

陕西省自然科学奖公示信息

(2025年度)

一、项目基本情况

项目名称	结构复杂多环天然产物全合成
主要完成人	赵玉明，高子伟，邵辉，乔金宝
主要完成单位	陕西师范大学

二、提名意见（适用于提名单位）

提 名 者	陕西省教育厅
提名意见（不超过 600 字）： <p>该研究在国家自然科学基金“优青”项目和面上项目的连续资助下，针对结构复杂多环天然产物高效合成这一关键科学问题，创造性提出了“环系构建导向”和“仿生合成驱动”协同促进的复杂分子高效合成理念。针对系列具有良好生物学活性和潜在成药价值的结构复杂多环天然产物开展化学全合成研究，实现了四个不同家族二十余个结构复杂天然产物及其结构衍生物的高效化学合成，其中多数为首次合成。所包含的科学发现点具有高度学术原创性，不仅促进了天然产物合成化学的发展，也为相关天然产物生源合成途径提供了新的思路。</p> <p>五篇代表性论文均发表在有机合成化学领域著名期刊 <i>J. Am. Chem. Soc.</i>、<i>Angew. Chem. Int. Ed.</i>、<i>Org. Lett.</i> 和 <i>Chem. Commun.</i> 上，研究工作得到国内外同行专家的高度评价，产生了广泛的学术影响。研究成果获 2025 年度陕西高等学校科学技术研究优秀成果奖一等奖，培养博士后 2 名、博士研究生 9 名和硕士研究生 20 余名（含在读）。第一完成人曾入选第九批陕西省人才计划、获得国家自然科学基金“优青”项目资助、获得 ACP Lectureship Award 和 Thieme Chemistry Journals Award 等国际学术奖项。</p> <p>经审核，该项目成果材料齐全、规范。经公示，无知识产权纠纷，人员排序无争议，符合 2025 年度陕西省科学技术奖自然科学奖提名条件。</p> <p>提名该项目为陕西省自然科学奖二等奖。</p>	
说明：省科学技术奖一、二等奖项目，实行按等级标准提名、独立评审表决的机制。提名单者应严格依据省科学技术奖的标准条件，说明提名项目的贡献程度及等级建议。“提名一等奖”评审落选项目不再降格参评二等奖。项目组与提名单位沟通后，做出提名等级意见；提名项目提交后，提名等级建议不得变更。	

三、项目简介

在国家自然科学基金(21672134、21971157、22022106)的连续资助下,题为《结构复杂多环天然产物全合成》的项目立足复杂天然产物高效合成这一关键科学问题,创造性提出了“环系构建导向”和“仿生合成驱动”协同促进的复杂分子高效合成理念。针对系列具有良好生物学活性和潜在药用价值的结构复杂多环天然产物开展化学全合成研究,先后实现了四个不同家族二十余个结构复杂天然产物及其结构衍生物的高效化学合成,其中多数为首次合成。相关研究工作具有高度的学术原创性,不仅填补了多个家族天然产物化学合成的空白,同时也为相关分子的构-效关系评价及生物活性研究提供了重要物质基础。主要创新点在于:

(1) 提出了以“环系构建导向”为指导思想的结构复杂多环天然产物合成理念。以此为指导,本项目对三尖杉二萜天然产物和石蒜科生物碱开展了系统的化学合成研究,通过对两类目标分子的核心环系骨架分析,创新性的首次设计并发展了钯催化 Heck/插羰/串联环化反应,并对该串联反应的底物范围和反应机理进行了广泛的拓展和深入研究。在此基础上,以该串联反应为关键步骤,仅用一步反应实现了两类目标天然产物中核心多环骨架的高效构建,后期通过简单的官能团转化及氧化态调整,最终实现了三尖杉二萜 Cephanolide B 和 C 的首次全合成以及石蒜科生物碱 Galanthamine 和 Lycoramine 的高效合成。该研究工作不仅填补了此类三尖杉二萜在合成化学领域的空白,同时也引领了三尖杉二萜天然产物的研究浪潮。

