**2024年度云南省科学技术奖提名项目公示内容**

**一、项目名称**

含氮/氧有机化合物的催化合成新方法研究

**二、提名者及提名等级**

提名者：云南大学

提名等级：云南省自然科学二等奖

**三、项目简介**

高官能化含氮/氧有机化合物广泛存在于各种生物活性天然产物、功能材料和药物分子中。发展新方法高效、高选择性催化合成多样性含氮/氧有机化合物是有机化学前沿研究领域之一。在国家自然科学基金委、云南省科技厅等资助下，该项目针对若干重要而合成上具有挑战性的高官能化含氮/氧化合物的催化合成，开展了一系列研究工作。主要取得了以下成果：

**1. 以易得的烯胺酮和卡宾前体为原料，巧妙设计了一种金属银催化条件下的[4+1C]插入反应策略，实现了高效的，区域选择性和化学选择性的吡咯环构筑方法。**机理研究表明该方法在金属银离子的催化下，经历 “C‒C键插入—环化缩合—[1,5]选择性基团迁移”的三联串级反应历程，金属银离子配位性对化学选择性与区域选择性起到决定影响。项目组成功的将该反应策略应用于具有抗肿瘤活性的海洋天然产物Lamellarin L全合成，和已经报道的方法比较，是目前合成步骤最短，反应总产率最高的方法。

**2. 成功制备了一种全新的超分子催化剂——吡啶酰胺修饰的β-环糊精/Pd(II)配合物（Pd(II)@PCA-β-CD），专门用于Suzuki-Miyaura偶联反应。**这一催化剂展现出了令人瞩目的高效催化活性，特别是在环境友好的水溶液中，对于含氮/氧的芳基、杂芳基、苄基和烯丙基卤化物与芳基硼酸的偶联反应表现出卓越的催化效果，具有出色的稳定性和可重复使用性，体现出该催化剂具有良好的应用范围和实用性。

**3. 设计了光催化氧化单线态氧介导的开环与闭环这个独特策略，实现对饱和环醚的无金属双C(sp3)-H键官能化。**从而获得一种新颖的方式来制备氢化苯并呋喃、吡喃以及1.4-二氧六环等重要具有药理活性的化合物。理论研究证实开环中间体通过单线态氧介导的C(sp3)-H活化生成，与醛和活化的亚甲基化合物发生反应，高效控制产物的非对映选择性。该方法在医药、农药和材料科学等领域为新颖物质的探索提供便捷的合成路径和工具。

**4. 设计了一种铜催化的自由基加成和氧化级联反应来制备非对称性异三聚吲哚（i-TATs）的新颖方法。**极大简化了i-TATs分子的的合成步骤，还克服了传统合成这类光电材料方法中存在的低反应效率以及异构体混合物难以分离等问题。所合成的i-TAT材料经光电性能表征，展现出了优异的性能，有望在OLED、OFET、OPV等有机电子器件中发挥重要作用。

本项目在ACS Catalysis，Organic Letters, Chemical Communication等国际著名化学期刊发表研究性论文17篇，单篇最高影响因子13.0，累计SCI他引187次。其中8篇代表性论文都是中科院分区和JCR的一区论文，累计影响因子60.113，SCI他引122次，有5篇发表在Nature Index期刊，1篇作为封面文章，1篇被Synfacts选为“亮点”评述。这些原创性研究成果，得到有机化学领域国内外著名学者的普遍认同和高度评价，并具有良好的应用前景。建立了“云南省高校化学原料药及药物中间体工程研究中心”，培养了云南省“云岭学者”、中国药学会“最美科技工作者”、云南省药学会“最美科技工作者”、“云南省中青年学术与技术带头人”，云南大学“东陆青年英才”，博士研究生5人，硕士研究生15人等一批优秀人才，形成了一支专业、年龄结构合理、在有机化学研究领域具有重要影响力的研究团队。

**四、代表性论文专著目录**

1. Kaixiu Luo, Shuai Mao, Kun He, Xianglin Yu, Junhong Pan, Jun Lin, Zhihui Shao, Yi Jin. Highly regioselective synthesis of multisubstituted pyrroles via Ag-catalyzed [4+ 1C] insert cascade. ACS Catalysis, 2020, 10, 3733-3740.

2. Kaixiu Luo, Lu Zhang, Rui Yang, Yi Jin, Jun Lin. Picolinamide modified β-cyclodextrin/Pd (II) complex: Asupramolecular catalyst for Suzuki-Miyaura coupling of aryl, benzyl and allyl halides with arylboronic acids in water. Carbohydrate polymers, 2018, 200, 200-210..

3. Xu Yuan, Xianglin Yu, Kun He, Ruihan Zhang, Weilie Xiao, Jun Lin, Zhajun Zhan, Xiaohong Cheng, Zhihui Shao, and Yi Jin. Dual C (sp3)–H Functionalization of Cyclic Ethers via Singlet Oxygen-Mediated Ring Opening and Ring Closing. Organic Letters, 2021, 23, 8267-8272.

4. Ting Deng, Wenxin Yan, Xiaoyu Liu, Guizhimeng Hu, Weilie Xiao, Shuai Mao, Jun Lin, Yinchun Jiao, Yi Jin. Cu-Catalyzed Radical Addition and Oxidation Cascade: Unsymmetrical Trimerization of Indole to Access Isotriazatruxene. Organic Letters, 2022, 24, 1502-1506.

5. Kaixiu Luo, Yongqiang Zhao, Jiawei Zhang, Jia He, Rong Huang, Shengjiao Yan, Jun Lin, Yi Jin. Enantioselective epoxypyrrolidines via a tandem cycloaddition/autoxidation in air and mechanistic studies. Organic letters, 2018, 21, 423-427.

6. Peng Chen, Kaixiu Luo, Xianglin Yu, Xu Yuan, Xiaoyu Liu, Jun Lin, Yi Jin. Cu-Catalyzed Direct Amination of Cyclic Amides via C–OH Bond Activation Using DMF. Organic Letters, 2020, 22, 6547-6551.

7. Xiaoyu Liu, Kun He, Na Gao, Peiyun Jiang, Jun Lin, Yi Jin. A radical-mediated multicomponent cascade reaction for the synthesis of azide-biindole derivatives. Chemical Communications, 2021, 57, 9696-9699.

8. Kun-Ming Jiang, Jing-An Kang, Yi Jin, Jun Lin. Synthesis of substituted 4-hydroxyalkyl-quinoline derivatives by a three-component reaction using CuCl/AuCl as sequential catalysts. Organic Chemistry Frontiers, 2018, 5, 434-441.

**五、主要完成人基本情况**

|  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- |
| **序号** | **姓名** | **工作单位（完成单位）** | **职称** | **职务** |
| 1 | 金毅 | 云南大学（云南大学） | 教授 | 无 |
| 2 | 林军 | 云南大学（云南大学） | 教授 | 无 |
| 3 | 邵志会 | 云南大学（云南大学） | 教授 | 副院长 |
| 4 | 罗开秀 | 云南大学（云南大学） | 无 | 无 |
| 5 | 蒋昆明 | 云南师范大学（云南大学） | 讲师 | 无 |
| 6 | 刘晓宇 | 泰山学院（云南大学） | 讲师 | 无 |
| 7 | 袁旭 | 云南大学（云南大学） | 无 | 无 |