

# 浙江省高校领军人才培养计划申报书

## （自然科学、工程技术类）

工作单位： 嘉兴学院 （盖章）

申 报 人： 刘石惠

申报类别： 青年优秀人才

填表日期 2021 年 12 月 9 日

## 填写说明

- 一、请申报人实事求是地填写，表中内容应与全国教师信息系统一致。
- 二、“申报类别”分为：创新领军人才、高层次拔尖人才、青年优秀人才。

姓 名	刘石惠		性 别	男	出生年月	1992.07
政治面貌	中共党员		专技职务	讲师		
工作单位	嘉兴学院		行政职务	无		
最后学历	博士研究生		最后学位	博士		
专业领域	药物合成方法学					
教育经历 (从大学起 顺序填写)	起始时间	终止时间	院 校		专 业	学 位
	2008.09	2012.06	安徽中医药大学 苏州大学 华东理工大学		制药工程 药物化学 药学	学士 硕士 博士
	2012.09	2015.06				
	2015.09	2019.06				
工作经历	起始时间	终止时间	单 位		职 务	
	2019.07	至今	嘉兴学院		专任教师	

**自我评价：近 5 年主要学术成绩及其科学价值、创新成果及其社会效益  
(本栏限 1 页)**

本人过去五年中的研究方向主要为药物合成方法学，以开发新颖的化学合成方法为手段，解决药物合成中的关键问题，以此推动新药研发进程。以下为详细介绍：

1. A photoredox/nickel dual-catalytic strategy for benzylic C-H alkoxylation (*Org. Chem. Front.*, **2021**, 8, 6881-6887, 一区, IF = 5.281)

本研究发展了一种可见光/镍共催化的苄基碳氢键烷氧基化方法。这种方法可以较高的产率合成结构多样的功能性苄基醚，具有很高的区域选择性和化学选择性。商业可得的苄基醇作为三苄基烷氧基化源以及糖类化合物的顺利转化是本研究的亮点，这一方法为结构复杂的苄基醚类的合成提供了一种实用的新工具，可用于解决现有天然产物水溶性差的问题。

2. Photocatalytic C-H silylation of heteroarenes by using trialkylhydrosilanes (*Chem. Sci.*, **2019**, 10, 3817-3825, 自然指数期刊, 一区, IF = 9.825)

本研究发展了一种可见光催化的碳氢键硅基化方法，该方法能够使三烷基氢硅烷与缺电子 and 富电子的杂芳烃以及氰基取代的芳烃以较高产率和良好的区域选择性直接偶联。该方案的特点是操作简单，反应条件温和，使用安全易得的过硫酸钠、双三甲基硅过氧化物或三异丙基硅硫醇作为自由基引发剂。值得注意的是，具有挑战性的大体积和惰性三烷基氢硅烷，例如叔丁基二甲基硅烷和三异丙基硅，能够顺利地与方法一起工作。此外，尽管叔丁基二甲基硅化产物具有更高的稳定性，但我们的研究揭示了它们在各种碳硅键基化学转化中的巨大反应性和多功能性，为分子构建和精细化提供了操作简单、低成本和环境友好的合成技术，此项技术可用于直接改善药物分子及天然产物的脂溶性。

3. Highly stereoselective synthesis of C-nucleosides via the merger of photoredox and nickel catalysis (*Chem. Commun.*, **2019**, 55, 14657-14660, 自然指数期刊, 二区, IF = 6.222)

本研究发展了一种核糖/脱氧核糖酸与芳基/杂芳基溴化物的可见光/镍共催化脱羧偶联反应。本研究中，烯基溴化物也被证明是有效的反应物。该方法可以在可见光照射下顺利进行，其特点在于使用了具有成本低廉且易于处理的催化剂和起始材料，从而能以较高产率且高立体选择性地合成多种碳核苷类化合物，为合成碳核苷类抗病毒药物提供有效方法。

4. Direct C $\alpha$ -heteroarylation of structurally diverse ethers via a mild N-hydroxysuccinimide mediated cross-dehydrogenative coupling reaction (*Chem. Sci.*, **2017**, 8, 4044-4050, 自然指数期刊, 一区, IF = 9.825)

醚的杂芳基化是一个极具挑战的合成技术，一般需要大量的醚类作为底物（在许多情况下用作溶剂）才能实现有效的转化。这一缺点极大地限制了醚的杂芳基化，使其只能用于简单易得的醚底物。为了克服这一限制，本研究发展了一种新型高效的氮羟基琥珀酰亚胺介导的、温和的、无金属的交叉脱氢偶联方法，用于多种醚的直接杂芳基化。本研究首次发现了一种独特的非光氧参与的氢原子转移机制，该机制使用氮羟基琥珀酰亚胺产生的氮中心阳离子自由基。值得注意的是，仅使用五到十当量的醚作为底物，这使得结构多样且复杂的醚类底物也可以参与该过程，以合成药物活性相关的杂芳基化醚，为合成碳糖苷类药物提供有效方法。