(2) 基于“仿生合成驱动”的理念,提出了通过学习自然、模仿自然的方式进行结构复杂多环天然产物化学合成的研究思路。在该思路指引下,本项目以灵芝属酚醌型杂萜和资源稀缺型亚氨基吡咯醌类生物碱为主要研究内容,结合两类天然产物可能的生源合成途径,在借鉴生源合成途径的基础上通过创造性化学合成理性设计,发展了一条简洁新颖的通用合成路线,通过该合成路线不仅实现了灵芝属酚醌型杂萜家族六个复杂天然产物的首次发散式全合成以及亚氨基吡咯醌类生物碱核心多环骨架的高效构建,同时也为这两类天然产物可能的生源合成途径提供了全新的化学见解。

天然产物合成,特别是结构复杂天然产物全合成,涉及有机分子化学键的定向连接与断裂,是分子水平上科学与艺术的凝练与融合,富有创造性与挑战性。第一完成人的团队紧密围绕领域内关键科学问题,通过合成策略和方法的创新,实现了一系列具有良好生物活性和潜在药用价值的结构复杂多环天然产物化学合成,其中多数为首次合成。该项目的五篇代表性论文均发表在国际著名综合类期刊 *J. Am. Chem. Soc.* (1 篇)、*Angew. Chem. Int. Ed.* (1 篇)和 *Chem. Commun.* (1 篇)及有机化学领域主流期刊 *Org. Lett.* (2 篇)上,第一完成人受邀在国际权威出版社 Elsevier

出版的系列丛书《*Strategies and Tactics in Organic Synthesis*》上撰写专题。本项目所取得的成果得到了相关领域国内外专家的广泛认可与好评，先后被本领域知名专家如美国化学会核心期刊 *J. Am. Chem. Soc.* 主编 Erick M. Carreira 教授、中科院上海药物所岳建民院士、复旦大学陈芬儿院士、美国艾莫利大学代明骥教授、英国牛津大学 Anderson 教授、西北大学胡向东教授以及中国科学院昆明植物研究所邱明华研究员等在 *Synfacts*, *Natural Product Reports*, *Chemical Society Reviews*, *Angewandte Chemie International Edition* 等国际知名期刊及化学评论期刊上进行亮点评述。研究成果获 2025 年度陕西高等学校科学技术研究优秀成果奖一等奖，培养博士后 2 名，博士生 9 名和硕士生 20 余名。第一完成人曾入选第九批陕西省人才计划、获得国家自然科学基金“优青”项目资助、获得 ACP Lectureship Award 和 Thieme Chemistry Journals Award 等国际学术奖项。

四、客观评价

【限 2 页。围绕科学发现点的原创性、公认度和科学价值进行客观、真实、准确评价。填写的评价内容要有客观依据，主要包括国内外同行在重要学术刊物（专著）和重要国际学术会议等公开发表的学术性评价意见，国内外重要科技奖励等，可在附件中提供证明材料。非公开资料（如私人信函等）不能作为评价依据。】

学术刊物引用评价

本项目代表性论文的客观评价如下：

1、美国化学会核心期刊 *JACS* 主编、苏黎世联邦理工学院 Erick M. Carreira 教授在国际著名化学评论期刊 *SYNFACTS* 杂志上对该工作进行了亮点评述(*Synfacts* 2018, 14, 0666)：赵课题组展示了其利用钯催化串联环化反应构建 Cephanolide B 和 C 核心 6-5-6 顺式稠和三环体系，进而实现上述天然产物全合成的工作。该合成工作的亮点在于其所发展的包含分子内 Heck 反应、羰基化及后续环化过程中可能经历的 Friedel-Crafts 酰基化和还原消除等步骤的串联反应，通过该串联反应可以快速实现高级中间体 K 的构建，后期经化学选择性转化可以高效实现 Cephanolide B 和 C 的全合成。(代表性论文 1)

2、上海药物所岳建民院士在其综述 (*Nat. Prod. Rep.* 2024, 41, 1152) 中对该工作进行了评述：赵课题完成了 Cephanolide B 和 C 的首次全合成，代表着针对含苯环类 Cephalotane 型降碳二萜的首次合成报道。显而易见的是，其所发展的钯催化 Heck 型插羰/C-H 活化串联环化反应对于上述天然产物中多环体系的构建是十分高效的。(代表性论文 1)

