



# 有机简讯

11

内部刊物，注意保存

本期四版，本月十五日出版

SIOC NEWS

2016年第11期

## 本期导读

**唯实 求真 协力 创新  
改革 创新 和谐 奋进**

**全面推进我所  
“一三五”战略规划的实施**

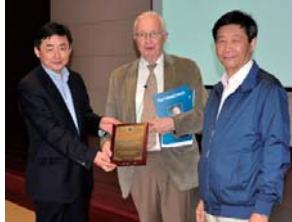
**上海有机所“十二五”规划  
战略定位**

**坚持基础研究与应用研究并重，发  
挥有机合成化学的创造性，加强与生  
命科学、材料科学的交叉与融合；致力  
于推动我国化学转化方法学、化学生物  
学、有机新材料科学等重点学科领域  
的发展；在有机化学基础研究、新医药农  
药和高性能有机材料创制方面实现新的  
突破；引领有机化学学科前沿的发展，  
满足国家战略需求，将上海有机所建设  
成为国际一流的有机化学研究中心。**

## 目录

1	诺奖得主Jean-Marie Lehn教授应邀来上海有机所作2016年汪猷科学讲座..1
2	上海有机所举行“2016年中国科学院国际访问学者”证书授予仪式暨学术报告会.....1
3	上海有机所发展有机催化新模式：双试剂手性离子对催化.....2
4	上海有机所在铜催化的杂原子芳基化反应研究再获突破.....2
5	上海有机所游书力研究员荣获2016年度何梁何利基金青年创新奖.....3
6	2016年上海市学研工作推进大会暨精准化学高峰论坛在上海有机所召开...3
7	上海有机所国家重点研发计划“神经退行性疾病中细胞死亡机理和干预的研究”项目启动会顺利举行.....3
8	上海有机所荣获“2016年度上海市科技创新券优秀服务机构” .....4
9	上海有机所顺利完成徐汇区第十六届人大代表选举工作.....4
10	上海有机所“魅力有机化学”科普拓展课程第三、四课在南洋中学顺利开 展.....4

## 诺奖得主Jean-Marie Lehn教授应邀来上海有机所作2016年汪猷科学讲座



10月27日下午，诺贝尔化学奖获得者、法国斯特拉斯堡大学 (Université de Strasbourg) 的Jean-Marie Lehn教授应邀来到上海有机所进行学术访问，并作了题为“Perspectives in Chemistry: From Supramolecular Chemistry towards Adaptive Chemistry”的汪猷科学讲座。林国强院士主持了本次讲座，并与上海有机所所长丁奎岭院士一起为Jean-Marie Lehn颁发了汪猷科学讲座纪念证书。

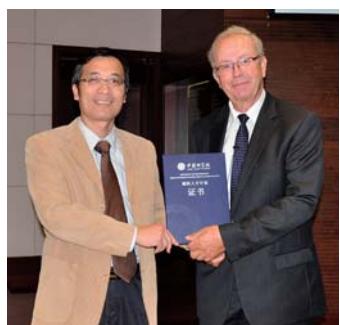
Jean-Marie Lehn在1980年11月首次踏上中国的土地，第一站就选择了访问上海有机所。1998年再次访问之后，在今年第三次站上了上海有机所的讲台。

Jean-Marie Lehn在报告中系统地阐述了从分子化学、超分子化学、动态学到自适应化学的演变，着重讲述了基于成键的可逆性而产生的化学体系自组装、自纠错、以及对外界刺激的响应和对环境的自适应，由简单小分子自组装构筑高度复杂有序结构中的动态过程与自我调节，以及对组装过程及结果的调控。同时，还进一步展示了这些特性在生命科学、医药、材料科学等领域的应用，如生物大分子结构模拟与功能揭示，动态化合物库的建立，基于自适应化学的智能材料等。Jean-Marie Lehn的报告彰显了国际知名大师级学者的学术造诣和人格魅力，赢得了有机所师生的热烈掌声，报告厅座无虚席。报告结束后，现场师生与教授展开积极地互动问答，进一步深入交流探讨。

Jean-Marie Lehn于1939年9月30日出生于法国下莱茵省罗塞姆市，1963年在斯特拉斯堡大学获得理学博士学位，随后在哈佛大学 (下转第4页)



