



有机简讯

1

内部刊物，注意保存 • 本期四版，本月二十五日出版 • SIOC NEWS • 2020年第1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

上海有机所战略规划

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 上海有机所成果“氧化氟烷基化反应”荣获2019年度国家自然科学二等奖..1**
- 2 上海有机所马大为研究员被授予2019年度中国科学院杰出科技成就奖.....1**
- 3 吴奇院士应邀来上海有机所作“黄耀曾科学与人文讲座”2**
- 4 基于中药抗疟疾新药研发项目获得比尔及梅琳达·盖茨基金会支持.....2**
- 5 上海有机所发现视觉皮层回路中兴奋-抑制平衡的节律性振荡.....3**
- 6 上海有机所三位研究员获评2019年首届“拜耳学者奖”3**
- 7 上海有机所举办2019年党支部书记培训.....4**
- 8 分享科研感悟，共享成长经历——记“研途—分享荟”第一次青年沙龙成功举办.....4**
- 9 上海有机所成功举办第三届所地标定向越野比赛.....4**

上海有机所成果“氧化氟烷基化反应”荣获2019年度国家自然科学二等奖



中共中央、国务院1月10日上午在北京人民大会堂隆重举行国家科学技术奖励大会。习近平、李克强、王沪宁、韩正等党和国家领导人出席大会并为获奖代表颁奖。习近平为国家最高科技奖获得者黄旭华、曾庆存颁奖。由上海有机所卿凤翎等人完成的“氧化氟烷基化反应”项目荣获本年度国家自然科学二等奖，卿凤翎作为获奖代表出席会议领奖，项目组其他获奖人员也一同参加了奖励大会。

“氧化氟烷基化反应”在科技部、国家自然科学基金委、中科院和上海市科委的资助下，围绕含氟基团的高效引入这一挑战性课题，提出了“氧化三氟甲基化反应”的新概念，发展了一系列氧化三氟甲基化、氧化三氟甲硫基化、氧化二氟亚甲基化、以及烯烃氧化三氟甲基双官能团化等新反应，取得了具有国际领先水平的原创性研究成果：

1. 首次提出“氧化三氟甲基化反应”新概念，并被国内外同行广泛应用。在过渡金属和氧化剂的调控下，利用廉价易得的亲核三氟甲基化试剂（三氟甲基）三甲基硅烷(Me_3SiCF_3)，实现了多类亲核底物（包括碳氢键）的直接三氟甲基化反应，高效和高选择性构建了一系列三氟甲基类炔烃、芳烃、烯烃、烷烃以及芳基醚化合物。该反应突破了传统三氟甲基反应中亲核三氟甲基化试剂只与亲电底物反应的限制，为含三氟甲基化合物的合成开辟了一个全新的方向，极大的拓展了底物类型，丰富了官能团兼容多样性，提高了反应效率。

2. 进一步拓展了“氧化三氟甲基化反应”概念，实现了氧化三氟甲硫基化反应和氧化二氟亚甲基化反应。利用硫粉和（三氟甲基）三甲基硅烷现场生成亲核三氟甲硫基试剂的策略，成功解决了亲核三氟甲基硫试剂制备难及不稳定等难题，实现了温和反应条件下炔烃与硼酸等底物氧化三氟甲硫基化反应，为向有机化合物引入三氟甲硫基提供了新策略和新方法。实现了铜参与炔烃等氧化二氟亚甲基化反应，高效构建系列含二氟亚甲基有机化合物。

3. 发展了银催化烯烃氧化氢化三氟甲基化反应，实现了高度 （下转第3页）

上海有机所马大为研究员被授予2019年度中国科学院杰出科技成就奖

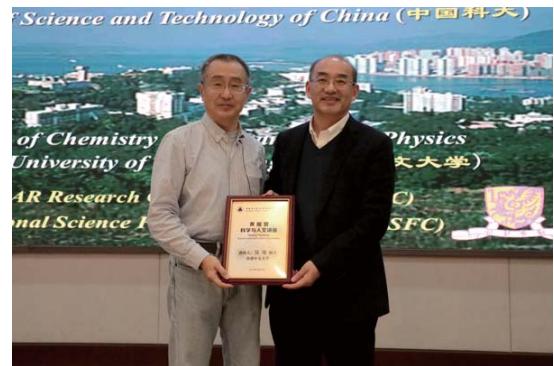
根据《中国科学院杰出科技成就奖条例》、《中国科学院杰出科技成就奖条例实施细则》（科发规字[2019]7号），经中国科学院杰出科技成就奖评审委员会评审，上海有机所马大为研究员被授予2019年度中国科学院杰出科技成就奖。