3、美国艾莫利大学代明骥教授在其综述 (*Nat. Prod. Rep.* 2019, 36, 174) 中对该工作进行了评述：赵课题组发展了一种高效的钯催化插羰串联环化反应，利用该串联反应可以快速构建三尖杉二萜 Cephanolides 核心的 6-5-6 三环骨架，在此基础上最终实现该家族天然产物 Cephanolide B 和 C 的首次全合成。(代表性论文 1)

4、英国牛津大学 Anderson 教授在其综述 (*Chem. Soc. Rev.* 2021, 50, 58) 中对该工作进行了评述：赵课题组发展了一种新颖的基于钯催化串联环化反应的合成方法学，并利用该方法完成了三尖杉二萜 Cephanolide B 和 C 的首次全合成。(代表性论文 1)

5、西北大学胡向东教授在其研究性论文 (*Angew. Chem. Int. Ed.* 2021, 60, 18572) 中对该工作进行了评述：基于其所发展的钯催化串联环化反应，赵课题组设计并发展了一条用于构建三尖杉二萜核心骨架的简洁且高效的合成路线，在此基础上完成了该家族天然产物 Cephanolide B 和 C 的首次全合成。(代表性论文 1)

6、美国化学会核心期刊 *JACS* 主编、苏黎世联邦理工学院 Erick M. Carreira 教授

在国际著名的化学评论期刊 *SYNFACTS* 杂志上对该工作进行了亮点评述 (*Synfacts* 2020, 16, 0618): 赵课题组发展了一条发散性的仿生合成路线用于合成六个灵芝属酚醌型二萜, 其中包括具有潜在抗乙酰胆碱酯酶活性的(±)-Ganocin A。这代表了关于这类含有四个立体中心的五环结构的首次全合成。(代表性论文 2)

7、中国科学院昆明植物研究所邱明华研究员在其综述 (*Nat. Prod. Rep.* 2023, 40, 1354) 中对该工作进行了评述: 根据可能的生物合成路径, 赵课题组设计并发展了一条以分子内 *hetero*-Diels-Alder 环加成反应和 Stahl 型氧化芳构化为关键步骤的仿生合成策略, 利用该策略高效的实现了共同三环中间体的构建, 后期通过高选择性的转化完成了一系列天然产物的合成。(代表性论文 4)

8、美国化学会核心期刊 *JACS* 主编、苏黎世联邦理工学院 Erick M. Carreira 教授在国际著名的化学评论期刊 *SYNFACTS* 杂志上对该工作进行了亮点评述 (*Synfacts* 2022, 18, 0236): 赵课题组提出了一种关于(±)-Galanthamine 和(±)-Lycoramine 的高效合成方法, 其中, (-)-Galanthamine 是一种乙酰胆碱酯酶抑制剂, 其氢溴酸盐已经作为药物用于治疗阿兹海默症。(代表性论文 4)

9、复旦大学陈芬儿院士在其综述 (*Nat. Prod. Rep.* 2024, 41, 1060) 中对该工作进行了评述: 2021 年, 赵课题组高效的完成了 Galantamine 和 Lycoramine 的全合成, 其特色在于所采用的两段法合成路线, 第一阶段为利用钼催化插羰串联环化反应及后续 DDQ 参与的区域选择性的分子内氧化内酰胺化构建四环骨架, 第二阶段为 $\text{BF}_3 \cdot \text{Et}_2\text{O}$ 促进的分子骨架重整。(代表性论文 4)

综合评价和公认度

1、第一完成人赵玉明受《中国科学: 化学》编辑部邀请在《中国科学: 化学》杂志上撰写综述, 总结其在钼催化串联反应及在复杂天然产物全合成中应用的研究进展 (*中国科学: 化学* 2024, 54(10):1619)。

2、国内外同行对本项目第一完成人的学术水平给与高度评价和充分肯定。赵玉明教授 2017 年入选第九批陕西省人才计划、2019 年荣获 ACP Lectureship Award (Singapore)、2020 年获得国家自然科学基金“优青”项目支持、2021 年获得 Thieme Chemistry Journals Award、2022 年荣获 ACP Lectureship Award (Hong Kong)、2022 年荣获 ACP Lectureship Award (Thailand)、2025 年获陕西高等学校科学技术研究优秀成果一等奖 (排名第一)。

五、代表性论文专著目录

(不超过 8 条。其中代表性论文不超过 5 篇, 代表性专著不超过 3 部, 应公开发表 2 年以上, 即 2023 年 8 月 1 日前)