## 上海有机所举行“2016年中国科学院国际访问学者” 证书授予仪式暨学术报告会



10月17日下午，上海有机所举行了“2016年中国科学院国际访问学者”证书授予仪式暨学术报告会。党委副书记（主持工作）胡金波和副校长俞飚分别为德国明斯特大学 (University of Münster) 的Werner Günter Haufe教授和意大利那不勒斯费德里克二世大学 (University of Naples Federico II) 的Antonio Molinaro教授颁发了荣誉证书。

授予仪式后，Haufe和Molinaro分别作了题为“Selective Fluorination - A Key for Selective Synthesis of Medicinally Relevant compounds”和“The role of microbial glycans in the elicitation of eukaryotic innate immunity”的学术报告。

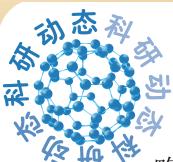
Haufe系统地介绍了氟化的天冬氨酸蛋白水解酶抑制剂和氟化的一元胺氧化酶抑制剂的相关研究，阐明了<sup>18</sup>F标记和PET（正电子发射型计算机断层显像）的应用。Molinaro教授详细地讲述了复杂天然糖缀合物，特别是脂多糖如何从细菌中分离鉴定，以及在疫苗研发领域的巨大潜力。报告结束后，上海有机所师生和两位教授针对报告内容开展了热烈讨论和交流。

Haufe和Molinaro依托上海有机所分别获得了“2016年中科院国际人才计划——国际访问学者”项目的资助，将在上海有机所进行为期一个月的访问。访问期间，两位教授将与分别与上海有机所胡金波课题组和俞飚课题组开展相关课题合作研究，同时对研究生的相关工作提供指导。

朱影



# 上海有机所发展有机催化新模式：双试剂手性离子对催化



近日，上海有机所的中科院天然有机合成化学重点实验室赵刚课题组通过研究发展出了双试剂手性离子对的催化策略，该策略基于廉价、易得的天然手性源（如氨基酸、生物碱），设计、合成了一系列新型手性有机催化剂，并将其作为手性Brønsted酸或Lewis碱应用于不对称催化Strecker等类型的反应，取得优异的产率、对映选择性。该研究成果已发表在国际知名期刊Nature Communications上。

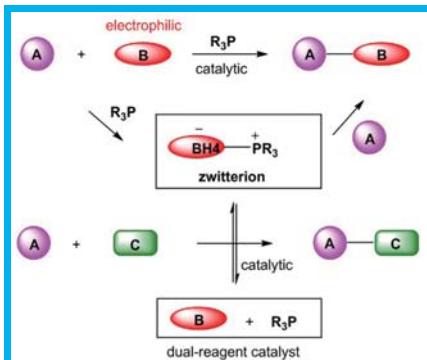
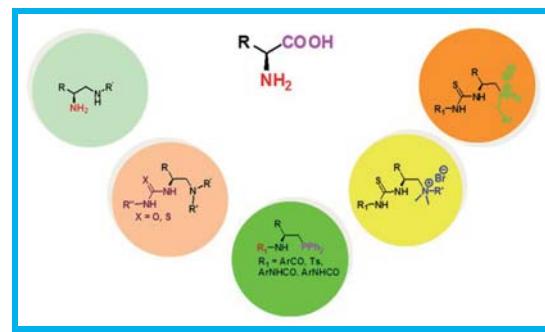
众所周知，生命过程中酶催化的化学反应具有条件温和、立体专一性、高的催化活性等优点，但同时具有反应底物普适性差的缺点。使用低分子量的有机化合物模拟酶的催化活性、选择性以及揭示其催化机制，始终是化学和生物学研究者认识自然，并服务于社会的不竭动力和追求。

从酶最基本的结构单元氨基酸出发，经过简单化学转化发展出具有酶催化剂的优点同时克服其缺点的结构多样的有机小分子催化剂库，从而实现“源于自然，优于自然”人工酶催化剂的目标。在此研究思路基础上，中科院天然产物合成化学重点实验室赵刚课题组基于廉价、易得的天然手性源（如氨基酸、生物碱），设计、合成了一系列新型手性伯胺-仲胺、伯胺-叔胺、伯胺-膦、叔胺-硫脲、含氢键相转移催化剂等有机小分子催化剂。它们能够高效、高对映选择性催化碳-碳键、碳-氧键以及碳-氟键形成等反应，催化多组分串联反应一步形成多个手性中心并且反应具有较广的底物普适性，其中一些反应方法学已应用于复杂天然产物的合成及手性药物及其中间体的合成，具有较好的应用前景。

