

陆良秋 华中师范大学 教授

一、学术简历：

2001 年 9 月-2005 年 6 月：华中师范大学，化学学院，本科，应用化学专业

2005 年 9 月-2011 年 6 月：华中师范大学，化学学院，博士，有机化学专业

(全国百篇优秀博士学位论文；导师：肖文精 教授)

2011 年 10 月-2013 年 5 月：德国莱布尼茨催化研究所，博士后

(德国洪堡奖学金；导师：Matthias Beller 教授)

2011 年 7 月-2015 年 6 月：华中师范大学，化学学院，讲师

2015 年 7 月-现在：华中师范大学，化学学院，教授（破格晋升）

二、近五年的主要工作成就简述：

杂环化合物是有机化学中结构最多、数量最庞大的一类化合物，约占已知 8000 多万种有机化合物的三分之一。它们不仅是众多天然活性分子的核心骨架，还广泛应用于医药、农药、功能材料及精细化学品的合成。因此，发展杂环化合物的高效合成方法，不仅是有机化学研究的核心内容，更是推动催化合成领域发展的重要驱动力。

以偶极环化反应为代表的杂环合成方法得到了广泛的应用，但是这类反应——尤其是 1,3-偶极环加成，由于固有的周环反应模式限制，往往难以满足结构多样的杂环骨架高效高选择构建。针对杂环合成中环系大小与立体选择性调控这一关键科学问题，申请人系统地发展了金属催化的不对称偶极环化反应，突破了传统 1,3-偶极环加成的环系限制，建立了 5-11 元手性杂环和 14/15/20 元手性大环内酯骨架的高效构筑方法。

近五年来，申请人提出了偶极环化-扩环、高阶偶极环化以及张力环开环-再环化三种策略，发展了一系列不对称偶极环化新反应与新催化体系，为若干挑战性手性中环杂环分子的高效精准合成提供了系统解决方案（见图 1）。同时，通过生物测试实验，证明部分杂环分子在抗肿瘤和肿瘤细胞选择性成像方面具有重要的应用前景。