序号	论文专著名称	刊名	作者	年卷页 码 (xx 年 xx 卷 xx 页)	发表 时间 (年 月 日)	通讯作 者 (含 共同)	第一作者 (含共 同)	国内作 者	他 引 总 次 数	检索 数据 库	知识 产权 是否 归国 内所 有
1	Total Synthesis of (±)- Cephanolides B and C via a Palladium-Catalyzed Cascade Cyclization and Late-Stage sp ³ C - H Bond Oxidation	Journal of the American Chemical Society	Lun Xu, Chao Wang, Ziwei Gao, Yu-Ming Zhao	2018 年 140 卷 5653 页	2018 年 04 月 09 日	Yu- Ming Zhao	Lun Xu, Chao Wang	徐伦, 王超, 高子 伟, 赵 玉明	74	WOS 核心 合集	是
2	Divergent Biomimetic Total Syntheses of Ganocins A-C, Ganocochlearins C-D and Cochlearol T	Angewandte Chemie International Edition	Hui Shao, Xiaonan Gao, Zhong-Tian Wang, Ziwei Gao, Yu-Ming Zhao	2020 年 59 卷 7419 页	2020 年 05 月 04 日	Yu- Ming Zhao	Hui Shao, Xiaonan Gao	邵辉, 高晓 楠, 王 中天, 高子 伟, 赵 玉明	25	WOS 核心 合集	是
3	Palladium-Catalyzed Cascade Carbonylative Annulation between Alkene-tethered Aryl Iodides and Carbon Monoxide	Chemical Communications	Yong Zhang, Ya-Kui Sun, Ya-Ping Chang, Hui Shao, Yu-	2021 年 57 卷 7023 页	2021 年 06 月 15 日	Yu- Ming Zhao	Yong Zhang, Ya-Kui Sun	张永, 孙亚 奎, 常 亚萍,	4	WOS 核心 合集	是

			Ming Zhao					邵辉, 赵玉明			
4	Total Syntheses of Galanthamine and Lycoramine via a Palladium-Catalyzed Cascade Cyclization and Late-Stage Reorganization of the Cyclized Skeleton	Organic Letters	Ya-Ping Chang, Xia Ma, Hui Shao, Yu-Ming Zhao	2021 年 23 卷 9659 页	2021 年 12 月 07 日	Yu- Ming Zhao	Ya-Ping Chang, Xia Ma	常亚 萍, 马 霞, 邵 辉, 赵 玉明	8	WOS 核心 合集	是
5	Construction of the Tetracyclic Framework of Sulfur-Containing Discorhabdin-Type Alkaloids	Organic Letters	Qin Zhou, Yong-Shuai Tao, Jin-Bao Qiao, Yu-Ming Zhao	2023 年 25 卷 4066 页	2023 年 05 月 30 日	Yu- Ming Zhao	Qin Zhou	周琴, 陶泳 帅, 乔 金宝, 赵玉明	1	WOS 核心 合集	是
合 计									112		
补充说明（视情填写）：无											

六、主要完成人情况表

姓 名	赵玉明	排 名	1
行政职务	党支部书记	技术职称	教授
工作单位	陕西师范大学	完成单位	陕西师范大学
<p>对本项目主要学术贡献：</p> <p>项目主持人，全面负责项目的设计、实施、管理、总结与汇报，对本项目的所有重要科学发现做出了创造性贡献，是全部代表性论文的唯一通讯作者。</p>			

姓 名	高子伟	排 名	2
行政职务	党委书记	技术职称	教授
工作单位	延安大学	完成单位	陕西师范大学
<p>对本项目主要学术贡献：</p> <p>主要负责钯催化 Heck/羰化串联环化反应中催化剂的设计、配位优选、催化活性调控方面的研究，对本项目两个重要科学发现都做出了实质性贡献，对应代表性论文 1 和 2。</p>			

姓 名	邵辉	排 名	3
行政职务	无	技术职称	讲师
工作单位	陕西师范大学	完成单位	陕西师范大学
<p>对本项目主要学术贡献：</p> <p>主要负责灵芝属酚醌型杂萜的仿生全合成研究及天然产物结构导向的合成方法学发展及应用研究，对本项目中两个重要科学发现都做出了重要贡献，对应代表性论文 2、3、4。</p>			

