 第二节 $\alpha$ -氨基酸氧化为腈类化合物 .....     | 220 |

## 第十五章 含硫化合物的氧化

221

|                          |     |
|--------------------------|-----|
| 第一节 硫醇、硫酚、异硫氰酸酯的氧化 ..... | 221 |
|--------------------------|-----|

|                              |     |
|------------------------------|-----|
| 一、硫醇、硫酚氧化为二硫化物 .....         | 221 |
| 二、硫醇、硫酚和异硫氰酸酯氧化为磺酸类化合物 ..... | 223 |
| 第二节 二硫化物的氧化 .....            | 224 |
| 第三节 硫醚氧化为亚砷和砷 .....          | 225 |
| 第四节 其他含硫化合物的氧化 .....         | 228 |

## 参考文献

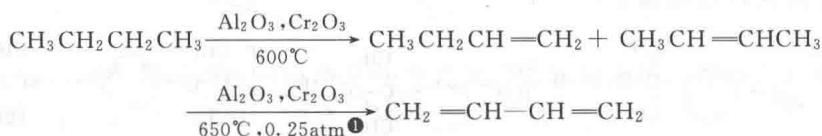
230

## 化合物名称索引

231

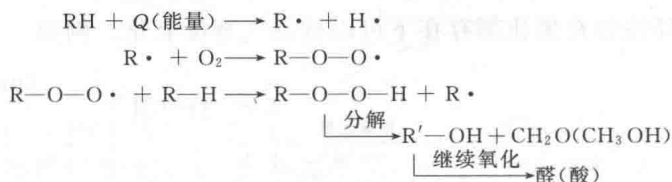
# 第一章 烷烃的氧化与脱氢

烷烃是性质稳定的一类化合物，但在一定的条件下可以被氧化。烷烃燃烧后生成二氧化碳和水，并放出热量，是烷烃作为能源的基本反应。在有机合成、药物合成中，许多烷烃类化合物氧化或脱氢后可以生成重要的有机合成、药物合成的中间体。例如：



## 第一节 烷烃的氧化

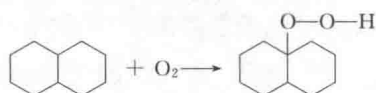
氧（空气）是最廉价的氧化剂。氧的电负性很大，为 3.50。从其电子结构来看，两个反键轨道中各有一个孤立电子，属于双自由基结构，具有较高的反应性能，可以将烷烃氧化。空气氧化属自由基型反应机理，生成氢过氧化物，氢过氧化物再分解成相应的氧化产物。



C-H 键被空气中的氧氧化为过氧化物（R—O—OH）的反应为自动氧化。光 and 高温有利于自动氧化过程。在烃类化合物中，伯、仲、叔碳原子上的氢相比

① 注：1atm=101325Pa。

较，则叔碳原子上的氢更容易被氧化。例如：

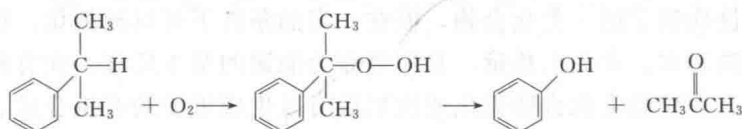


烯丙位和苄基位上的氢最容易被氧化。

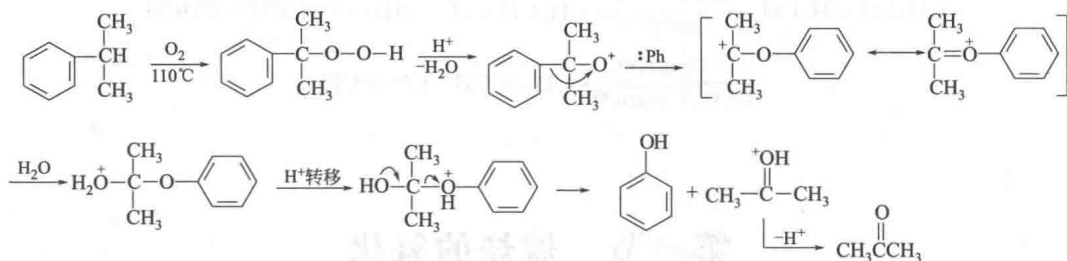
自然界中这种自动氧化很普遍。例如油脂类化合物，分子中含有烯键，烯丙基位的氢容易被氧化，故油脂久置后会变味。

在药物合成中，烃类的空气氧化可以直接制备有机过氧化物、醇、醛、酮、羧酸等一系列化合物。

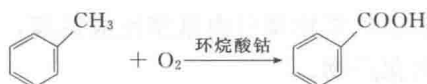
异丙苯氧化而后分解，是工业上合成苯酚和丙酮的一种重要的方法。苯酚和丙酮都是重要的医药中间体和化工原料。



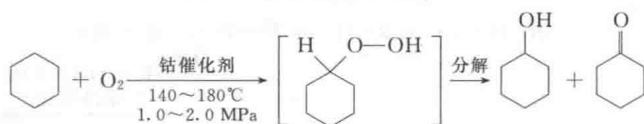
反应的大致过程如下：



空气或氧气作为氧化剂，在医药工业上的主要用途是进行催化氧化，即在催化剂存在下用空气或氧气进行氧化。常用的催化剂有 Cu、Co、Pt、Ag、V 或其衍生物。例如：

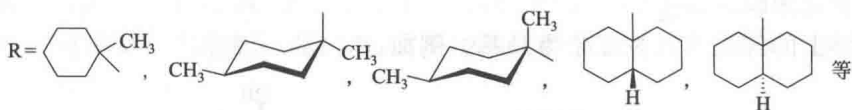
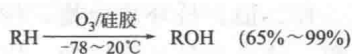