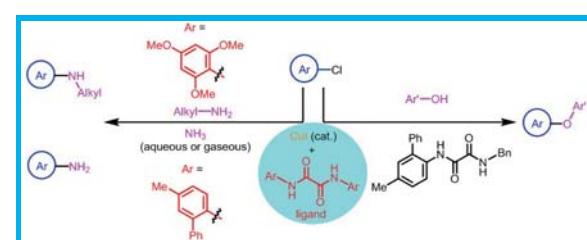
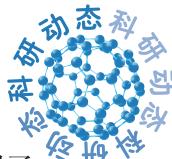
亲核性膦催化方法广泛地应用于不对称有机反应，但同时存在亲核性膦催化剂的催化当量较高、反应类型较窄等问题。基于氨基酸设计、合成手性有机膦与丙烯酸酯组成的一类双试剂的手性离子对，并将其作为手性Brønsted酸或Lewis碱应用于不对称催化Mannich

(Angew. Chem. Int. Ed., 2015, 54, 1775) 和Strecker (Nature Communications, 2016, 7, 12720) 等类型反应中，取得优异的产率、对映选择性，该类反应具有低催化当量以及反应时间短的特点。初步揭示的反应机理，可以观察到手性非线性效应在同一反应中随底物不同而变化。

该课题组所发展出来的双试剂手性离子对的催化策略和概念拓展了手性膦催化反应的范围，可能带来新的反应与应用。上述研究工作得到了国家自然科学基金委、上海市优秀学科带头人项目的资助。赵刚

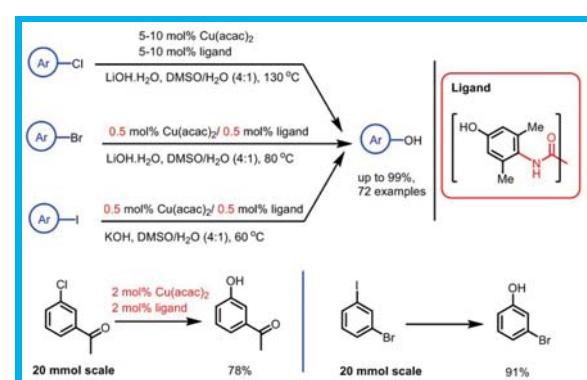


## 上海有机所在铜催化的杂原子芳基化反应研究再获突破



继2015年、2016年连续报道草酸二酰胺配体促进的铜催化的芳基氯代物与伯胺、氨水、苯酚的高效偶联反应后，近期，中国科学院上海有机化学研究所的马大为研究团队进一步发展了温和条件下的芳基卤代物的羟基化反应 (J. Am. Chem. Soc., 2016, <http://dx.doi.org/10.1021/jacs.6b08114>)。

最近，马大为研究团队进一步研究发现，双(4-羟基-2,6-二甲基苯基)草酸酰胺(BHMPO)配体可以非常高效的促进芳基卤代物的直接羟基化反应。首先，对于不活泼的芳基氯代物，采用氢氧化锂作为羟基化试剂，Cu(acac)<sub>2</sub>/BHMPO催化体系使得羟基化反应能在130°C条件下进行，高收率的得到相应的苯酚和羟基杂芳基化合物，给电子和吸电子的芳基氯代物都能很好的反应，杂芳基氯代物包括吡啶、喹啉、吲哚、苯并噻唑、苯并咪唑等也是合适的反应底物。对于芳基溴代物，该偶联反应在80°C即可发生，而且催化剂用量可以降至0.5mol%；对于最活泼的芳基碘代物，反应温度可进一步降至60°C，羟基化试剂可采用更为廉价的氢氧化钾。值得注意的是，20 mmol规模的3-氯苯乙酮的羟基化反应在较低催化剂量(2 mol% Cu(acac)<sub>2</sub>/2 mol% BHMPO)即可以78%的收率得到3-羟基苯乙酮；而采用3-溴-1-碘苯作为反应物，60°C的反应条件下可以选择性的制备3-溴苯酚，而且反应时间也大大缩短。这些优势都有助于将来应用该方法大规模合成相关苯酚类化合物。