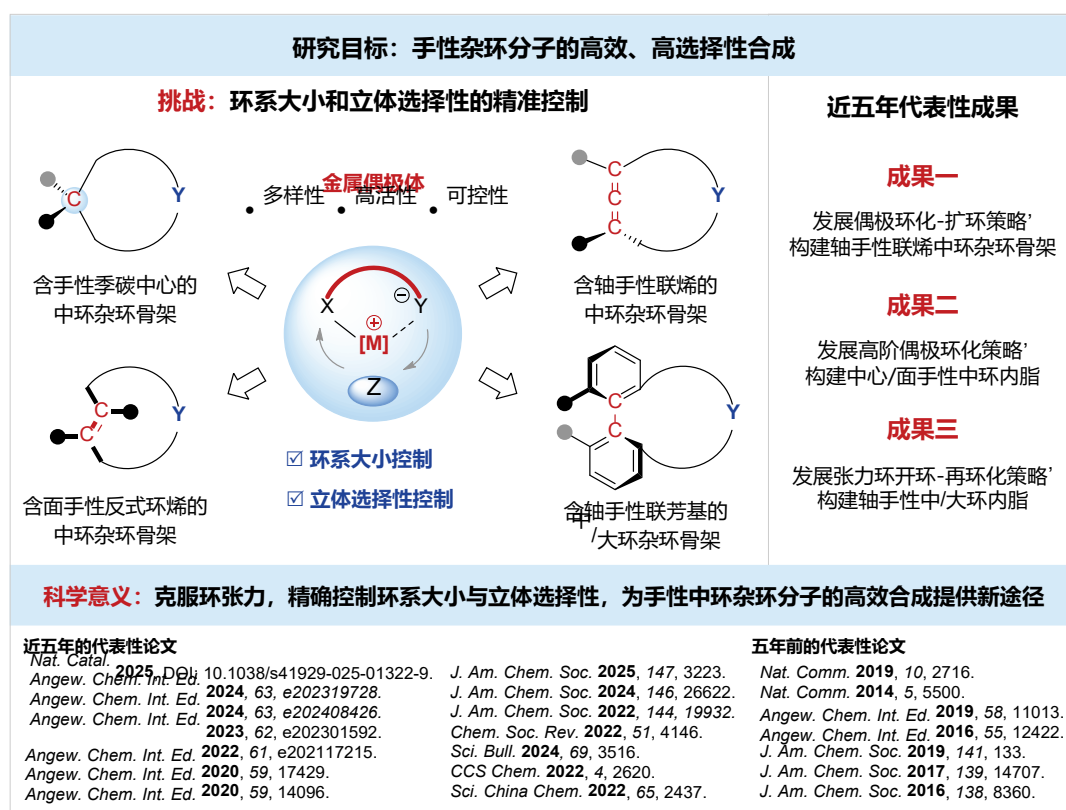


图 1. 代表性研究成果

成果一：发展偶极环化-扩环策略，高效构建了轴手性的环内联烯杂环骨架

手性联烯化合物由于其独特的结构在合成化学、药物化学和材料科学等领域应用非常广泛，发展高效高选择性的合成方法构建新型手性联烯化合物一直是合成化学研究的热点之一。尽管线性联烯的不对称合成已经取得了许多进展，但由于不利的环张力和复杂的立体化学，手性环内联烯的合成依然是一个巨大挑战。针对这一挑战，申请人提出了一种新的偶极环化-扩环策略。具体而言，首先利用高活性的钯偶极体构建非稳态的张力环中间体，随后通过扩环反应实现 9-11 元含环内联烯的轴手性中环杂环分子的高效高选择性合成（图 2）。与常见的分子内环化途径相比，该方法不仅显著提高了这类手性杂环分子的合成效率与选择性，还进一步丰富了杂环结构的多样性。

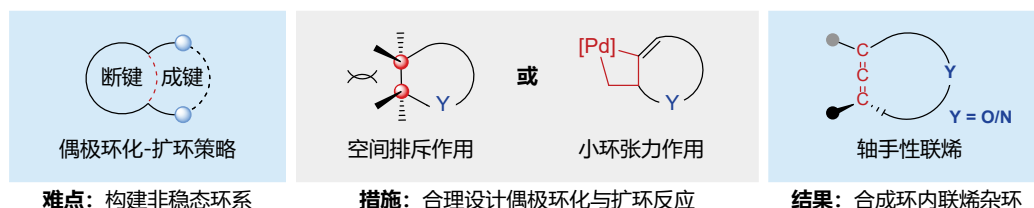


图 2. 偶极—环化扩环策略

成果二：发展高阶偶极环化策略，直接构建中心/面手性的中环内酯骨架

中环内酯是一类重要的中环含氧杂环化合物，广泛存在于天然产物和热销药物中，同时也经常用于功能材料的制备。这类化合物的高效高选择性合成一直是合成化学家高度关注的研究课题。传统合成方法大多采用：1) 分子内酯化反应，2) 分子内关环复分解反应，以及 3) 金属催化的分子内偶联反应等。上述反应的发展为中环内酯的合成提供了重要的途径，但其面临的挑战是底物范围有待拓展，在手性中环尤其是含季碳中心的中环构建方面需要发展更加有效的方法。针对上述问题，申请人提出了一种新的高阶偶极环化策略。以钯偶极体为反应核心，通过精准调控其阴阳离子的反应位点，发展了不对称的分子间 $(n+2)$ 高阶偶极环化反应，合成了一系列含手性季碳中心的 7-10 元中环内酯分子。该研究有意义地提高了这类分子的结构多样性和立体选择性，为中环杂环骨架的构筑提供了另外一条高效高选择性的途径。