马大为在合成方法学和生物活性分子的高效创制方面做出系统性和原创性的贡献。针对铜催化的碳-杂原子键偶联反应，发展了氨基酸和草酰二胺两代配体，突破了反应条件苛刻和普适性差的局限，得到上千次应用，包括两个药物的工业化生产，被国际同行评价为“现代药物发现最常用的方法之一”，“每天都要用的反应”。发展了以曲贝替定为代表的多个药物和活性天然产物的高效合成路线，其中曲贝替定的合成路线已经进入工业化生产，为这个被认为是“最难制备的两个抗肿瘤药物之一”提供了更加简洁、经济的方法。发现了一些药物先导化合物，其中有两个候选药物分别在欧洲和中国进入一期临床实验。为我国合成化学的发展做出了基础性贡献。



林芳

吴奇院士应邀来上海有机所作“黄耀曾科学与人文讲座”



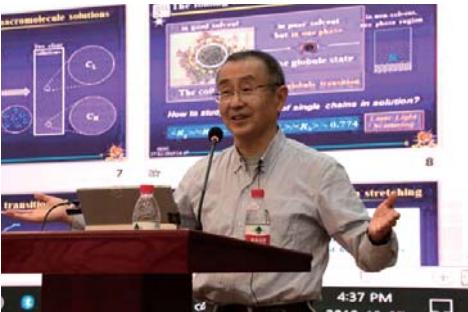
12月27日下午，上海有机所“黄耀曾科学与人文讲座”在君谋楼报告厅举行，讲座特邀中国科学院院士、香港中文大学吴奇教授作题为“从‘何为基础研究？’谈起……”的报告，上海有机所所长唐勇院士主持此次讲座，并为吴奇颁发了讲座纪念证书。上海有机所的院士、领导班子、科研人员、管理人员和研究生等300余人到场听讲。

报告中，吴奇通过分析科学研究过程中所遇到的“问题”、“疑问”与“询问”的区别，切入主题“何为基础研究”，指出研究的目的是解决问题而不仅仅是发表论文。他结合几十年丰富的科研经历，进一步详细阐述了自己对基础研究的观点和见解。吴奇鼓励科研人员：在生活中要不忘追求理想，正所谓“岁寒‘知’松柏、事难‘识’君子”，做基础研究要努力在知识上有贡献，创造知识并应用知识，这样才能实现知识创新，做出可以写入教科书的不朽成果。

吴奇深入浅出、形象生动的讲解令现场师生受益匪浅，赢得了大家雷鸣般掌声。在提问环节，吴奇与师生就感兴趣问题进行进一步探讨交流、答疑解惑。

唐勇代表全所师生感谢吴院士的精彩报告，赞扬报告立意深远，引人深思，尤其是报告中提到的两次科研方向的拓展和思想转换，相信会给予对在座的科研人员很好的启发，希望大家能够领悟报告精髓，努力解决问题，做好基础研究。

“黄耀曾科学与人文讲座”是为了纪念我国已故的著名有机化学家、我国有机氟化学学科奠基人之一、我国金属有机化学学科开拓者之一、中国科学院院士黄耀曾先生而于2012年设立。该讲座旨在通过邀请知名专家、学者来演讲，从科学与人文的角度研究国家战略问题，从国家战略的高度探讨科学与人文的发展，致力于自然科学与人文社会科学的结合，致力于科学精神和人文精神的贯通，以拓宽有机所年轻科学家的学术视野，提升综合文化素养。吴奇院士是上海有机所“黄耀曾科学与人文讲座”的第五位演讲者。此前，中国科学院院士、国际纯粹与应用化学联合会（IUPAC）主席、北京大学周其凤教授，中国工程院院士、华东师范大学校长钱旭红，中科院原党组副书记、中科大党委书记郭传杰，中科院原党组副书记方新都曾应邀作“黄耀曾科学与人文讲座”。
朱影



