

项目公示信息

项目名称：铑催化芳烃不对称碳氢键官能团化

主要完成单位：陕西师范大学 中国科学院大连化学研究所

主要完成人：李兴伟、王芬、孔令恒、孙佳琼、田苗苗、米瑞杰、杨西发、申兵学、戚自松、郑光范、张学鹏

项目简介：

该项目属于有机化学领域。手性作为重要的结构性质在自然界广泛存在。手性化合物作为合成砌块、配体、功能分子在不对称催化、光电材料、生物医药等众多领域得到了广泛的应用。如何利用自然界中的简单的起始原料，在简单的反应条件下以高立体选择性甚至立体专一性合成单一立体构型的结构新颖、功能多样的手性分子是目前国内外化学家研究的关键科学问题。2018年入陕工作以来，我们围绕手性芳烃高效催化合成这一核心主题，利用不对称碳氢键活化这一策略发展了一系列传统合成化学手段难以或者不能获得的手性芳烃的合成方法，以优异的对映和化学选择性获得了400多例结构新颖的目标分子。

主要研究内容包括以下三部分：1) 轴手性的构建新方法。从简单芳烃类化合物出发，首次发展了偶联试剂动态动力学转化策略，实现了联芳基化合物的对映选择性合成。基于底物活化方法从简单原料出发发展了从头构建手性轴的新策略，以优异的对映选择性合成了低阻旋能垒的五元杂环联芳

基化合物，并首次分离出手性铈中间体，揭示了反应中手性诱导的根源。2) 中心手性构建新策略。基于二环烯烃的环张力，经碳氢键活化实现了连续两个手性中心的构建；发展了经烯丙基金属中间体实现的四取代手性中心的有效构建；经简单的条件控制，首次实现了碳氢键活化体系中的对映发散性。3) 实现了轴手性到中心手性的转移，并将轴手性与中心手性直接建立了关联。

该项目共完成两项国家自然科学基金项目，发表合成化学方面的高水平 SCI 学术论文 28 篇，其中影响因子在 10 以上的学术论文共 13 篇，包括 *J. Am. Chem. Soc.* (1 篇，影响因子: 15.419), *Angew. Chem. Int. Ed.* (10 篇，影响因子: 15.336)、*ACS Catal.* (2 篇，影响因子 xxxs)。研究工作受到学术同行的广泛关注和认可，多次被 *Chem. Rev.*、*Chem. Soc. Rev.*、*J. Am. Chem. Soc.*、*Angew. Chem. Int. Ed.*、*Synfacts* (3 次)、《有机化学》(2 次) 等正面评述及大篇幅配图引用。代表性论文先后被 SCI 收录期刊他引 341 次，单篇最高他引 87 次。申请人的个人 H-指数为 67，所有论文总他人引用 1.3 万余次。该研究的阶段性成果曾先后被“全国有机化学学术会议”、第三届“Chem-Reaxys Symposium”、“第一届催化与合成浦江论坛(中科院上海有机所金属有机国家重点实验室)”等组委会邀请在大会上做特邀报告。本项目第一完成人主持了国家杰出青年科学基金并顺利结题，曾获陕西省“千人计划”、科技

部“万人计划”领军人才、全球高被引科学家、英国皇家化学会会士(FRSC)、重庆市自然科学一等奖(排名第四)等荣誉。曾担任《催化学报》(*Chin. J. Catalysis*)副主编(2014-2019)。主要知识产权目录(8篇代表作及专利、软件著作权等):

1. “Rh(III)-Catalyzed Atroposelective Synthesis of Biaryls via C-H Activation and Intermolecular Coupling with Sterically Hindered Alkynes” Fen Wang, Zisong Qi, Yuxia Zhao, Shuailei Zhai, Guangfan Zheng, Ruijie Mi, Zhiyan Huang, Xiaolin Zhu, Xiaoming He, Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2020**, *59*, 13288-13294. (ESI highly cited) (代表性论文一)
2. “Rh(III)-Catalyzed Asymmetric Synthesis of Axially Chiral Biindolyls by Merging C-H Activation and Nucleophilic Cyclization” Miaomiao Tian, Dachang Bai, Guangfan Zheng, Junbiao Chang, and Xingwei Li* *J. Am. Chem. Soc.* **2019**, *141*, 9527-9532. (ESI highly cited, highlighted by *Synfacts*) (代表性论文二)
3. “Rhodium(III)-Catalyzed Coupling of Arenes with 7-Oxa/Azabenzonorbornadienes by C-H Activation” Zisong Qi, Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2013**, *52*, 8995-9000. (代表性论文三)
4. “Rhodium(III)-Catalyzed Enantioselective Coupling of

- Indoles and 7-Azabenzonorbornadienes via C-H Activation/Desymmetrization” Xifa Yang, Guangfan Zheng,* Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2019**, *58*, 322-326. (代表性论文四)
5. “Rhodium-Catalyzed Enantioselective Oxidative [3+2] Annulation of Arenes and Azabicyclic Olefins via Twofold C-H Activation” Ruijie Mi, Guangfan Zheng, Zisong Qi, Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2019**, *58*, 17666. (代表性论文五)
6. “Rhodium(III)-Catalyzed Asymmetric [4+1] and [5+1] Annulation of Arenes and 1,3-Enynes: Distinct Mechanism of Allyl Formation and Allyl Functionalization” Jiaqiong Sun, Weiliang Yuan, Rong Tian, Peiyuan Wang, Xue-Peng Zhang*, Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2020**, *59*, 22706-22713. (highlighted by *Synfacts*) (代表性论文六)
7. “Enantiodivergent Annulation of Sulfoximines with Diazo Compounds via Rh(III)-Catalyzed Desymmetrization C-H Activation” Bingxue Shen, Boshun Wan, and Xingwei Li*, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2018**, *57*, 15534-15538. (highlighted by *Synfacts*) (代表性论文七)
8. “Rhodium(III)-Catalyzed Asymmetric Access to Spirocycles via C-H Activation and Subsequent Axial-to-Central

Chirality Transfer” Lingheng Kong, Xi Han, Song Liu, Yun Zou, Yu Lan, Xingwei Li* *Angew. Chem. Int. Ed.* **2020**, *59*, 7188-7192. (代表性论文八)

主要论文专著目录（限 8 条）

序号	论文专著名称	刊名	第一完成单位（全称）	作者（填全），英文翻译	年卷页码（xx 年 xx 卷 xx 页）	发表时间（某年某月）	通讯作者（中文，按照文中标注的，无标注的不填）	第一作者（中文）
范例	Solvatochromic probes displaying unprecedented organic liquids discriminating characteristics	<i>Anal. Chem.</i>	陕西师范大学	Huijing Liu（刘慧景），Xiaojie Xu（徐晓洁），Zhijun Shi（石志君），Kaiqiang Liu（刘凯强），Yu Fang（房喻）	2016, 88, 10167-10175	2016 年 9 月	房喻	刘慧景
1								
2								
3								
4								
5								

6								
7								
8								

主要知识产权证明目录（限 10 条）

知识产权类别	知识产权具体名称	国家 (地区)	授权号	授权 日期	证书编号	权利人	发明人

请 11 月 13 日前报送项目公示信息及 8 篇代表作 pdf，公示后的项目信息不能再变。