苯酚、羟基杂芳基化合物以及相关衍生物结构在医药、农药和有机材料分子中广泛存在。由于芳基卤代物的经济易得以及反应选择性可控等优势，芳基卤代物直接羟基化反应是合成该类化合物的重要方法。

Buchwald、Beller等发展了高效的钯催化的芳基氯代物直接羟基化反应，但是对于铜催化的直接羟基化反应此前只能使用与芳基碘与芳基溴，而且，催化剂用量较高(5-10 mol%铜盐和10-300 mol%配体)，反应温度也高达100-140°C。

马大为研究团队成功地实现了铜催化的芳基氯代物的直接羟基化反应，对于活泼的芳基碘代物和溴代物该反应更可在很低的催化剂用量和温和的反应温度下进行，是对草酸酰胺配体应用的进一步发展。他们的新催化体系有望成为一个非常有竞争力的试剂，在苯酚和羟基杂芳基化合物合成中得到应用。

上述研究工作得到了中国科学院和国家自然科学基金委相关项目的大力资助。

马大为

# 上海有机所游书力研究员荣获2016年度何梁何利基金青年创新奖

10月21日，何梁何利基金2016年度颁奖大会在北京钓鱼台国宾馆举行。全国人大常委会副委员长陈昌智与全国政协副主席、科技部部长万钢出席大会并为获奖人颁奖。上海有机所游书力研究员荣获2016年度何梁何利基金青年创新奖。

何梁何利基金由香港爱国金融实业家何善衡、梁𨱇琚、何添、利国伟先生共同捐资港币4亿元于1994年在香港注册成立，宗旨是通过奖励取得杰出成就的我国科技工作者，倡导尊重知识、尊重人才、崇尚科学的社会风尚，激励科技工作者勇攀科学技术高峰。本年度，51位中国科学家分获何梁何利“科学与技术成就奖”、“科学与技术进步奖”和“科学与技术创新奖”。

游书力主要从事手性化合物的高效合成，手性催化剂设计与合成领域的研究。发展了手性催化剂新概念及新反应，包括：新催化剂和配体，发展多个具有独立知识产权的手性催化剂与配体，其中11个氮杂环卡宾催化剂及手性亚磷酰胺配体已实现商品化；新概念和新反应，提出“催化不对称去芳构化（CADA）”概念，为手性合成开辟了新的研究领域，实现了吲哚、吡咯、苯酚、吡啶等芳香化合物的不对称去芳构化反应，为该领域的发展作出重要贡献。

杨慧娜



## 2016年上海市学研工作推进大会暨精准化学高峰论坛在上海有机所召开



为进一步探索学研协同创新机制，营造良好的创新氛围，形成上海加快建设具有全球影响力的科技创新中心的合力，10月28日由市科技党委、市科委主办，中科院上海有机所承办的“2016年上海市学研工作推进大会暨精准化学高峰论坛”在有机所君谋楼报告厅召开。会议由市科委副主任马兴发主持，市科技党委书记刘岩出席会议并讲话。来自上海各大高校和研究院所的科技工作负责人、众多国内外一流专家学者350余人参加了这次大会。来自美国斯克里普斯研究所的诺贝尔化学奖得主K.B.Sharpless教授、中科院院士陈庆云、林国强、洪茂椿、田禾、丁奎岭等参加会议，并在随后的精准化学高峰论坛作了精彩报告和点评。

会议首先由上海科学技术开发交流中心、上海市学研工作推进办公室主任尹邦奇作学研工作报告，总结了学研平台近年来在强化学研合作顶层设计、创新学研对接模式、推动创新型平台建设、探索长效合作机制等方面取得的工作进展，并针对学研协同创新过程中还存在的信息不对称，创新资源共享不够、人才交流存在体制制约等问题和短板提了一些思考和解决的方案。

刘岩针对当前的学研工作指出，上海正处在建设具有全球影响力科技创新中心的关键时期，科技工作者必须进一步提高认识，把学研工作深度融入到科创中心建设中去。我们要充分认识到，深入实施创新驱动发展战略，加快建设具有全球影响力的科技创新中心，迫切需要把学研合作放在更加突出的位置上，积极通过学研融合，沟通知识创新体系与技术创新体系，让创新元素充分流动起来。