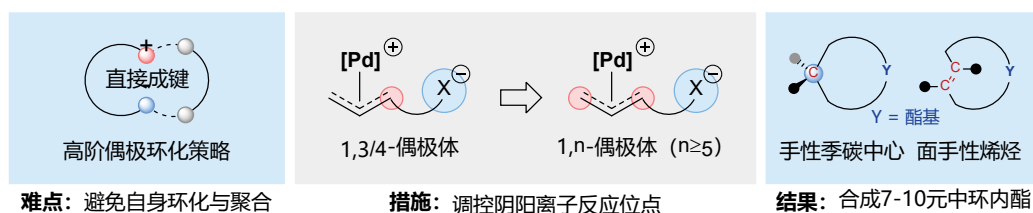


图 3. 高阶偶极环化策略

这些研究对不对称催化研究领域及杂环合成化学的发展起到了积极的推动作用。相关成果在国内外学术界引起了广泛关注并被高度认可，多次被国家自然科学基金委员会网站、《科学网》、Organic Chemistry Portal、Chem-Station 等国内外知名学术平台转载报道，并受到 Synfacts、Synlett、《有机化学》等期刊的专题评述以及国内外同行的引用。同时，申请人在金属催化偶极环化领域的研究成果被国内外同行广泛应用。其中，蓝光诱导 Wolff 重排反应产生烯酮中间体的方法以及乙炔基碳酸酯新试剂被国内外 30 多个课题组使用，乙炔基碳酸酯试剂、手性磷硫配体和可见光反应设备已实现商品化(图 4)。

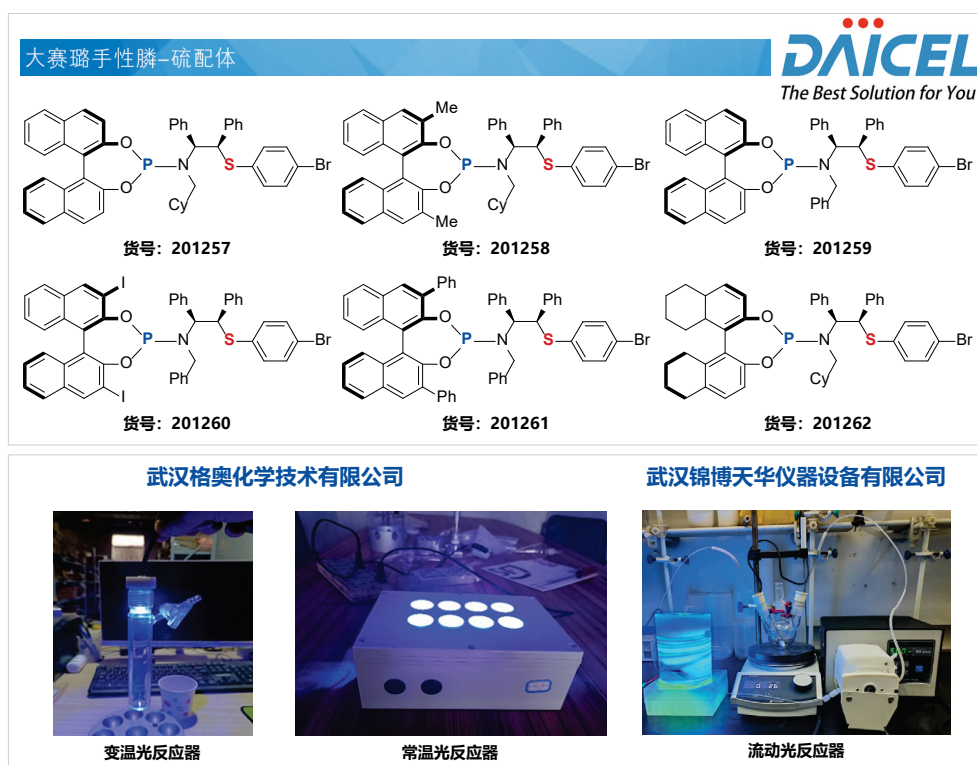


图 4. 手性磷硫配体与可见光反应装置的商品化情况

近五年来, 申请人以通讯作者身份发表论文 47 篇, 包括 2 篇 *Nat. Catal.*、4 篇 *J. Am. Chem. Soc.*和 9 篇 *Angew. Chem. Int. Ed.*; 获授权专利 6 项; 荣获亚洲核心计划讲座奖、全球高被引科学家、OCF 新锐科学家等奖励和荣誉; 现任 *Science Bulletin* 和 *Chinese Chemical Letters* 期刊编委、*Chiral Chemistry* 顾问编辑以及中国感光学会青年理事和光催化专业委员会委员等。受邀在第 22 届全国金属有机化学学术讨论会、International Symposium on Catalysis and Fine Chemicals (C&FC2023, 日本东京)、the 12th Singapore International Chemistry Conference (SICC-12, 新加坡) 等国内外学术会议做邀请报告和主题报告 20 余次。参与组织第三届全国有机自由基化学会议、2023/2024 国际光化学技术与产业大会、第三届光催化国际百位学者论坛等国内外学术会议 5 次。

三、十篇代表性文章或专利目录:

- [1] Qu, B.-L.; Xiao, M.; He, L.; Shi, J.-W.; Zhang, Z.;* Xiao, W.-J.; **Lu, L.-Q.*** Enantioselective macrocyclization via catalytic metallic dipole relay. *Nat. Catal.* **2025**, DOI: 10.1038/s41929-025-01322-9.

