

2022 年度山东省科学技术进步奖提名公示

按照 2022 年度山东省科学技术进步奖提名公示的相关规定，现将我院曹晗同志以第 3 位完成人，山东省鲁南煤化工工程技术研究院为第 2 完成单位的“芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法及工艺研究”山东省科技进步奖推荐项目予以公示。公示期内，任何单位或者个人对公布项目的创新性、先进性、实用性及推荐材料真实性和项目主要完成人、主要完成单位持有异议的，可于公示期内书面或电话向科技处提出。为便于查证事实和处理异议，提出异议的单位或个人应实名举报。

公示联系电话： 0632-3786659

公示联系人： 郭宪厚

公示日期：2022 年 2 月 28 日-2022 年 3 月 4 日

2022 年度山东省科学技术进步奖提名公示

一、项目名称

芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法及工艺研究

二、提名者及提名意见

枣庄市科学技术局

芳基胺类杂环化合物代表了药物分子中一种特殊的结构，因此，芳基胺类杂环化合物在药物合成中具有十分重要的用途。过渡金属催化的芳基卤化物或类卤化物与胺类杂环化合物的交叉偶联反应是合成芳基胺类杂环化合物的最常用方法。相比于传统的芳基卤化物或类卤化物，酰胺、硫酯等羧酸衍生物具有环境友好、简单易得、稳定、无毒等优势。该项目以简单易得且稳定的羧酸及其衍生物为底物，实现了一系列过渡金属催化的交叉偶联反应，并得到了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成新技术，获批山东省优秀青年科学基金（海外）1 项、枣庄市自主创新及成果转化计划 2 项，获授权发明专利 4 件，发表论文 9 篇，均被 SCI 收录。成果创新性强，得到业内专家高度评价，总体达到国际领先水平。

申报材料属实，符合山东省科技奖申报条件，同意提名该成果申报 2022 年度山东省科技进步奖。

提名该项目为 2022 年度山东省科学技术进步奖二等奖。

三、提名等级

二等

四、项目简介

相比于传统的芳基卤化物或类卤化物，酰胺、硫酯等羧酸衍生物具有环境友好、简单易得、稳定、无毒等优势。我们课题组自主设计并研发了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法并合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子；将扭曲酰胺的概念引入过渡金属催化的交叉偶联反应，开创了酰胺键活化领域；开发了过渡金属催化的羧酸的脱羧偶联方法；开发了简单高效的过渡金属催化的硫酯的脱羧硫醚化。2017 年至今，课题组取得如下创新：

1. 枣庄市自主创新及成果转化计划（项目负责人：曹晗；项目名称：硝基咪唑及其液晶材料单体的绿色合成研究；项目编号：2017GH10；起止年限：2017-2019；总经费：40 万元）。项目的核心技术来自本课题组的自主创新，经过对国内外文献报道和专利技术的创新，经反复实验，优化反应条件，目前已自主研发并拥有可工业化生产的 3-硝基咪唑的绿色合成技术，设计合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子，并已经申报且获得授权国家发明专利 1 项。

2. 枣庄市自主创新及成果转化计划（项目负责人：别福升；项目名称：高级颜料永固紫 RL 的绿色生产工艺研究；项目编号：2018GH19；起止年限：2018-2020；总经费：15 万元）。项目的核心技术来自本课题组的自主创新，经过对国内外文献报道和专利技术的创新，经反复实验，优化反应条件，目前已自主研发并拥有吡啶及萘系绿色硝化技术、吡啶硝化产物及萘系硝化产物绿色还原技术，并已经申报国家发明专利 3 项，3 项均获得授权。

3. 山东省优秀青年科学基金（海外）（项目负责人：刘承伟；项目名称：稀土金属有机；起止年限：2021-2024；总经费：60 万元）。我们课题组将扭曲酰胺的概念引入过渡金属催化的交叉偶联反应，开创了酰胺键活化、羧酸的脱羧偶联等领域。目前已自主研发并拥有铈催化的酰胺的脱羧硼酸化技术、钪催化的酰胺与硫酯的芳基交换技术、钪催化的羧酸与硫酯的芳基交换技术、钪催化的硫酯的脱羧硫醚化技术、铈催化的硫酯的脱羧硫醚化技术等，已经发表 SCI 科研论文 9 篇，其中，中科院一区文章 4 篇，中科院二区文章 4 篇，中科院三区文章 1 篇。

该成果获授权发明专利 4 件，发表论文 9 篇，均被 SCI 收录；课题组自主设计并研发了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法并合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子，课题组报道了第一例酰胺的脱羧磷酸化反应、铈催化的酰胺的脱羧硼酸化反应，还报道了第一例羧酸的脱羧硼酸化反应、还原反应、芳基化反应、磷酸化反应、杂环化反应、炔基化反应，以及钪、镍、铈催化的硫酯的脱羧硫醚化反应。这些方法的发现与报道，填补了该领域的空白，目前已在有机合成、药物合成、以及功能材料合成中具有广泛应用。第三方评价表明，成果总体达到国际领先水平。