姓 名	乔金宝	排 名	4
行政职务	无	技术职称	副研究员
工作单位	陕西师范大学	完成单位	陕西师范大学
<p>对本项目主要学术贡献：</p> <p>主要负责亚氨基吡咯醌类多环生物碱的合成研究，对本项目第二个重要科学发现做出了重要贡献，是代表性论文 5 的主要作者之一。</p>			

七、主要完成单位情况表

单位名称	陕西师范大学
<p>对本项目主要学术贡献：</p> <p>作为本项目依托单位，陕西师范大学为项目的顺利完成并取得优异成绩做出了重要贡献，主要表现为：（1）组织并完成了项目策划和实施工作；（2）为项目的顺利实施提供了人力资源与优质的工作环境与场所；（3）提供了本项目所需的设备、能源、图书资料和数据库等资源。</p>	

八、完成人合作关系说明

项目名称：结构复杂多环天然产物全合成

完成人：赵玉明、高子伟、邵辉、乔金宝

本人赵玉明（第一完成人）于 2015 年 1 月 14 日入职陕西师范大学化学化工学院，同年 3 月加入本项目第二完成人高子伟教授领衔的“有机金属与电响应材料研究团队”，于 2015 年 5 月完成实验室改造与装修后，着手开始结构复杂多环天然产物全合成的研究工作，随着研究工作的深入，于 2016 年 9 月与本项目第二完成人高子伟教授建立了合作研究关系，先后开展了钯催化串联环化反应及其在多环天然产物合成中的应用、以及基于仿生策略的多环天然产物合成研究，在此过程中，第二完成人高子伟教授对钯催化剂的设计、配体优选、催化活性调控等方面做出了创造性贡献，除此之外，第二完成人还对本项目基于仿生策略的研究工作提供了宝贵建议。因 2020 年第二完成人工作单位发生变动，因此与第二完成人高子伟教授在项目上的合作截止于 2020 年 6 月底。第三完成人邵辉博士于 2019 年 7 月以博士后身份加入我的课题组，从而开启了与他的合作研究并延续至今，在本项目中，邵辉博士主要负责灵芝属酚醌型杂萜的仿生全合成研究及天然产物结构导向的合成方法学发展及应用研究，对本项目的两个创新性科学发现都做出了重要贡献。第四完成人乔金宝博士于 2021 年 4 月以博士后身份加入了我的课题组，从而开启了与他的合作研究并延续至今，在本项目中，乔金宝博士主要负责亚氨基吡咯醌类多环生物碱的合成研究，对本项目第二个重要科学发现做出了重要贡献。

总之，在本项目研究过程中，完成人之间开展了深度、实质性的合作研究，赵玉明与高子伟合作完成代表性论文 1，赵玉明与高子伟、邵辉合作完成代表性论文 2，赵玉明与邵辉合作完成代表性论文 3 和 4，赵玉明与乔金宝合作完成代表性论文 5。

完成人合作关系情况汇总表

序号	合作方式	合作者/项目排名	合作时间	合作成果	证明材料
1	论文合著	赵玉明 1; 高子伟 2;	2018 年	Total Synthesis of (±)-Cephanolides B and C via a Palladium-Catalyzed Cascade Cyclization and Late-Stage sp^3 C–H Bond Oxidation	代表性论文 1
2	论文合著	赵玉明 1; 高子伟 2; 邵辉 3;	2020 年	Divergent Biomimetic Total Syntheses of Ganocins A-C, Ganocochlearins C-D and Cochlearol T	代表性论文 2
3	论文合著	赵玉明 1; 邵辉 3;	2021 年	Palladium-Catalyzed Cascade Carbonylative Annulation between Alkene-tethered Aryl Iodides and Carbon Monoxide	代表性论文 3
4	论文合著	赵玉明 1; 邵辉 3;	2021 年	Total Syntheses of Galanthamine and Lycoramine via a Palladium-Catalyzed Cascade Cyclization and Late-Stage	代表性论文 4

				Reorganization of the Cyclized Skeleton	
5	论 文 合 著	赵玉明 1; 乔金宝 4;	2023 年	Construction of the Tetracyclic Framework of Sulfur-Containing Discorhabdin- Type Alkaloids	代表性论文 5