



| 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 | 上海有机所召开新一届党委纪委领导班子宣布会.....1 |
| 2 | 上海有机所在不对称氧化偶联反应合成平面手性二茂铁衍生物研究方面取得进展.....2 |
| 3 | 上海有机所高效集成合成胆甾醇类天然产物研究取得新进展.....2 |
| 4 | 上海有机所举行2016年反腐倡廉报告会.....3 |
| 5 | 上海有机所志愿者参加社区学雷锋爱心义卖活动.....3 |
| 6 | 上海有机所举办“炫动有机Show”儿童趣味摄影大赛.....4 |

上海有机所召开新一届党委纪委领导班子宣布会

2月29日上午，上海有机所在君谋楼第1会议室召开新一届党委纪委领导班子宣布会。中科院上海分院分党组书记、副院长、沪区党委书记王建宇，组织人事处处长姚娅平，上海市科技党委组织干部处赵泉，以及所领导班子成员、两委委员、党员研究员、管理和支撑部门负责人、支部书记出席会议。会议由姚娅平主持。

王建宇首先宣读了中科院党组关于胡金波、刘菲同志的任职通知：胡金波同志任上海有机所党委副书记（主持工作），刘菲同志任上海有机所党委副书记兼纪委书记。

胡金波在会上发言感谢上级党组织与有机所党委对自己的信任和支持。他认为，上届党委的工作为本届党委工作的开展奠定了良好基础。当前研究所发展良好，但仍然面临挑战。因此，要进一步发挥党委政治核心作用，凝心聚力、党政合力，积极围绕“率先行动”计划和“一三五”规划，补足短板，推动研究所各项工作再上一个台阶。



刘菲也对上级党组织和有机所对自身的帮助与培养表达了诚挚谢意。她表示自己重任在肩，今后将会虚心学习，认真贯彻“三严三实”要求，踏踏实实、努力力地工作，更好地服务中心工作以及“一三五”规划实施和卓越中心建设。为营造风清气正、团结和谐的研究氛围添砖加瓦，不辜负组织的信任与期望。

丁奎岭所长代表行政班子对两位同志表示祝贺，同时对上届党委书记郑静芳、纪委书记马大为同志所做的大量工作表示感谢。他强调，在新的形势下，新一届班子要在“十三五”规划的关键之年积极谋划，围绕2016年研究所的创新发展任务——“十三五”规划落地、卓越中心建设以及B类先导专项申请等创新工作，抓住机遇、齐心协力、共同推进。所行政班子也将会全力以赴支持“两委”工作，党政合力推动研究所中心工作迈上新的台阶。

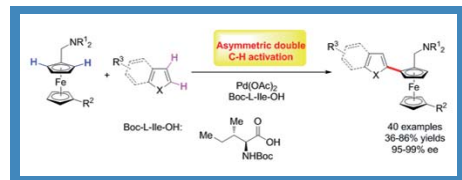
王建宇在总结讲话中对有机所上一届党委纪委工作与研究所自身干部培养方面取得的成绩给予充分肯定。他指出，“两委”班子成员现已配备齐全，希望新一届班子能够继承有机所优良传统，挑好担子、积累经验、与时俱进，认真履行职责、做好监督保障，在助推“率先行动”计划和科创中心建设过程中发挥更大的作用。

刘芸瑞



上海有机所在不对称氧化偶联反应合成平面手性二茂铁衍生物研究方面取得进展

二茂铁化合物在材料化学、有机合成和药物化学等领域中起着重要作用。尤其是含有平面手性的二茂铁类化合物，在不对称催化反应中作为手性配体或者催化剂得到了广泛研究，其中一些已经在工业上实现了大规模应用。因此，在二茂铁骨架上发展高效引入平面手性的方法具有重要意义。