五、主要知识产权和标准规范等目录

知识产权（标准）类别	知识产权（标准）具体名称	国家（地区）	授权号（标准编号）	授权（标准发布）日期	证书编号（标准批准发布部门）	权利人（标准起草单位）	发明人（标准起草人）	发明专利（标准）有效状态	第一完成人是否为发明人（标准起草人）	第一完成单位是否为权利人（标准起草单位）
发明专利	Benzimidazole Compound and Preparation Method Thereof	美国	WO2019/015112	2020年09月29日	US010787420B2	山东省鲁南煤化工工程技术研究院，枣庄学院，山东吉田化工有限公司	刘雪静，韩迎，杨亮	有效	是	是
发明专利	一种新化合物3-硝基-9-联苯基咪唑及其合成方法	中国	CN106045899B	2018年09月11日	证书号第3066389号；国家知识产权局	枣庄学院；山东省鲁南煤化工工程技术研究院	别福升，刘雪静，韩迎，曹晗，林巧丽，褚洪斌，葛海鹏，李冉	有效	是	是
发明专利	一种新化合物9-(4'-甲基联苯基)-3-硝基咪唑及其合成方法	中国	CN106117116B	2018年8月31日	证书号第3057384号；国家知识产权局	枣庄学院；山东省鲁南煤化工工程技术研究院	别福升，刘雪静，韩迎，曹晗，林巧丽，褚洪斌，葛海鹏，李冉	有效	是	是
发明专利	一种金属催化的1-苄胺基取代苯并咪唑的合成方法	中国	CN109020895B	2020年4月24日	证书号第3768936号；国家知识产权局	枣庄学院；山东省鲁南煤化工工程技术研究院	别福升，刘雪静，韩迎，闫鹏，曹晗	有效	是	是
发明专利	一种有机中间体化合物的合成方法	中国	CN110540534B	2020年11月13日	证书号第4090972号；国家知识产权局	枣庄学院；山东省鲁南煤化工工程技术研究院	曹晗，刘雪静，韩迎，别福升，闫鹏，孙蕊蕊，石鹏程	有效	是	是
期刊论文	Pd-Catalyzed Double-Decarbonylative	美国	DOI:10.1021/acs.o	2021年10月5日	Organic Letters (ISSN: 1523-70	枣庄学院，山东省鲁南煤化工	别福升，刘雪静，曹晗，石义军，周	有效	是	是

	Aryl Sulfide Synthesis through Aryl Exchange between Amides and Thioesters		rglet t.1c0 3232		52)	工程技术研究院, 美国罗格斯大学, 南京信息工程大学	童亮, Michal Szostak, 刘承伟			
期刊论文	Rh-Catalyzed Base-Free Decarbonylative Borylation of Twisted Amides	美国	DOI : 10.1021/ acs.joc.0 c02157	2020 年 10 月 30 日	The Journal of Organic Chemistry (ISSN: 1520-6904)	枣庄学院; 山东省鲁南煤化工工程技术研究院; 美国罗格斯大学	别福升, 刘雪静, 石义军, 曹晗, 韩迎, Michal Szostak, 刘承伟	有效	是	是
期刊论文	Rh(I)-Catalyzed Intramolecular Decarbonylation of Thioesters	美国	DOI : 10.1021/ acs.joc.1 c01117	2021 年 7 月 9 日	The Journal of Organic Chemistry (ISSN: 1520-6904)	枣庄学院; 山东省鲁南煤化工工程技术研究院; 美国罗格斯大学	曹晗, 刘雪静, 别福升, 石义军, 韩迎, 闫鹏, Michal Szostak, 刘承伟	有效	是	是
期刊论文	General and Practical Intramolecular Decarbonylative Coupling of Thioesters via Palladium Catalysis	英国	DOI : 10.1039/ D0QO01576H	2021 年 2 月 4 日	Organic Chemistry Frontiers (ISSN 2052-4129)	枣庄学院; 山东省鲁南煤化工工程技术研究院; 美国罗格斯大学	曹晗, 刘雪静, 别福升, 石义军, 韩迎, 闫鹏, Michal Szostak, 刘承伟	有效	是	是
期刊论文	Palladium-Catalyzed Decarbonylative Borylation of Aryl Anhydrides	美国	DOI: 10.1021/ acs.joc.1c02134	2021 年 11 月 8 日	The Journal of Organic Chemistry (ISSN: 1520-6904)	枣庄学院; 山东省鲁南煤化工工程技术研究院; 美国罗格斯大学; 南京信息工程大学	张文志, 别福升, 马杰, 周峰岩, Michal Szostak, 刘承伟	有效	否	是