- [2] Zhou, Z.-X.; Fu, Y.-L.-T.; Zhang, C.; Li, Y.-H.; Zhang, B.-J.; Xiao, Y.-Q.; Li, Y.-J.; Chen, L.-Y.; Rao, L.;* Tan, Y.;* Xiao, W.-J.; **Lu, L.-Q.*** Modular Synthesis of Planar-Chiral Cyclononenes via trans-Retentive Trapping of π -Allyl-Pd Dipoles. *J. Am. Chem. Soc.* **2025**, *147*, 3223.
- [3] Wang, B.-C.; Hu, F.; Bai, J.; Xiong, F.-Y.; Chen, P.; Li, J.; Tan, Y.; Guo, Y.-L.;* Xiao, W.-J.; **Lu, L.-Q.*** Synthesis of S(IV)-Stereogenic Chiral Thio-Oxazolidinones via Palladium-Catalyzed Asymmetric [3+2] Annulations. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2024**, e202319728.
- [4] Shi, B.; Xiao, M.; Zhao, J.-P.; Zhang, Z.;* Xiao, W.-J.; **Lu, L.-Q.*** Synthesis of Chiral Endocyclic Allenes and Alkynes via Pd-Catalyzed Asymmetric Higher-Order Dipolar Cycloaddition. *J. Am. Chem. Soc.* **2024**, *146*, 26622-26629.
- [5] Xiao, Y.-Q.; Fang, K.-X.; Zhang, Z.; Zhang, C.; Li, Y.-J.; Wang, B.-C.; Zhang, B.-J.; Jiang, Y.-Q.; Zhang, M.; Tan, Y.;* Xiao, W.-J.; **Lu, L.-Q.*** Hyperconjugation-Driven Isodesmic Reaction of Indoles and Anilines: Reaction Discovery, Mechanism Study, and Antitumor Application. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2024**, *63*, e202408426.
- [6] Wang, B.-C.; Rao, L.; Fang, K.-X.; Qu, B.-L.; Xiong, F.-Y.; Feng, Y.; Tan, Y.;* **Lu, L.-Q.;*** Xiao, W.-J. Dearomatization-Rearomatization Reaction of Metal-Polarized Aza-ortho-Quinone Methides. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2023**, *62*, e202301592.
- [7] Xiao, Y.-Q.; Li, M.-M.; Zhou, Z.-X.; Li, Y.-J.; Cao, M.-Y.; Liu, X.-P.; Lu, H.-H.; Rao, L.;* **Lu, L.-Q.;*** Beauchemin, A. M.; Xiao, W.-J. Taming Chiral Quaternary Stereocenters via Remote H-Bonding Stereinduction in Palladium-Catalyzed (3+2) Cycloadditions. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2023**, *62*, e202212444.
- [8] Jiang, X.; Xiong, W.; Deng, S.; Lu, F.-D.; Jia, Y.; Yang, Q.; Xue, L.-Y.; Qi, X.-T.; Tunge, J. A.; **Lu, L.-Q.;*** Xiao, W.-J.* Construction of axial chirality via asymmetric radical trapping by cobalt under visible light. *Nat. Catal.* **2022**, *5*, 788-797.
- [9] Wang, B.-C.; Fan, T.; Xiong, F.-Y.; Chen, P.; Fang, K.-X.; Tan, Y.;* **Lu, L.-Q.;*** Xiao, W.-J. De Novo Construction of Chiral Aminoindolines by Cu-Catalyzed Asymmetric Cyclization and Subsequent Discovery of an Unexpected Sulfonyl Migration. *J. Am.*

Chem. Soc. **2022**, *144*, 19932-19941.

- [10] Shi, B.; Liu, J.-B.; Wang, Z.-T.; Wang, L.; Lan, Y.; **Lu, L.-Q.;*** Xiao, W.-J. Synthesis of Chiral Endocyclic Allenes by Palladium-Catalyzed Asymmetric Annulation Followed by Cope Rearrangement. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2022**, *61*, e202117215.