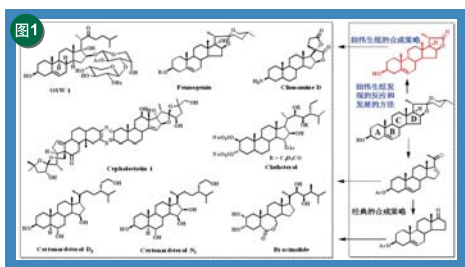


中国科学院上海有机化学研究所金属有机化学国家重点实验室游书力小组一直致力于研究不对称碳氢键官能团化反应(Asymmetric Functionalization of C-H Bonds, RSC: Cambridge, UK, 2015)。2013年，该课题组首次使用醋酸钯和廉价易得的氨基酸Boc-L-Val-OH为催化体系，实现了二茂铁底物和芳基硼酸的不对称碳氢键芳基化反应，以良好的收率和优秀的对映选择性构建了平面手性芳基二茂铁(*J. Am. Chem. Soc.*, **2013**, 135, 86)。2014年，他们从简单易得的二茂铁底物出发，使用醋酸钯和商业可得的(R_q)-BINAP为催化体系，实现了分子内碳氢键芳基化反应。对于不同的底物，反应以优秀的收率得到近光学纯的平面手性二茂铁化合物，即使催化剂用量降低至千分之五，反应也能获得99%收率和96% ee对映选择性，该方法学也可用于平面手性配体的合成(*J. Am. Chem. Soc.*, **2014**, 136, 4841)。

最近，该小组通过使用醋酸钯和Boc-L-Ile-OH为催化体系，成功地实现了第一例不对称氧化交叉偶联反应(*J. Am. Chem. Soc.*, **2016**, 138, 2544)，该反应使用二茂铁甲胺和富电子芳杂环为底物，经过两个碳氢键官能团化过程，不需要对任何一个底物预官能团化，就可以实现平面手性二茂铁化合物高效、高对映选择性合成。反应以空气为氧化剂，避免了金属氧化剂的使用，符合绿色化学的理念。值得注意的是，该反应以专一的区域选择性控制得到近光学纯的平面手性二茂铁化合物。该方法学为平面手性二茂铁化合物的合成提供了一条高效的途径，对于平面手性配体和催化剂的设计 and 合成具有重要的意义。该研究工作受到了美国化学会《化学与工程新闻》周刊(Chemical&Engineering News)的关注，在2016年3月14日出版的一期杂志中以“Dual C-H/C-H asymmetric cross-coupling unveiled”为题对该工作进行了介绍。

游书力

上海有机所高效集成合成胆甾醇类天然产物研究取得新进展



中国科学院天然产物有机合成化学重点实验室田伟生课题组合发展的，从甾体皂甙元合成甾体-16-羟基-22-酸内酯的方法以及用其合成天然甾醇化合物的新策略，为具有挑战性的天然甾醇化合物合成开启了一扇大门。

胆固醇是人体和动物体内的重要内源物质，在人体脑和神经组织中胆固醇含量高达百分之二，它是人体和动物体细胞膜的基本组织部分，也是人体和动物体内各种甾体激素的基本合成原料。在自然界已经发现的含胆固醇基本骨架的甾体化合物有上千种之多，它们或来自陆地生物体内，或来自海洋生物体内。它们具有多种多样的生物活性，是发现新药的重要先导化合物。但是这类分子由于其在自然界生物体内含量极低，无法通过提取分离方式满足它们生物活性和构效关系研究的需要，为此发展高效、集成合成特别是能有工业规模前景的胆甾醇类天然产物的方法成为有机合成化学家的挑战性任务之一。

众所周知，胆甾醇类天然产物属于甾族化合物中结构比较复杂的种类，虽然经过有机合成化学家艰苦努力，从已知简单化工原料合成甾族化合物基本骨架的策略至今难以推广应用。目前仍然沿袭以易得的天然甾醇为起始原料的半合成策略。常见用于合成胆甾醇类天然产物的原料有大豆甾醇、麦角甾醇、胆酸和甾体皂甙元，其中甾体皂甙元产量最大，一直作为是我国甾体药物工业的基本原料。文献上已报道的利用大豆甾醇、麦角甾醇和胆酸合成胆甾醇类天然产物的策略和方法是首先降解它们成为相应的胆甾-22-醛，然后引入相应的侧链，此等合成策略不适合其D环上有官能团的分子。文献报道利用甾体皂甙元合成胆甾醇类天然产物的策略和方法是：通过修饰其相应氧化降解产物孕烯酮醇或去氢表雄酮的D环并引入相应侧链，但步骤繁多、路线冗长、效率低下。甾体-16-羟基-22-酸内酯其C16-羟基可用于D环修饰改造，C22-内酯可用于侧链合成，是高效、集成合成胆甾醇类天然产物最理想的关键合成中间体(图1)。

