

**焦宁**, 北京大学, 医学部天然药物及仿生药物国家重点实验室, 教授



### 受教育经历

1999/09 - 2004/07, 中国科学院, 上海有机化学研究所, 博士, 导师: 麻生明 研究员

1995/09 - 1999/07, 山东大学, 化学学院, 学士, 导师: 林吉茂 教授

### 研究工作经历

2004/10 - 2006/12, 德国 MPI für Kohlenforschung, 博士后

2007/01 - 2010/07, 北京大学, 药学院天然药物及仿生药物国家重点实验室, 副教授

2010/08 - 至今, 北京大学, 药学院天然药物及仿生药物国家重点实验室, 教授

在现代合成方法研究中, 如何实现简洁、高效、节能、绿色化可持续发展, 已成为研究的首要目标。回国以来, 以基于简单来源分子为原料的简洁、高效合成方法学为主要研究内容, 通过惰性 C-H/C-C 键活化与重组、自由基反应等过程, 发展新的方法学, 为活性分子或复杂分子的合成提供简洁、高效途径。07 年以来以责任作者在 JACS (4 篇); Angew. Chem. (13 篇); Chem. Soc. Rev. (2 篇); CC (7 篇); OL (12 篇) 等期刊发表论文 59 篇, 申请专利 6 项, 研究工作已被他引 1135 次。主要概括为: 1) 氧气氧化反应; 2) 氮化反应。

1) 氧气氧化反应: 针对传统当量的金属盐、有机醌类、高碘化物、过氧化物等氧化剂参与的 C-H 键官能团化反应, 申请人发展了 Cu、Fe、Pd、Ru 等过渡金属以及有机小分子催化剂催化的氧化偶联反应, 特别是发展了以氧气为洁净氧化剂的过渡金属催化体系, 通过直接脱氢环化 DDA (Direct Dehydronative Annulation) 反应, 从简单化合物出发, 经 C-H 键活化, 为经济、高效合成吲哚、咔唑、咔啉等含氮杂环化合物提供了简洁、高效途径。并受邀在 Chem. Soc. Rev. 撰写综述, 总结近年来氧气作为氧化剂的过渡金属催化反应进展 (Chem. Soc. Rev. 2012, 41, 3381-3430)。

氧合反应 (Oxygenation Reactions): 如何在温和条件下高效实现氧气中的氧固定到有机

分子中是一个研究较少，并且非常具有挑战性的领域。我们实现了温和条件下铜催化氧分子的活化重组，利用超氧自由基过程，实现了多种以氧气为氧源的氧合反应，经过 C-H 或 C-C 键断裂，为酰胺、醇、醛、酮等含氧化合物的合成提供了新方法。并受邀在 Chem. Soc. Rev. 撰写综述，总结铜催化经过单电子转移的氧化脱氢反应进展(Chem. Soc. Rev. 2012, 41, 3464-3484)。

2) 氮化反应 (Nitrogenation Reactions): 碳、氢、氧、氮是组成有机分子的最主要的四种元素，含氮化合物在药物分子中占据重要地位，如何利用最简单、直接的碳氢化合物为原料在温和条件下将氮引入到有机分子中一直是一个意义重大，但非常具有挑战性的研究领域。申请人提出并发展了有机氮化反应的概念，创新性地使用简单的叠氮或甲酰胺(DMF)为氮源，通过简单碳氢化合物的 C-H 和 C-C 键断裂将氮原子引入简单分子中，首次实现了腈、酰胺、四氮唑等含氮化合物合成新途径。使得抗小核糖核酸病毒活性的 Disoxaril 类似物等活性分子的合成及化合物修饰更加简单、廉价。

### 代表性文章：

1. Conghui Tang and Ning Jiao\*, Copper-catalyzed C-H Azidation of Anilines under Mild Conditions, *J. Am. Chem. Soc.* **2012**, *134*, 18924-18927.
2. Xejun Xu, Chun Zhang, and Ning Jiao\*, Cu-mediated Aerobic Oxidative Dehydrogenative Annulation and Oxygenation of Aldehydes and Amines for Oxazoles via C-H Functionalization and Dioxygen Activation, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 11367–11370.
3. Chong Qin, Tao Shen, Conghui Tang, and Ning Jiao\*, FeCl<sub>2</sub>-promoted Unactivated C-C Bond Cleavage of Alkylarenes and Polystyrene: Direct Synthesis of Versatile Arylamines, *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 6971-6975.
4. Feng Chen, Chong Qin, Yuxin Cui, and Ning Jiao\*, Implanting Nitrogen into Hydrocarbon Molecules via C-H/C-C Bonds Cleavage: The Direct Approach to Tetrazoles. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2011**, *50*, 11487-11491.
5. Chun Zhang, Zejun Xu, Liangren Zhang, and Ning Jiao\*, Copper-catalyzed Aerobic Oxidative Coupling of Aryl Acetaldehydes with Anilines Leading to  $\alpha$ -Ketoamides. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2011**, *50*, 11088-11092.
6. Shengtao Ding, and Ning Jiao\*, The Direct Transformation of DMF (N,N-Dimethylformamide) to -CN: Pd-catalyzed Cyanation of Heteroarenes via C-H

- Functionalization. *J. Am. Chem. Soc.* **2011**, *133* (32), 12374-12377.
- 7. Chong Qin, and **Ning Jiao\***, Iron-Facilitated Direct Oxidative C–H Transformation of Allylarenes or Alkenes to Alkenyl Nitriles. *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 15893-15895.
  - 8. Chun Zhang, and **Ning Jiao\***, Dioxygen Activation at Ambient Conditions: Cu-catalyzed Oxidative Amidation-Diketonization of Terminal Alkynes Leading to  $\alpha$ -Ketoamides. *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 28-29.
  - 9. Wang Zhou, Liangren Zhang, and **Ning Jiao\***, Direct Transformation of Methyl Aromatics to Aryl Nitriles at Room Temperature. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2009**, *48*, 7094-7097.
  - 10. Zhuangzhi Shi, Chun Zhang, Si Li, Delin Pan, Sengtao Ding, Yuxin Cui, and **Ning Jiao\***, Indoles from Simple Anilines and Alkynes: Palladium-Catalyzed C-H Activation Using Dioxygen as the Oxidant. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2009**, *48*, 4572-4576.