

关于“Lewis 碱催化的不对称合成研究”申 报四川省科学技术奖的公示

项目名称：Lewis 碱催化的不对称合成研究

提名单位（专家）意见：

我单位认真审阅了该项目提名书及附件材料，确认全部材料真实有效，相关栏目均符合四川省科学技术奖励工作办公室填写要求。

该项目是以手性 Lewis 碱作为催化剂，活化多类底物，实现了羰基化合物、MBH 加成产物等的远端活化、不对称官能团化，同上建立多样性合成的快捷方法，极大地推动了 Lewis 碱在不对称合成方面的应用。该项目的工作共计发表 SCI 论文 90 余篇，得到了国际同行的广泛认可，

提名该项目为四川省自然科学奖。

项目简介

本项目属于“化学”学科中的“有机合成化学”研究领域。

不对称催化由于其高效快捷且能够实现手性增值等优势，成为合成手性化合物最为经济有效的手段。手性有机小分子，特别是 Lewis 碱，作为应用最为广泛的手性催化剂之一，具有稳定、绿色等优势，且催化模式多样，在近二十年里发展非常迅速，用于多种手性复杂骨架的构建。但相关领域中，远端官能团化和产物多样化一直是不对称催化合成的难点和重点。针对这些关键科学问题，项目自 2006 年开始在国家多个项目的支持下，取得了如下主要科学发现：

1. 利用手性胺催化剂创造性发展了通过 HOMO 活化的远端反应策略，成功克服远端反应活性、区域选择性以及手性立体控制等多方面的挑战，高效、高立体选择性地实现多种不饱和羰基化合物远端不对称官能团化。
2. 创新性发展了 Lewis 碱催化的 MBH 衍生物的不对称多样性反应，调节反应条件可以高效得到不同区域选择性或不同非对映选择性的产物，实现了从简单原料快速构建多种不同骨架的手性产物。

本项目在国家自然科学基金杰出青年基金项目、面上项目、科技部“973”项目、国家科技重大专项的资助下，建立了数十种多官能团、多手性中心化合物的合成新方法，合成了上千个新型化合物，代表性成果发表于 *J. Am. Chem. Soc. (JACS)*、*Angew. Chem. Int. Ed (ACIE)* 等一流国际刊物，他引 865 次。

本项目研究工作原创性强，系统深入，原始创新性强，具有鲜明的学科特色，研究成果在国内外产生了重要的影响，带动和促进了手性 Lewis 碱催化化学的发展，彰显了中国在这一领域的国际领先水平。

主要完成人情况

姓名	排名	技术职称	工作单位	完成单位	对本项目主要学术贡献	曾获科技奖励情况
陈应春	1	教授	四川大学	四川大学	项目总负责人，总体学术思想的提出者，负责提出项目的总体方案、规划和主要的学术思想。是所有代表性论文和90余篇论文的通讯作者	教育部自然科学一等奖 国家自然科学基金二等奖
杜玮	2	副教授	四川大学	四川大学	科学发现二的贡献者，负责撰写项目的材料	无
贾知军	3	博后	加州理工大学	四川大学	科学发现一的贡献者，首次发现并实现了三烯胺催化机制	无
熊小峰	4	教授	中山大学	四川大学	科学发现一的贡献者，通过三烯胺机制实现了不对称DA反应	无
崔海磊	5	研究员	重庆文理学院	四川大学	科学发现二的贡献者，高化学选择性地实现了MBH加成产物与吡啶的不对称反应	无
詹固	6	博后	日本国立研究开发法人理化研究所	四川大学	科学发现二的贡献者，高立体选择性地实现了Lewis碱催化的不对称多样性合成	无

代表性论文

序号	论文专著名称/刊名/作者	影响因子	年卷页码 年(卷):页码	发表年月	通讯作者/第一作者(中文名)	SCI他引次数	他引总次数	是否国内完成
----	--------------	------	-----------------	------	----------------	---------	-------	--------

1	<p>“Highly asymmetric Michael addition of α,β-unsaturated ketones catalyzed by 9-amino-9-deoxyepiquinine”, <i>Angew. Chem., Int. Ed.</i> Jian-Wu Xie, Wei Chen, Rui Li, Mi Zeng, Wei Du, Lei Yue, Ying-Chun Chen,* Yong Wu, Jin Zhu, and Jin-Gen Deng,*</p>	12.10 2	2007, 46, 389	2006.12	陈应春、邓金根 /谢建武	222	273	是
2	<p>“Chemoselective asymmetric N-allylic alkylation of indoles with Morita-Baylis-Hillman carbonates”, <i>Angew. Chem., Int. Ed.</i> Hai-Lei Cui, Xin Feng, Jing Peng, Jie Lei, Kun Jiang, and Ying-Chun Chen,*</p>	12.10 2	2009, 48, 5737	2009.6	陈应春/崔海磊	149	176	是
3	<p>“Organocatalytic asymmetric inverse-electron-demand Diels–Alder reaction of electron-deficient dienes and crotonaldehyde”, <i>Angew. Chem., Int. Ed.</i> Jun-Long Li, Tai-Ran Kang, Si-Li Zhou, Rui Li, Li Wu, Ying-Chun Chen,*</p>	12.10 2	2010, 49, 6418.	2010.6	陈应春/李俊龙	63	66	是
4	<p>“Trienamines in asymmetric organocatalysis: Diels-Alder and cascade reactions”, <i>J. Am. Chem. Soc.</i> Zhi-Jun Jia, Hao Jiang, Jun-Long Li, Björn Gschwend, Qing-Zhu Li, Xiang Yin, Julie Grouleff, Ying-Chun Chen,* and Karl Anker Jørgensen,*</p>	14.35 7	2011, 133, 5053	2011.3	陈应春、Karl Anker Jørgensen /贾知 军	205	228	是
5	<p>“Trienamine catalysis with 2,4-dienones: development and application in asymmetric Diels–Alder reaction”, <i>Angew. Chem. Int. Ed.</i> Xiao-Feng Xiong, Quan Zhou, Jing Gu, Lin Dong, Tian-Yu Liu, Ying-Chun Chen,*</p>	12.10 2	2012, 51, 4401.	2012.2	陈应春/熊小峰	47	55	是
6	<p>“Stereodivergence in amine-catalyzed regioselective [4+2] cycloadditions of beta-substituted cyclic enones and polyconjugated malononitriles”, <i>J. Am. Chem. Soc.</i> Xin Feng, Zhi Zhou,</p>	12.10 2	2012, 134, 19942	2012.11	陈应春/冯鑫	59	65	是

	Rong Zhou, Qing-Qing Zhou, Lin Dong, and Ying-Chun Chen,*							
7	<p>“Trienamines derived from interrupted cyclic 2,5-dienones: remote δ,ϵ-C=C bond activation for asymmetric inverse-electron-demand aza-Diels–Alder reaction”, <i>Angew. Chem. Int. Ed.</i> Xin Feng, Zhi Zhou, Chao Ma, Xiang Yin, Rui Li,* Lin Dong, and Ying-Chun Chen,*</p>	12.10 2	2013 , 52, 14173.	2013.11	陈应春/冯鑫	46	50	是
8	<p>“Catalyst-controlled switch in chemo- and diastereoselectivities: Annulations of Morita–Baylis–Hillman carbonates from isatins”, <i>Angew. Chem. Int. Ed.</i>. Gu Zhan, Ming-Lin Shi, Qing He, Wei-Jia Lin, Qin Ouyang,* Wei Du, and Ying-Chun Chen,*</p>	12.10 2	2016 , 55, 2147	2016.1	陈应春/詹固	74	75	是