近 5 年主要发表论文情况（选填代表作 5 篇以内）

序号	论文题目	刊物名称	期刊号	发表时间	作者排序/总人数	简要评价（论文创新点、贡献性及意义）
1	A photoredox/nickel dual-catalytic strategy for benzylic C-H alkoxylation	Organic Chemistry Frontiers	2052-4110	2021.10	8/8(通讯作者)	采用可见光/镍共催化方法, 利用来源广泛的醇和碳氢键底物高效构建碳氧键, 方法有效用于药物分子合成及天然产物结构修饰
2	Photocatalytic C-H silylation of heteroarenes by using trialkylhydrosilanes	Chemical Science	2041-6539	2019.02	1/6 (第一作者)	采用可见光催化方法, 发展了三种体系, 分别从缺电子杂环、富电子杂环及苯环三方面高效构建碳硅键, 方法有效用于药物分子合成及天然产物结构修饰
3	Highly stereoselective synthesis of aryl/heteroaryl-C-nucleosides via the merger of photoredox and nickel catalysis	Chemical Communications	1359-7345	2019.11	2/8(共同第一作者)	采用可见光/镍共催化方法, 利用廉价易得的催化剂和其实原料, 提供碳核苷类合成新方法, 方法有效用于碳核苷类药物分子的合成
4	Direct C $\alpha$ -heteroarylation of structurally diverse ethers via a mild N-hydroxysuccinimide mediated cross-dehydrogenative coupling reaction	Chemical Science	2041-6539	2017.03	1/4 (第一作者)	采用新型无金属催化体系, 利用简单易得氮羟基琥珀酰亚胺高效提高醚的杂芳基化效率, 极大简化碳糖核苷类化合物的合成方法

5	An efficient method for the production of terminal alkynes from 1,1-dibromo-1-alkenes and its application in the total synthesis of natural product dihydroxerulin	Advanced Synthesis & Catalysis	1615-4150	2015.01	1/9 (第一作者)	采用绿色温和的无金属催化条件,以简单易得的底物高效合成端炔,该方法可有效用于药物活性分子及天然产物的合成
---	--	--------------------------------	-----------	---------	------------	--

近 5 年主要出版著作情况 (选填代表作 5 项以内)						
序号	著作题目	作者排序	出版社	出版时间	书号	类别

注: 类别指教材, 专著, 译著。

近 5 年专利情况（按重要性填写主要专利，总共不超过 5 项）						
序号	专利名称	专利类别	专利号	批准时间	申请 国家（地 区）	转化情况

注：专利类别指发明专利、实用新型专利、外观设计专利、软件著作权等。

近 5 年主持、参加项目的情况（按重要性填写）						
一、纵向课题情况（不超过 5 项）						
序号	项目名称	起止时间	项目级别/ 类型	经费来源及额度	担任角 色	是否结题
1	硅代过氧化物促进的脂肪族碳氢键羟基化反应研究 (22001096)	2021.01-2023.12	国家自然科学基金青年项目	国家自然科学基金 24 万	主持	否
2	可见光催化的糖苷类羟基选择性芳基化反应研究 (LQ21B020008)	2021.01-2023.12	浙江省自然科学基金探索项目	浙江省自然科学基金 10 万	主持	否

3	基于自由基型环醚碳氢(C $\alpha$ )芳基化策略的芳基碳糖苷合成研究(21871086)	2019.01-2022.12	国家自然科学基金面上项目	国家自然科学基金 65 万	参与	否
4	抗肿瘤天然产物那可丁(Noscapine)的全合成与结构改造(21602060)	2017.01-2019.12	国家自然科学基金青年项目	国家自然科学基金 20 万	参与	是
5	基于生物质谱的低丰度棕榈酰化修饰蛋白质的定性定量新方法研究	2021.01-2023.12	浙江省公益技术研究计划分析测试项目	浙江省自然科学基金 5 万	参与	否
<b>二、横向课题情况（不超过 5 项）</b>						
序号	项目名称	起止时间	委托单位	金额（万元）	担任角色	是否结题

注：项目级别分“国家级”“省部级”“市厅级”；经费来源指“发改”“科技”“自然科学基金”等。



其他情况（包括近 5 年获得的省部级以上重要奖项、在国际国内学术组织兼职、在国际国内学术会议做重要报告等情况，本栏限 1 页）

工作设想（拟开展重要科学技术研究、项目计划安排、拟达到的总体目标、预期成果和经济社会效益以及现有基础、团队等，本栏限 1 页）

### 一、拟开展重要科学技术研究

天然产物是新药发现的重要来源，随着碳氢键活化技术的发展，天然产物精准修饰成为发现药物先导物的有效途径。由于结构复杂、选择性差，天然产物精准修饰还面临很大挑战。本项目利用药物合成方法学的优势，旨在发展一系列绿色高效、精准可控的针对复杂天然产物的修饰方法，并在天然产物的药物化学和生物化学研究打下基础。