针对发展高效合成胆甾醇类天然产物策略和方法，田伟生课题组早在上世纪九十年代初就开展了转化甾体皂甙元成为相应的甾体-16-羟基-22-酸内酯的研究。经过不懈努力发现卤素，特别是碘可以作为“开关”改变甾体皂甙元C22-缩酮Beayer-Villiger重排反应的原有区域选择性，实现了高效地转化甾体皂甙元成为相应的甾体-16-羟基-22-酸内酯(图2)(中国专利CN 1299821, 2000; *Chem. Abstr.*, **2003**, 136, 340870)。

在获得这一专利方法后，该课题组进一步合成一系列甾体-16-羟基-22-酸内酯并应用于一些具有代表性的重要胆甾醇类天然产物的合成(如图1所示)。他们先后已经利用甾体-16-羟基-22-酸内酯为关键合成中(下转第4页)

上海有机所举行2016年反腐倡廉报告会

3月17日上午，上海有机所在君谋楼一楼报告厅举行2016年反腐倡廉报告会，所领导班子成员、两委委员、全体研究员、全体机关管理人员、党支部书记、各民主党派负责人、群众组织负责人、各课题组主要报销人员等近200人参加了会议。大会由党委副书记兼纪委书记刘菲主持。

中科院监审局局长李定做了题为“防控风险守净土、恪守廉洁促创新”的报告。他从大家所熟悉的“不敢腐、不能腐、不想腐”三方面介绍了中央和中科院反腐倡廉建设所面临的严峻挑战、落实“两个责任”的紧迫性、重要性，同时他还详细剖析了各研究所在科研经费使用、基本建设、“四风”等方面违反中央八项规定精神、“小金库”、关联交易等领域内发生的多起案例。引经据典提醒大家尤其是党员和领导干部要能抵制诱惑，加强党性和道德修养。李定局长的报告紧密结合中科院实际，具有很强的针对性。他以一位了解纪监审工作的科研人员身份跟大家沟通交流，内容丰富、语言诙谐，为大家上了一堂生动务实的反腐倡廉教育课。

刘菲在最后的总结发言中希望大家听取了李定局长的报告后，能进一步加深对中央和中科院反腐形势的认识，在日常工作、生活中筑牢思想防线，为构建我所风清气正的科研环境共同努力。



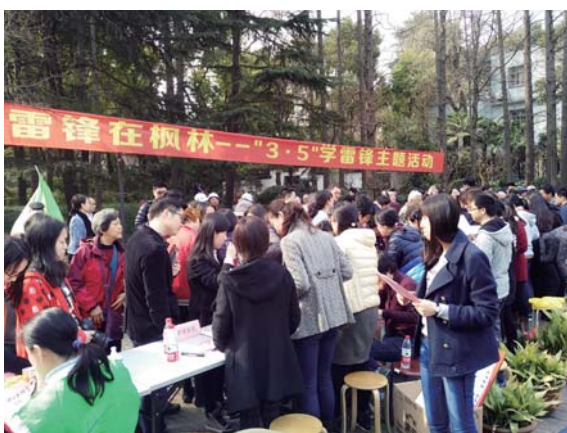
余冰

上海有机所志愿者参加社区学雷锋爱心义卖活动

在“3.5”学雷锋日来临之际，为弘扬雷锋精神，践行社会主义核心价值观，为城市文明共建贡献力量，3月4日上午，上海有机所组织了多名青年志愿者，积极参与社区“雷锋在枫林”爱心义卖活动。

上午9点钟，有机所的学雷锋志愿者服务队来到了位于中山南二路的东安公园活动主会场，带来了为此次义卖活动精心准备的“爱心物品”——小绿植，品种包括幸福树、长寿花等十几个品种的精美小绿植，这些绿植有净化空气、美化生活，缓解眼睛疲劳等作用，令人赏心悦目，获得了大家的喜爱，短短一个多小时

的义卖，社区居民和区域单位的职工纷纷奉献爱心，50余盆爱心绿植变为近千元帮困善款，成功捐赠给上海市慈善基金会。上海有机所志愿者通过义卖筹集善款，奉献爱心，汇聚正能量的同时，也展现了有机所科技青年积极向上的良好精神面貌。



近年来，有机所党委通过参与社区区域化大党建活动，带领全所积极投身到社区的文明共建活动中来，充分发挥自身优势特点，配合社区党工委参与社区的管理和建设，为城市文明建设和社会发展贡献我们的力量。