今年的学研工作大会打破了以往单一政府工作会议的形式，有机融合了高峰学术论坛，邀请了诺贝尔化学奖得主K.Barry Sharpless教授、洪茂椿院士、田禾院士、施剑林研究员、刘文研究员、马大为研究员，从材料、生物医药以及合成化学等多角度出发，就精准化学领域展开学术交流。最后，上海有机所所长丁奎岭院士做会议总结发言，强调在上海科创中心建设过程中，化学领域也面临诸多挑战和机遇，化学家要在未来的合成化学中更加聚焦新分子、新反应、新方法和新功能，寻找更加精准的新一代物质转化途径，通过合成创造价值，用分子影响改变世界。

王蕾蕾



## 上海有机所国家重点研发计划“神经退行性疾病中细胞死亡机理和干预的研究”项目启动会顺利举行



10月31日，由中科院生物与化学交叉研究中心袁钧瑛教授主持的国家重点研发计划“神经退行性疾病中细胞死亡机理和干预的研究”项目启动会在中科院生物与化学交叉研究中心顺利召开。中科院前沿科学与教育局副局长张永清、中科院上海有机所副所长马大为出席会议并发表讲话。

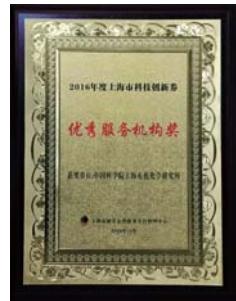
项目成立了由张学敏院士、段树民院士、蒲慕明院士、王志新院士、张永清研究员、雷鸣研究员、赵世民教授、王晓民教授、陈鹏教授组成的项目咨询专家组，对项目研究进行全程跟踪与指导。会上项目负责人袁钧瑛对项目的立项背景、科学问题、研究内容、预期成果与创新点进行了全面阐述，并对项目的考核指标、技术路线、研究方法、进度安排、可能出现的难点和风险点及控制措施等方面进行了详细汇报。项目四个课题的负责人分别就课题的研究内容、研究方法、预期目标等具体实施方案进行了汇报。同时，项目相关课题组成员还将交叉中心目前已有的研究基础及近期取得的科研进展进行了汇报。与会专家听取汇报后，充分肯定了项目的研究意义和各课题研究方案，并就各课题研究过程中可能出现的难点和共性问题提出了具体的、有针对性的指导意见和建议。专家组一致认为，在袁钧瑛的主持下，多位院士和专家的指导下，研究团队的共同努力下，该项目必将在神经退行性疾病研究领域取得丰硕的科研成果。

本次启动会圆满完成了各项议程，通过专家组与项目组成员的集体讨论，项目组进一步理清了思路、明确了目标。项目将以细胞死亡和炎症反应的调控机制为核心，为神经退行性疾病的治疗提供新思路、新方法和新策略，进而发掘神经退行性疾病的药物靶点和先导化合物，形成用于神经退行性疾病治疗的系列新药产品，加快推进神经退行性疾病相关健康产业的发展。

杨菲



# 上海有机所荣获“2016年度上海市科技创新券优秀服务机构”



为进一步推动落实上海市科技创新券服务企业创新，提升科技券服务机构的服务水平，近日，上海市研发公共服务平台管理中心组织开展了2016年度上海市科技创新券优秀服务机构和优秀个人的评选工作。中国科学院上海有机化学研究所被评选为“2016年度上海市科技创新券优秀服务机构”；公共技术服务中心闵新锋被评选为“2016年度上海市科技创新券优秀服务个人”。2016年度上海市科技创新券优秀服务机构及个人评选工作总结会在上海市研发公共服务平台管理中心举行。

上海市科技创新券政策由上海市科委自2015年7月开始正式推行，依托加盟上海市研发公共服务平台的大型科学仪器设施和专业技术服务单位，为中小微企业和创业团队提供检验测试、仪器共享、研发合作等创新服务，以此大幅降低中小微企业和创业团队的研发成本。