环烷烃在催化剂存在下可以被空气直接氧化。例如：

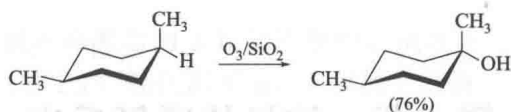


生成的环己酮是降血压药格列齐特 (Gliclazide) 等的中间体。

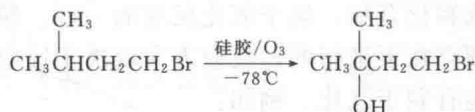
很多氧化剂可以将烷烃氧化，因为烷烃分子中含有各种氢（伯、仲、叔氢），氧化不十分专一，但环烷烃环上的叔氢却是专一性反应。例如，低温下吸附于硅胶的臭氧可以使环烷烃叔氢氧化为叔醇。



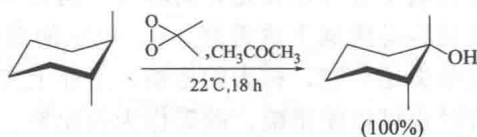
顺式十氢萘、顺(反)-1,4-二甲基环己烷的氧化结果表明,环上的叔氢氧化时,所连接的碳原子的绝对构型几乎不变,而且反应的产率较高。例如:



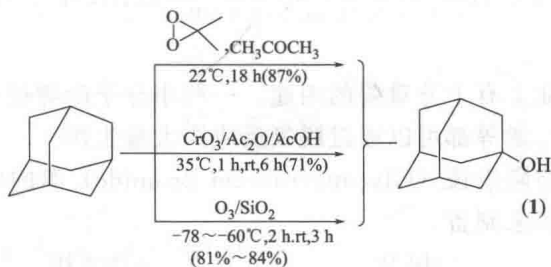
3-甲基-1-溴丁烷吸附于硅胶上,于 $-78^\circ\text{C}$ 用臭氧氧化,叔碳上的氢被氧化生成相应的叔醇。



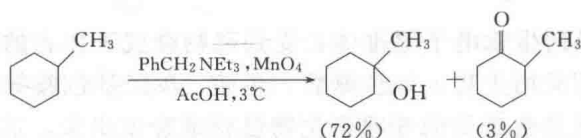
二甲基二氧杂环丙烷也可以将某些烃类化合物氧化为醇。各种氢的氧化由易至难的顺序是:叔氢、仲氢、伯氢。例如:



又如治疗痤疮的药物阿达帕林(Adapalene)的中间体1-金刚醇(1)可以由金刚烷的氧化来合成。



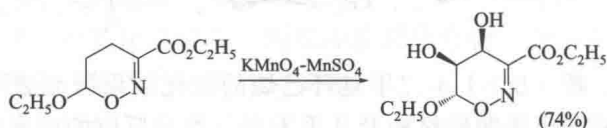
甲基环己烷可以被高锰酸季铵盐(相转移催化剂)氧化为相应的叔醇。



由以上实例可以看出,一般情况下,叔碳原子上的氢更容易被氧化,C-H

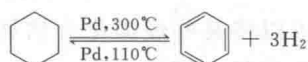
键反应的活性顺序为：叔、仲、伯。桥环化合物，桥头位置的叔碳原子上的氢容易被氧化，氧化产物为叔醇，这类叔醇是稳定的，因为其既不容易脱水成烯，也不能被氧化为酮。

杂环上的氢也可以被氧化为羟基。例如：

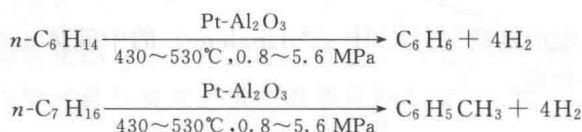


## 第二节 烷烃的脱氢反应

烷烃脱氢生成不饱和化合物，属于氧化反应的一种。脱氢和氢化反应是可逆过程，反应是在催化剂存在下进行的，反应方向取决于反应温度。一般而言，高温有利于脱氢，而低温有利于氢化。例如：

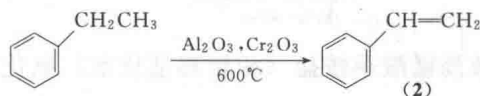


六元脂环类化合物脱氢生成芳烃类化合物称为芳构化反应，是工业上制备芳烃的重要方法，环烯则更容易脱氢生成芳烃。 $\text{C}_6 \sim \text{C}_8$  的直链烷烃也可以在铂催化剂存在下芳构化生成苯类化合物，称为铂重整。工业上实现芳构化的催化剂主要是铂、钨、镍等。有时也可以使用硫、硒等作为催化剂。



脱氢反应在工业上有十分重要的用途。一些小分子的烯烃化合物如乙烯、丙烯、丁二烯、异戊二烯等都可以通过脱氢反应来大量生产。

胃病治疗药物格隆溴铵 (Glycopyrronium Bromide) 等的中间体苯乙烯 (2) 可以通过乙苯的脱氢来制备。



吲唑作为吲哚的生物电子等排体，受到药物合成工作者的广泛重视。许多具有生物活性的吲哚衍生物，如色氨酸、色胺、5-羟基色胺等以及具有很强抗辐射作用的 5-甲氧基色胺等的吲唑衍生物已相继合成出来，这些化合物都不同程度地保留了原吲哚衍生物的活性。化疗止吐药盐酸格拉司琼 (Granisetron