六、主要完成人

姓名	排名	行政职务	技术职称	工作单位	完成单位	对本项目贡献
刘雪静	1	院长	教授	枣庄学院	枣庄学院	对第 1、2、3 创新点做出了贡献，在该项技术研发工作中投入的工作量占本人工作总量的 80%。主要贡献：全面负责项目的立项及实施工作，保障了项目的顺利进行，以通讯作者身份发表 SCI 论文 4 篇，申请并获授权发明专利 4 项。
别福升	2	科研室 S523 负责人	讲师	枣庄学院	枣庄学院	对第 2、3 创新点做出了贡献，在该项技术研发工作中投入的工作量占本人工作总量的 80%。主要贡献：获批枣庄市自主创新及成果转化计划（项目名称：高级颜料永固紫 RL 的绿色生产工艺研究；项目编号：2018GH19；起止年限：2018-2020；总经费：15 万元）；开发了铈催化的酰胺的脱羰硼酸化技术；开发了钯催化的酰胺与硫酯的芳基交换技术；以第一作者身份发表 SCI 论文 2 篇；申请并获授权发明专利 3 项。
曹晗	3	科研室 S521 负责人	讲师	山东省鲁南煤化工工程技术研究院	山东省鲁南煤化工工程技术研究院	对第 1、3 创新点做出了贡献，在该项技术研发工作中投入的工作量占本人工作总量的 80%。主要贡献：获批枣庄市自主创新及成果转化计划（项目名称：硝基咪唑及其液晶材料单体的绿色合成研究；项目编号：2017GH10；起止年限：2017-2019；总经费：40 万元）；开发了钯催化的硫酯的脱羰硫醚化技术；开发了铈催化的硫酯的脱羰硫醚化技术；以第一作者身份发表 SCI 论文 2 篇；申请并获授权发明专利 1 项。
刘承伟	4	无	讲师	南京信息工程大学	南京信息工程大学	对第 1、2、3 创新点做出了贡献，在该项技术研发工作中投入的工作量占本人工作总量的 80%。主要贡献：获批山东省优秀青年科学基金（海外）（项目负责人：刘承伟；项目名称：稀土金属有机；起止年限：2021-2024；总经费：60 万元）；负责项目的设计，科研论文的写作、投稿、修改，以通讯作者身份发表 SCI 论文 9 篇。
阚晓东	5	董事长	工程师	枣庄东涛化工技术有限公司	枣庄东涛化工技术有限公司	对第 1、2 创新点做出了贡献，在该项技术研发工作中投入的工作量占本人工作总量的 60%。主要贡献：芳基胺类杂环化合物的绿色合成反应的放大及产业化。

七、主要完成单位情况

单位名称	排名	对本项目科技创新和应用推广情况的贡献
枣庄学院	1	<p>对第 1、2、3 创新点做出贡献。</p> <p>主要技术创新：自主设计并研发了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法并合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子；将扭曲酰胺的概念引入过渡金属催化的交叉偶联反应，开创了酰胺键活化领域；开发了过渡金属催化的羧酸的脱羧偶联方法学；开发了简单高效的过渡金属催化的硫酯的脱羧硫醚化。</p> <p>应用情况：枣庄东涛化工技术有限公司负责课题组研发的芳基胺类杂环化合物的绿色合成反应的放大及产业化，枣庄东涛化工技术有限公司正在与各化学试剂公司洽商，针对客户所需的订单进行量产。</p>
山东省鲁南煤化工工程技术研究院	2	<p>对第 1、2、3 创新点做出贡献。</p> <p>主要技术创新：自主设计并研发了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法并合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子；将扭曲酰胺的概念引入过渡金属催化的交叉偶联反应，开创了酰胺键活化领域；开发了过渡金属催化的羧酸的脱羧偶联方法学；开发了简单高效的过渡金属催化的硫酯的脱羧硫醚化。</p> <p>应用情况：枣庄东涛化工技术有限公司负责课题组研发的芳基胺类杂环化合物的绿色合成反应的放大及产业化，枣庄东涛化工技术有限公司正在与各化学试剂公司洽商，针对客户所需的订单进行量产。</p>
南京信息工程大学	3	<p>对第 1、2、3 创新点做出贡献。</p> <p>主要技术创新：自主设计并研发了一系列芳基胺类杂环化合物的绿色合成方法并合成了一系列潜在应用价值的新型液晶材料单体分子；将扭曲酰胺的概念引入过渡金属催化的交叉偶联反应，开创了酰胺键活化领域；开发了过渡金属催化的羧酸的脱羧偶联方法学；开发了简单高效的过渡金属催化的硫酯的脱羧硫醚化。</p> <p>应用情况：枣庄东涛化工技术有限公司负责课题组研发的芳基胺类杂环化合物的绿色合成反应的放大及产业化，枣庄东涛化工技术有限公司正在与各化学试剂公司洽商，针对客户所需的订单进行量产。</p>
枣庄东涛化工技术有限公司	4	<p>对第 1、2 创新点做出贡献。</p> <p>主要技术创新：硝基吡啶类、高级颜料永固紫类芳基胺杂环化合物的绿色合成反应的放大及产业化，证实了所研发的有机合成方法的普适性和稳定性。</p> <p>应用情况：枣庄东涛化工技术有限公司正在与各化学试剂公司洽商，针对客户所需的订单进行量产。</p>