李齐

## 上海有机所顺利完成徐汇区第十六届人大代表选举工作



11月16日，根据徐汇区人大代表选举委员会的统一部署，上海有机所作为徐汇区第47选区第3至6投票站，举行了徐汇区第16届人大代表的投票选举。上海有机所党政办主任黄智静同志受徐汇区选举委员会委托，主持选举大会。

上海有机所职工、研究生共计768人参加了投票选举，投票率近92%，认真行使了选民的民主权利。通过徐汇区各选区的投票选举，上海有机所周佳海研究员当选徐汇区第十六届人大代表。



人大代表选举是保证人民当家作主、推进社会主义民主政治建设的重要环节，是构建社会主义和谐社会的重要政治保障。为确保人大换届选举工作顺利完成，上海有机所精心布置、广泛宣传，坚持发扬民主，坚持依法办事，严格依法按程序操作，做实做细换届选举每个环节的工作，圆满完成本次人大选举的各项工作。

刘芸瑞

## 上海有机所“魅力有机化学”科普拓展课程第三、四课在南洋中学顺利开展



近日，中国科学院上海有机化学研究所“魅力有机化学”科普拓展课程第三、四课在南洋中学顺利开展。

第三讲课程的内容是《化学中的手性》，由来自生命有机化学国家重点实验室汤文军课题组的科普志愿者陈远和杨贺讲授。课程分两个部分进行。前半节中，杨贺以“左手和右手非常相像却不能完全重叠”这一实例为切入点，向学生们阐释了化学中的手性现象，即实物与其镜像不能完全重叠的现象，让大家对手性的概念有了初步的了解。随后又通过列举几个常见的具有手性的实物，让同学们认识到手性物体广泛存在于我们的日常生活中。杨贺引入了“不对称合成”的概念，通过介绍2001年诺贝尔化学奖的介绍，让同学们认识到不对称催化反应的重要性。课程陈远还通过实验让大家认识与重结晶密切相关的“溶解度”的概念。

本次拓展课程在同学们所学习的混合物与纯净物，溶解度的相关知识的基础上进一步结合科学研究实际和工业应用展开，开阔了同学们的视野，同时也让大家更深入的了解化学在日常生活和社会发展中所发挥的作用。

第四讲课程的主题是《神奇的糖化学》，由来自生命有机化学国家重点实验室的科普志愿者徐鹏、郭政和尹雪健讲授。徐鹏博士通过讲解，让同学们了解到糖不仅仅是作为食品提供能量这么简单：生物体骨架结构的主要成分是糖，自然界中植物细胞壁的组成成分中有糖类，人体内有糖蛋白，连大闸蟹坚硬的外壳也是一种多糖物质；糖还可以入药，治疗各种疾病。课程中还演示了演示糖类物质的鉴别实验——莫利施氏试验（Molisch's Test）、谢里瓦诺夫试验（Seliwanoff's Test）、淀粉碘实验。

此次科普课程，不仅让同学们在轻松有趣的氛围中认识糖化学、了解糖化学，还深深激起了同学对科学实验热情和对科学知识的追求！

杨慧娜

(上接第1页)从事博士后研究。目前任法国斯特拉斯堡大学超分子科学与工程研究所超分子化学实验室和德国卡尔斯鲁厄理工学院纳米技术研究所主任，法国巴黎法兰西学院和斯特拉斯堡大学退休教授，法国科学院院士，以及中国科学院、美国国家科学院等二十多个国家或地区科学院的外籍院士。

Jean-Marie Lehn是最早从事超分子化学研究的化学家之一，他的早期研究奠定了“分子识别”的化学基础，即从化学和生物学的基础上认识分子识别的本质和过程及其在化学和生物科学中的应用。他第一个提出了“超分子化学”概念，被誉为“超分子化学”之父，并由于在该研究领域的杰出贡献获得了1987年诺贝尔化学奖。数十年来，Jean-Marie Lehn的研究涉猎甚广，如超分子化学领域中的穴醚、分子识别、阴离子配位化学、超分子催化、超分子材料、动态共价化学以及程序化的化学系统等。此外他在理论有机化学，生物有机化学和动态核磁共振等领域也做出了重要贡献。Lehn教授迄今为止共发表论文920余篇，著有三部专著，其中《超分子化学》一书被翻译为法语、葡萄牙语、俄语、日语和汉语，被称为超分子科学领域的“圣经”。朱影 赵新