报告中，吴奇通过分析科学研究过程中所遇到的“问题”、“疑问”与“询问”的区别，切入主题“何为基础研究”，指出研究的目的是解决问题而不仅仅是发表论文。他结合几十年丰富的科研经历，进一步详细阐述了自己对基础研究的观点和见解。吴奇鼓励科研人员：在生活中要不忘追求理想，正所谓“岁寒‘知’松柏、事难‘识’君子”，做基础研究要努力在知识上有贡献，创造知识并应用知识，这样才能实现知识创新，做出可以写入教科书的不朽成果。

吴奇深入浅出、形象生动的讲解令现场师生受益匪浅，赢得了大家雷鸣般掌声。在提问环节，吴奇与师生就感兴趣问题进行进一步探讨交流、答疑解惑。

唐勇代表全所师生感谢吴院士的精彩报告，赞扬报告立意深远，引人深思，尤其是报告中提到的两次科研方向的拓展和思想转换，相信会给予对在座的科研人员很好的启发，希望大家能够领悟报告精髓，努力解决问题，做好基础研究。

“黄耀曾科学与人文讲座”是为了纪念我国已故的著名有机化学家、我国有机氟化学学科奠基人之一、我国金属有机化学学科开拓者之一、中国科学院院士黄耀曾先生而于2012年设立。该讲座旨在通过邀请知名专家、学者来演讲，从科学与人文的角度研究国家战略问题，从国家战略的高度探讨科学与人文的发展，致力于自然科学与人文社会科学的结合，致力于科学精神和人文精神的贯通，以拓宽有机所年轻科学家的学术视野，提升综合文化素养。吴奇院士是上海有机所“黄耀曾科学与人文讲座”的第五位演讲者。此前，中国科学院院士、国际纯粹与应用化学联合会（IUPAC）主席、北京大学周其凤教授，中国工程院院士、华东师范大学校长钱旭红，中科院原党组副书记、中科大党委书记郭传杰，中科院原党组副书记方新都曾应邀作“黄耀曾科学与人文讲座”。

基于中药抗疟疾新药研发项目获得比尔及梅琳达·盖茨基金会支持

中国科学院上海有机化学研究所联合中国疾控中心、然晟（上海）实业发展有限公司开展的基于中药抗源的疟疾防控新药研发项目近期获得比尔及梅琳达·盖茨基金会支持。中国科学院上海有机化学研究所主要承担该项目传统中药源抗疟疾药物活性分子筛选、活性预测、分子结构设计及改造和活性分子合成工艺开发等工作，主要由姜标课题组和姚建华课题组完成。

疟疾是全球关注的重要公共卫生问题之一，据世界卫生组织统计，每年新发病例高达2亿多。我国积极响应联合国提出在全球根除疟疾的倡议，于2010年制定了《中国消除疟疾行动计划（2010—2020年）》，自2016年8月起首次实现无本地疟疾感染病例报告，即将成为全面消除疟疾的国家，我国消除疟疾的工作模式已被正式写入世卫组织的技术文件，向其他国家推广。我国也因中药源抗疟疾药物青蒿素的研究及在全球抗疟中的重大贡献获得2015年诺贝尔生理学或医学奖。虽然我国抗疟工作取得突破性进展，但全球疟疾形势仍不容乐观，尤其是疟原虫抗药性问题使全球抗疟面临更大威胁，研制新型高效疟疾防治药物尤为急迫。