### 二、项目计划安排

1、2022.01.01-2023.12.31 基于硅代过氧化物的脂肪族碳氢键羟基化和可见光催化的糖苷类羟基选择性芳基化新方法的发展和完善

（1）硅代过氧化物促进的脂肪族碳氢键羟基化反应研究为已获得的国家自然科学基金青年项目（22001096），此部分项目计划安排如下：硅代过氧化物的脂肪族碳氢键羟基化新方法的拓展和新方法的应用，进一步构建含醇羟基的天然产物类似物小分子化合物库；整理数据，发表文章，申请专利，结题验收。

（2）可见光催化的糖苷类羟基选择性芳基化反应研究为已获得的浙江省自然科学基金探索项目（LQ21B020008），此部分项目计划安排如下：可见光催化的糖苷类羟基选择性芳基化新方法的拓展和新方法的应用，进一步构建以糖苷衍生物为核心的糖苷类小分子化合物库；整理数据，发表文章，申请专利，结题验收。

2、2024.01.01-2024.12.31 基于天然产物的羟基 $\alpha$ -碳氢键官能团化研究探索

基于前期对脂肪族碳氢键羟基化及糖苷类羟基选择性芳基化研究发现，羟基在药物分子及天然产物结构中十分重要，现有的羟基及上述方法引入的羟基在生物活性方面保持高水平的作用，鉴于羟基的重要性，对其直接修饰并不可取，但对于羟基 $\alpha$ -碳氢键成为进一步修饰的重要目标，此部分研究旨在对天然产物的羟基 $\alpha$ -碳氢键官能团化研究进行初步探索。以此部分研究为基础，申请 1-2 项国家自然科学基金面上项目及 1-2 项浙江省自然科学基金重点项目。

3、2025.01.01-2026.12.31 基于天然产物的羟基 $\alpha$ -碳氢键官能团化研究发展和完善

不同羟基 $\alpha$ -碳氢键底物的拓展及天然产物及药物活性分子的羟基 $\alpha$ -碳氢键后期官能团化。

### 三、拟达到的总体目标

基于现有研究发展一系列绿色高效、精准可控的针对复杂天然产物的修饰方法，在此基础上提供更多药物活性分子及临床前药物，以推动新药研发领域的发展。

### 四、预期成果和经济社会效益

完成国家自然科学基金青年项目（22001096）和浙江省自然科学基金探索项目（LQ21B020008）的项目结题；基于现有基础进一步研究，在未来几年申请到 1-2 项国家自然科学基金面上项目及 1-2 项浙江省自然科学基金重点项目；基于现有基础发表 SCI 论文 5-10 篇，申请专利 5-10 项，完成 1-2 项成果转化；培养教授 1 名，硕士研究生 5-10 名。

### 五、现有基础

现以第一作者/通讯作者在国际知名刊物发表 SCI 论文 7 篇。主持国家自然科学基金青年基金项目（22001096）1 项，浙江省自然科学基金探索项目（LQ21B020008）1 项；获得嘉兴学院“百青”培养计划和双师双能资格证；参与浙江省线上线下混合式一流课程（药物化学）1 项；指导学生参加“全国大学生药苑论坛”校级一/二等奖；指导学生参加校级大学生科研训练计划（SRT）3 项。所在的药物合成实验室充分具备药物合成方法学所需实验条件；目前团队除本人外还包括浙江工业大学-嘉兴学院联培硕士研究生 2 名，嘉兴学院本科生 10 余名。

**本人承诺以上信息均真实有效，如有不实之处，愿承担一切责任。**

申请人签字：

年 月 日

### 用人单位培养目标与计划

推荐人选具 体培养目标	考核评价
1. 具有扎实的马克思主义理论功底，能够运用马克思主义立场、观点、方法分析和解决实际问题。	1. 思想政治素质：政治立场坚定，理想信念坚定，道德品质高尚。
2. 具有宽广的国际视野和跨文化沟通能力，能够适应全球化背景下的工作需求。	2. 专业素质：具备扎实的专业知识，能够胜任相关领域的工作。
3. 具有强烈的社会责任感和奉献精神，能够积极参与社会公益事业。	3. 综合素质：具备良好的沟通协调能力、团队合作精神和抗压能力。
4. 具有创新精神和实践能力，能够提出切实可行的建议和方案。	4. 发展潜力：具备较强的学习能力和自我提升能力，能够适应不断变化的工作环境。

## 推荐人选培养计划举措

具体计划举措:

### 审核意见

学校纪检监察部门意见:

学校纪检监察部门（公章）

年 月 日

学校党委意见:

学校党委（公章）

年 月 日

