**自然科学奖公示**

**项目名称：**氮杂环合成中的串联反应研究

**主要完成人：**肖文精、陆良秋、陈加荣、邹有全、阳青青

**主要完成单位：**华中师范大学

**推荐奖种及等级：**自然科学奖/一等奖

**项目简介：**

该项目属于“有机化学”学科中的“有机合成化学”和“有机光化学”领域，旨在通过串联反应发展合成氮杂环的新方法。

氮杂环是一类十分重要的有机化合物，由于其结构多样、种类繁多并具有独特的结构和性质，在生命科学、医药、农药、材料化学等许多领域发挥着重要作用。如何发展简单、安全、环境友好的合成转化，实现氮杂环的精准合成已经成为化学合成研究领域的一个重要课题。

该项目通过可见光诱导的光氧化还原催化策略、硫叶立德试剂的应用及相关串联反应的合理设计，为几类重要氮杂环的高效、高选择性合成提供了科学基础，并显示出潜在的应用前景。本项目的主要发现点如下：

1、基于可见光催化策略，通过串联反应的合理设计，温和条件下精准合成吡咯和二氢异喹啉并吡咯等多种氮杂环化合物并研究了这些反应的机理；同时，利用可见光催化的氧化羟基化反应，将芳基硼酸转化成苯酚类化合物。相关研究成果发表在Angew. Chem. Int. Ed.上。

2、基于硫叶立德试剂独特的反应性质，通过立体和电子因素的多重调控，设计并实现了多类新型的串联反应，选择性合成了手性吡咯啉、吲哚等杂环化合物；同时，利用不对称Lewis酸催化策略，通过吲哚的串联Michael加成-半缩醛化过程合成了重要的手性多环吲哚类化合物。相关研究成果发表在Angew. Chem. Int. Ed.上。

**代表性论文专著目录：**

|  |  |
| --- | --- |
| 论文名称/刊名/作者 | 年、卷、页码 |
| Visible-Light-Induced Formal [3+2] Cycloaddition for Pyrrole Synthesis under Metal-Free Conditions/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Xuan, J.; Zeng, T.-T.; Feng, Z.-J.; Chen, J.-R.; Lu, L.-Q.;\* Xiao, W.-J.\* | 2014/53/5653 |
| Highly Enantioselective Friedel–Crafts Alkylation/N-Hemiacetalization Cascade Reaction with Indoles/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Cheng, H.-G.; Lu, L.-Q.; Wang, T.; Yang, Q.-Q.; Liu, X.-P.; Li, Y.; Deng, Q.-H.; Chen, J.-R.; \* Xiao, W.-J.\* | 2013/52/3250 |
| Development of Cascade Reactions for the Concise Construction of Diverse Heterocyclic Architectures/**Acc. Chem. Res.**/Lu, L.-Q.; Chen, J.-R.; Xiao, W.-J.\* | 2012/45/1278 |
| Synthesis of Indoles through Highly Efficient Cascade Reactions of Sulfur Ylides and N-(ortho-Chloromethyl)aryl Amides/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Yang, Q.-Q.; Xiao, C.; Lu, L.-Q.; An, J.; Tan, F.; Li, B.-J.; Xiao, W.-J.\* | 2012/51/9137 |
| Visible-Light Photoredox Catalysis/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Xuan, J.; Xiao, W.-J.\* | 2012/51/6828 |
| Highly Efficient Aerobic Oxidative Hydroxylation of Arylboronic Acids: Photoredox Catalysis Using Visible Light/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Zou, Y.-Q.; Chen, J.-R.; Liu, X.-P.; Lu, L.-Q.; Davis, R. L.; Jørgensen, K. A.; Xiao, W.-J.\* | 2012/51/784 |
| Visible-Light-Induced Oxidation/[3+2] Cycloaddition/Oxidative Aromatization Sequence: A Photocatalytic Strategy To Construct Pyrrolo[2,1-a]isoquinolines/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Zou, Y.-Q.; Lu, L.-Q.; Fu, L.; Chang, N.-J.; Rong, J.; Chen, J.-R.; Xiao, W.-J.\* | 2011/50/7171 |
| Tuning Electronic and Steric Effects: Highly Enantioselective [4+1] Pyrroline Annulation of Sulfur Ylides with α,β-Unsaturated Imines/**Angew. Chem. Int. Ed.**/Lu, L.-Q.; Zhang, J.-J.; Li, F.; Cheng, Y; An, J.; Chen, J.-R.\*; Xiao, W.-J.\* | 2010/49/4495 |

**主要完成人情况**：

|  |  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| 姓名 | 排名 | 行政职务 | 技术职称 | 工作单位 | 完成单位 | 对本项目技术创造性贡献 |
| 肖文精 | 1 | 院长 | 教授 | 华中师范大学 | 华中师范大学 | 项目总负责人，全面负责项目总体方向的确定、研究思路的提出以及研究方案的设计，是发现点1，2的主要贡献者。 |
| 陆良秋 | 2 | 无 | 教授 | 华中师范大学 | 华中师范大学 | 项目的主要参与者之一，负责该项目中部分内容的设计与实施，对发现点1、2均做出重要贡献。是代表性论文3, 8的第一作者，代表性论文1的共同通讯作者。 |
| 陈加荣 | 3 | 无 | 副教授 | 华中师范大学 | 华中师范大学 | 项目的主要参与者之一，负责该项目中部分内容的设计与实施，对发现点1、2均做出重要贡献。是代表性论文2,8的共同通讯作者。 |
| 邹有全 | 4 | 无 | 无 | 慕尼黑工业大学 | 华中师范大学 | 项目的重要参与者，利用可见光催化策略发展一类新型的氧化/1,3偶极环加成/芳构化串联反应，高效地构建了天然产物片螺素的核心骨架吡咯[2,1-a]异喹啉；通过将可见光和空气氧化结合，实现了芳基硼酸的氧化羟基化。是代表性论文6, 7的第一作者。 |
| 阳青青 | 5 | 无 | 无 | 三峡大学 | 华中师范大学 | 项目的重要参与者，发展了硫叶立德与N-2’-氯甲基苯基-4-甲基苯磺酰胺的一类新型串联环化反应，在室温和无需催化剂的条件下高效地合成了吲哚类化合物。是代表性论文4的第一作者。 |