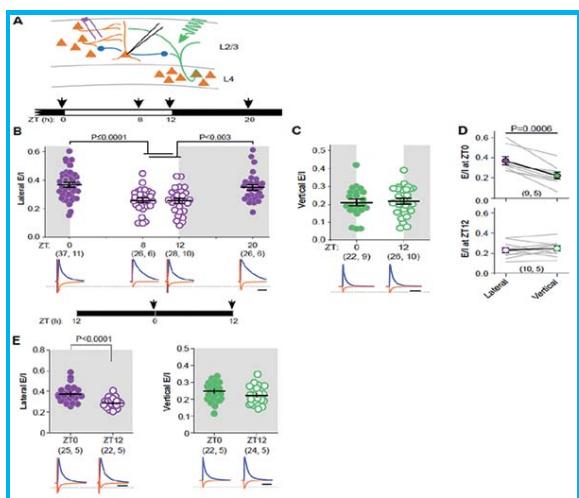
蚊虫叮咬为疟疾传播主要途径，有效切断蚊虫传播是疟疾防治主要手段，中国自古以来就使用中药驱杀蚊虫。中药作为中国五千年历史和文化的精粹，具有天然、绿色、抗药性少等优势，结合中国科学院上海有机所在计算机辅助的药物设计（具有自主知识产权的中药材及其物质基础的信息查询系统和化合物性质预测系统）和药物分子结构设计及合成工艺开发方面的优势、中国疾控中心在抗疟疾药物开发及疟疾防控方面的优势、然晟（上海）实业发展有限公司与世界卫生组织在抗疟方面长期的良好合作优势，三方决定联合比尔及梅琳达·盖茨基金会共同开展基于传统中药源的疟疾防控新药研制。

三方团队经过一年多的筹备后于2019年6月和7月分别在澳大利亚悉尼和英国利物浦两次向比尔及梅琳达·盖茨基金会汇报项目方案并获得基金会的认可。2019年9月比尔及梅琳达·盖茨基金会对三方通过实地走访考察后，更加坚定了基金会与三方联合开展该项目的信心并同意立项支持。
邢萍



上海有机所发现视觉皮层回路中兴奋-抑制平衡的节律性振荡

中国科学院上海有机化学研究所生物与化学交叉研究中心何凯雯研究员团队联合约翰霍普金斯大学Alfredo Kirkwood团队首次发现神经元的兴奋与抑制之间的平衡关系(E/I平衡)在昼夜周期中呈现出节律性振荡。通过进一步研究发现该振荡具有神经环路特异性，并受到睡眠/觉醒经历的紧密调控，脑内源大麻素是介导该调控的关键分子。题为“Daily Oscillations of the Excitation-Inhibition Balance in Visual Cortical Circuits”的研究论文于12月9日发表在学术期刊《神经元》(Neuron) (<https://doi.org/10.1016/j.neuro.2019.11.011>)



上。约翰霍普金斯大学Michelle Bridi与中科院上海有机所生物与化学交叉研究中心宗方皎为共同第一作者，何凯雯与Alfredo Kirkwood为共同通讯作者。

神经元对信息的处理和传播依赖于谷氨酸能这类兴奋性突触传递神经信号，同时也依赖于 γ -氨基丁酸(GABA)能这类抑制性突触对信号传导进行时间和空间上的限制。如同油门与刹车的配合决定了车辆能否安全正确地行驶，神经元的兴奋与抑制之间的平衡关系(E/I平衡)是决定神经元及神经网络功能发挥的关键因素，可以影响动物的社会行为和感官知觉表现。同时，大量研究发现E/I平衡与各类神经系统疾病也密切相关。因此，了解E/I平衡的调控机制对认识脑功能调控及相关脑疾病至关重要。

关于神经元E/I平衡的调控，目前的主流观点认为通过快速的可塑性调节机制，神经元可以保持E/I平衡的稳定，从而保证神经元功能的正常发挥。然而，就像汽车在不同的驾驶场景中，如高速公路vs市内主干道，油门与刹车的使用比例显然不同，大脑在一天中会经历不同的生理状态，其信息处理需求也并不一致。在上述工作中，研究人员揭示了E/I平衡的全新调控方式与可能机制，发现昼夜间神经元的E/I平衡存在一个作用缓慢的周期性调控机制，该机制可以大幅度地改变E/I平衡在不同时期的定值。这与目前已知的依赖于可塑性来快速稳定E/I平衡并不矛盾，前者需要在昼夜转换后数小时才能实现，而后者则在若干分钟甚至更短的时间内发生。研究人员认为，E/I平衡在达到新的定值后将在同周期的余下时间内保持稳定，此时很可能就是采用可塑性的调控机制。

