

“炔烃及生物质基化合物的高效转换”申报 湖南省自然科学奖公示

一、项目名称

炔烃及生物质基化合物的高效转换

二、项目简介

项目完成人申报的项目属于有机合成研究热点领域。围绕有机合成领域亟待解决的生物质基化合物及炔烃的绿色高效转换等关键性科学问题，系统性的开展有关方面的研究，合成了一系列具有重要生理活性的化合物，在医药、农药、染料和功能材料等领域具有可观的应用前景。主要科学发现如下：

1. 基于简单、高效反应体系，开发了生物质基化合物转换技术

以空气为氧源，利用醚类化合物的过氧化物效应，简单、高效的实现了包含生物质基化合物糠醛在内的醛类化合物的高效转换，以生物质基化合物苯酚及廉价易得的硝基芳烃为原料首次成功实现了直接还原偶联过程，制备了环己基芳胺类化合物，以生物质基化合物乙醛酸酯与富电子芳胺、贫电子芳胺为原料，选择性得到 3,4-二氢喹啉类化合物。深入探讨了相关反应的机理，并进行百克级放大实验，为相关反应的研究做出重要贡献。该部分工作的完成，解决了以往方法中或需要过渡金属催化、或反应速率慢、或操作复杂等瓶颈，为合成相关化合物开辟了新的途径。主要论文被 *Green Chem.*、*J. Org. Chem.*、*Org. Lett.*、*Chem. Commun.*、*Chin. Chem. Lett.*、*Organic Chemistry Portal* 等国际国内著名期刊或网站亮点报道、引用或评述，受到国际国内同行的广泛认可和高度评价。

2. 基于“水相”反应体系，炔烃高效转换新策略

深入研究了基于“水相”反应体系的炔烃高效转换新策略。通过以水活化的丙炔酸酯与苯亚磺酸钠反应，并采用微加热使反应时间缩短至 20 min；通过阳离子金催化剂室温使卤代炔烃发生水合反应，高收率、高区域选择性获得 α -卤代甲基酮；通过金催化剂使炔基磷酸酯水合反应生成 β -羰基磷酸酯，并后续研究开发了

醋酸银催化剂替代金催化剂合成 β -羰基膦酸酯，降低了反应成本。研究工作在 Z - β -磺酰基烯酸酯骨架构建及炔烃水合反应方面具有重要的意义和广泛的应用前景。主要论文被 *Green Chem.*、*Org. Lett.*、*Chem. Commun.*、*Chin. Chem. Lett.*、*有机化学*等国际国内知名期刊引用或评述，受到国际国内同行的广泛认可和高度评价。