

2022 年度江西省科学技术奖提名项目公示

项目名称：基于炔键的新反应及在核苷合成中的应用

候选单位：江西科技师范大学

候选人：肖强，宋贤荣，丁海新，阳如春

项目简介（不超 800 字）：

本项目是属于化学领域，同时涉及生物、药学等交叉学科领域。主要围绕具有生物活性的核苷天然产物及其类似物的全合成、炔烃衍生物的新反应探索及其在核苷合成中的应用这一关键科学问题。以合成具有生物活性核苷化合物为研究目标，发展高效新颖的合成策略实现对此类化合物的合成；以炔烃衍生物的新反应为技术手段，构建传统方法难以合成的官能团碳环或杂环体系，并将发展的方法进一步应用于核苷体系，以此构建核苷化合物库，为发现新的药物先导化合物奠定基础。取得的主要创新性成果如下：

（1）系统研究 7-去氮嘌呤核苷和异核苷修饰基团对 C-N 糖苷键构建的影响，完成了一系列具有生物活性的核苷天然产物及其类似物的合成，构建了 200 多个结构多样性核苷分子化合物库。解决了流动合成仪在核苷合成中的关键技术问题，有效地解决了合成重复性和放大性问题，这些对核苷药物的构效关系研究及发展新型生物活性分子提供物质基础，具有重要的实际应用价值。

（2）系统研究炔丙醇类的炔键新反应，通过亲核试剂的精准调控，高效完成炔烃的转化，选择性构建了一系列传统方法难以合成的不同官能团化（如卤代、磷酸化、砷化、硫氰酸化等）苯并二氢吡喃、二氢喹啉、黄酮、喹啉及吲哚衍生物等，为含此类骨架的天然产物或药物活性分子提供高效的合成策略，并拓展了炔丙醇合成子在有机合成中应用，对炔烃化学的发展具有重要的意义。

（3）将炔烃及其衍生物的新反应研究应用于核苷体系中，高效完成了具有生物活性的氯法拉滨、奈拉滨和氟达拉滨等核苷类药物，拓展了炔烃化学在核苷体系中的应用；系统探索了炔键转化在核苷体系的底物适用性和化学选择性，完善了核苷化合物库构建的新策略，以此验证了炔烃及其衍生物转化对核苷类似物合成的重要性。

本项目在化学类国际著名期刊 *Adv. Synth. Catal*, *Org. Chem. Front.*, 等共发表论文 40 篇, 其中 SCI-E 收录 37 篇, 申请专利 8 项 (已授权 3 项); 成果被化学类国际重要刊物作为领域的重要进展引入论文中。

主要完成人情况

排名	姓名	职务	职称	工作单位	对本项目贡献
1	肖强	所长	教授	江西科技师范大学	负责本项目工作的文献调研、研究经费申请、立项及具体实验的方案设计与实施。对本项目的各项成果均有主要贡献, 是 5 篇代表性论文的通讯作者。
2	宋贤荣	无	副教授	江西科技师范大学	对炔丙醇类炔烃新反应的做出了创造性贡献, 参与完成了代表性工作 3、4、5 的研究内容方案设计与实施。
3	丁海新	无	副教授	江西科技师范大学	对炔烃新反应在核苷体系中的应用做出了创造性贡献, 参与完代表性工作 1, 2, 3、4、5 的研究内容方案设计与实施。
4	阳如春	无	副教授	江西科技师范大学	对炔烃新反应在核苷体系中的应用做出了创造性贡献, 参与完成了代表性论文 1、2 的部分实验研究内容方案设计与实施。

代表性论文专著目录

序号	论文 (专著) 名称/刊名	作者 (按发表顺序)	年卷页码 (××年××卷××页)	发表时间 (年月日)	第一署名单位是否江西省内单位
1	Concise total synthesis of two marine natural nucleosides:	Ding, Haixin; Li, Wei; Ruan, Zhizhong; Yang, Ruchun; Mao,	2014 年 10 卷 1681-1685 页	2014 年 7 月 24 日	是

	trachycladines A and B/Beilstein Journal of Organic Chemistry	Zhijie; Xiao, Qiang; Wu, Jun			
2	First Total Synthesis of a Naturally Occurring Iodinated 5'-Deoxyxylofuranosyl Marine Nucleoside/ <i>Marine Drugs</i>	Sun, Jianyun ; Dou, Yanhui ; Ding, Haixin ; Yang, Ruchun ; Sun, Qi ; Xiao, Qiang	2012 年 10 卷 881-889 页	2012 年 4 月 10 日	是
3	Copper-Catalyzed Cascade Cyclization of 2-Propynolphenols: Access to 4-Phosphorylated 2H-Chromenes/Advanced Synthesis & Catalysis	Li, Ren; Chen, Xi; Song, Xian-Rong; Ding, Haixin; Wang, Pengyang; Xiao, Qiang; Liang, Yong-Min	2017 年 359 卷 3962-3967 页	2017 年 11 月 23 日	是
4	TFA-promoted sulfonation/cascade cyclization of 2-propynolphenols with sodium sulfinates to 4-sulfonyl 2H-chromenes under metal-free conditions /Organic Chemistry Frontiers	Yang, Tao; Kou, Peihao; Jin, Fengyan; Song, Xian-Rong; Bai, Jiang; Ding, Haixin; Xiao, Qiang; Liang, Yong-Min	2019 年 6 卷 3162-3166 页	2019 年 7 月 19 日	是
5	An efficient approach to 4-chloro quinolines via TMSCl-mediated cascade cyclization of ortho-propynol phenyl azides /Organic Chemistry Frontiers	Song, Xian-Rong; Li, Ren; Ding, Haixin; Chen, Xi; Yang, Tao; Bai, Jiang; Xiao, Qiang; Liang, Yong-Min	2018 年 5 卷 1537-1541 页	2018 年 3 月 21 日	是