上述工作获得了中科院和国家自然科学基金委的支持。

何凯雯

上海有机所三位研究员获评2019年首届“拜耳学者奖”

2019年上海有机所首届“拜耳学者奖”申请信息发布后，得到了各位研究员的大力支持和踊跃报名。经过慎重讨论和投票，最终由上海有机所、拜耳处方药研发部门和中国创新中心组成的联合委员会共同决定，李昂、刘国生、沈其龙三位研究员获评2019年首届“拜耳学者奖”。

合作项目介绍

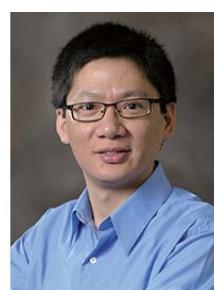
2016至2018年，中科院上海有机所和拜耳进行了为期三年的战略合作协议，开展一系列创新有机化学药物研发合作。鉴于第一期战略合作协议的成功执行，上海有机所与拜耳签署了第二期战略合作协议，并于2019年4月正式生效。在该协议框架下，拜耳公司继续支持双方的合作研究，并设立了“拜耳学者奖”，以鼓励和表彰在有机化学药物研发方面做出突出贡献的优秀研究员。



生命有机化学国家重点实验室
李昂研究员
研究方向：天然产物全合成



金属有机化学国家重点实验室
刘国生研究员
研究方向：过渡金属催化



中科院有机氟化学重点实验室
沈其龙研究员
研究方向：亲电氟烷基化试剂
/金属有机氟化

关于拜耳中国创新中心

拜耳中国创新中心是拜耳处方药研发部门下属负责外部合作研发的团队，旨在通过与中国优秀科学家和工业界的合作，共同推进创新药物的早期研发。

联系方式：Innovation.China@bayer.com。

(上接第1页) 专一性烯烃净氟仿加成反应。发展了铜催化未活化烯烃的氧化脱氢及氧化羟化三氟甲基化反应，实现了含三氟甲基基团的复杂烷烃化合物的高效合成。

氧化氟烷基化反应引领了近几年国内外三氟甲基化反应及三氟甲硫基化反应的研究。“氧化三氟甲基化反应”受到美国化学会Chemical & Engineering News封面论文报道，被称为“卿氟化反应”。氧化氟烷基化新反应被国内外30多个课题组应用于含氟化合物合成及发展新氟化试剂。8篇代表性论文他引1519次，项目执行阶段培养博士22名，项目第一完成人在国内外学术会议上作大会或邀请报告50次，项目研究成果对有机氟化学及药物化学领域具有重要意义，极大地推动了有机化学的研究与发展。

李蓉

上海有机所举办2019年党支部书记培训



12月23日下午，上海有机所党委在君谋楼第一会议室举办2019年党支部书记培训。切实贯彻落实党中央及院党组要求，深入学习党的十九届四中全会精神，不断提升党支部的领导能力、管理能力、育人能力和服务能力，推进党支部工作标准化规范化建设。所两委委员、党支部书记、支部委员参加培训，党委书记胡金波主持培训会。



会上，胡金波作“以提升组织力为重点，加强和改进研究所党建工作”及年度党风廉政建设专题报告。他结合自身工作体会着重介绍了院党组关于提升研究所党组织的政治引领力、组织推动力、文化凝聚力、自我革新力相关内容及要求，并对十九届四中全会精神学习、党组织标准化规范化建设等研究所下一阶段党建工作重点做了相应部署。同时从进一步贯彻落实中央八项规定精神、科研诚信建设的形势和要求、上海有机所重点领域“负面清单”（暂行）三个方面汇报了研究所年度党风廉政建设情况。



培训邀请杨浦区委党校副教授、上海东方讲坛讲师、“中国梦”优秀宣讲员孙爱霞作“十九届四中全会精神及基层党组织组织力建设”专题报告。她结合建国70年来我国取得的伟大成就，从理论层面解读了党的十九届四中全会召开的重要意义，以及全会坚持和完善中国特色社会主义制度、推进国家治理体系和治理能力现代化的两大核心内容。同时从实践角度讲述了基层党组织组织力建设的重要性、要素分析、提升路径，让大家对四中全会精神以及组织力建设有了更加深入的了解和领会，为下一阶段党建工作开展提供了很好的启示和指导。

参会人员还就党支部组织力提升及支部下一步工作进行了交流和探讨。

胡金波希望大家在今后的工作中能够主动学习了解、思考把握党的十九届四中全会精神及党和国家党风廉政建设与反腐败工作形势与要求，立足岗位抓好落实，起好示范带头作用，带动引导其他党员、干部进一步提高政治站位，为全力推进研究所科研创新中心工作和“一体两翼”战略布局提供坚实的思想和组织保障。

刘芸瑞

分享科研感悟，共享成长经历——记“研途-分享荟”第一次青年沙龙成功举办



12月19日，由人力资源处和青年创新促进会共同举办了主题为“分享科研感悟，共享成长经历”的青年沙龙。来自各研究室的33位青年科研人员、青促会成员、博士后、研究生等参加了本次活动。



本次沙龙邀请了中科院能量调控重点实验室主任吕龙研究员和金属有机国家重点实验室孙秀丽研究员前来分享。吕龙研究员结合多年科研经历和自身阅历，为青年人展现了多条科研人员的发展路径，鼓励青年人尽快找准定位和目标，借助所在平台发挥和积蓄力量，不拘泥于自身专业和现有成果，要开拓思路、不断努力、追求卓越。孙秀丽研究员回顾了人近20年来的经历，从最初的迷茫、如何一步步选择并坚持梦想，到如何融入平台并发挥自己的力量，强调了所里平台的特殊性及其提供的资源、机会和力量。



随后，在人力资源处杨慧娜处长的主持下，青年人员进行了更进一步的交流，针对明确发展定位、如何利用平台、走出舒适区等方面，探讨了许多目前自身和所在团队发展的困惑和困境，也为所内青年骨干的发展提出了一些建议。

“研途-分享荟”沙龙活动为所里青年骨干提供了交流和沟通的平台，同时也增进了他们之间的友谊和了解。希望青年骨干能借助这个平台上，分享科研感悟、共享成长经历，为规划自身事业发展提供帮助。

杨慧娜

上海有机所成功举办第三届所地标定向越野比赛



为了促进同学之间的交流，丰富有机所课余生活，12月7号下午，由研究生会体育部主办的上海有机所第三届所地标定向越野比赛正式拉开帷幕。



此次比赛精心设计的五个关卡：“益智小游戏”、“垃圾分类小精英&抱团搬运工”、“顶上花环”、“口口相传”、“意面挑战”，以及一个主线任务：“缺一不可”。活动要求队员们相互协作的同时积极开发脑洞，遇到关卡需要先进行分析判断再动手操作，不能单纯靠蛮力来提高闯关速度，充分体现了体力与智力相结合的重要性。

比赛中，大家分秒必争，根据信封中的谜语线索和关卡信息找到闯关地点并完成挑战。同学们在完成游戏挑战的过程中，分工明确，互相配合，充分发挥出团结协作精神，根据游戏规则各展所长，开发脑洞，创造性地完成比赛，很好地展现了有机所学生不拘一格的创新思维。在活动中，大家争分夺秒完成比赛的同时，又眉欢眼笑地享受着比赛，体现出了大家友谊第一，比赛第二的良好心态。最终，本次比赛的一等奖由李博文、彭鹤年、李铁钧三位同学获得，二等奖由方林玄、王彩云、代梦露三位同学获得，三等奖由陈琦、蒋舒岩、许瑶、徐文琦、胡维强、杨斌六位同学获得。活动让同学们在学习工作之余能够更好的放飞心情，享受运动带来的乐趣。

此次活动感谢研究生部老师的指导，感谢上海浩鸿（乐研品牌）的大力支持。

郝同港