林芳

上海有机所举办“炫动有机Show”儿童趣味摄影大赛



29号萌娃；“最时尚宝宝”——40，41号萌娃；“最搞怪宝宝”——11，35号萌娃；“最开怀宝宝”——37，63号萌娃；“最甜美宝宝”——22，42号萌娃；“最具创意宝宝”——52，70号萌娃。

此次儿童趣味摄影比赛，作为上海有机所“炫动有机Show”系列活动之一，给有机所热爱摄影，用心记录生活点滴的父母们提供了一个展示自我的舞台，通过此次活动，大家积极交流摄影技巧，带娃经验，享受宝宝们带给生活的无限精彩！

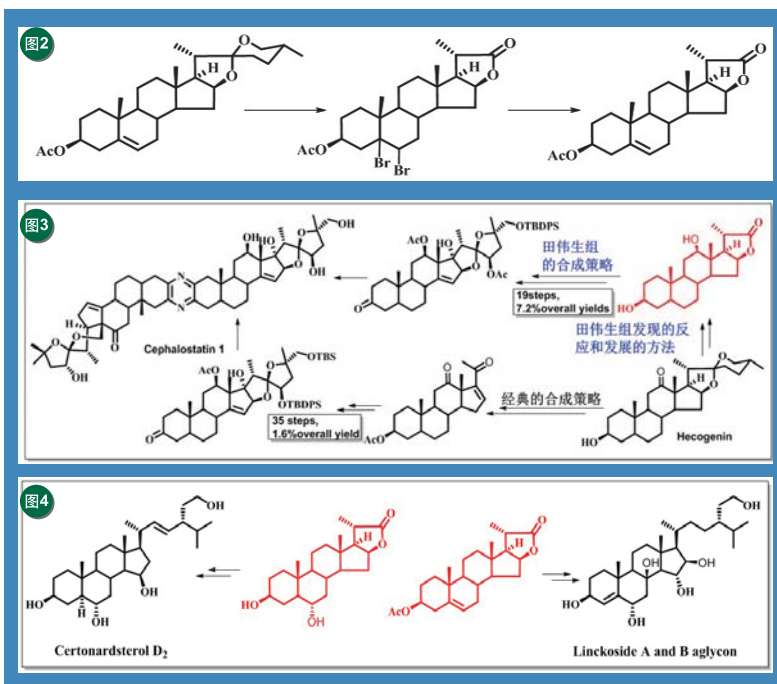
为庆祝“三八”国际劳动妇女节，上海有机所妇委组织了“炫动有机show”暨2016年上海有机所儿童趣味摄影比赛。3月7日、8日中午，参赛的70幅儿童摄影作品在有机所图书馆楼前展出。

原本阴霾的天气也突然阳光明媚起来，参与投票的观众们不禁调侃到这是真正的“晒”娃呀！每张照片都有自己的故事，宝宝们有的虎头虎脑、呆萌可爱；有的调皮捣蛋、率真无邪；有的天真烂漫、帅气十足。童年只有一次，成长不会再来，一张张照片定格了孩子炫彩多姿的童年，充满了父母无微不至的爱！

投票现场，大家被一张张萌娃的照片吸引，拍照的拍照，发微信的发微信，时不时地传来“这张好可爱啊！”的夸赞声，场面非常热闹。最后，根据投票结果选出如下作品：“最呆萌宝宝”——6，18，



王蕾蕾



(上接第1页)间体研究提供了合成我国名贵中药重楼皂甙元Pennogenin、抗肿瘤天然产物OSW-1甙元、植物生长激素油菜甾醇内酯Brassinolide的路线。还完成了海洋天然甾醇Certonarsterol D₂、D₃和N₁的首次集成合成、抗HIV活性海洋甾醇Clathsterol 16-硫酸酯钠盐的首次合成并确定了天然Clathsterol侧链的立体化学以及具有细胞自噬活性的天然甾醇分子Clionamine D的首次合成，并考察了其类似物的细胞自噬活性(*Org. Lett.*, **2014**, *16*, 2177)。高效地完成了目前为止结构最为复杂的天然甾醇化合物Cephalostatin 1北片断及Cephalostatin 1的合成(*Chem. Asian J.*, **2011**, *6*, 786)。从相同起始原料蕃麻皂甙元出发经甾体-16-羟基-22-酸内酯为关键中间体的合成策略(19步反应，7.2%总收率)比经孕甾酮醇的传统策略(35步反应，1.6%总收率，*J. Am. Chem. Soc.*, **1998**, *120*, 692)合成Cephalostatin 1北片断减少了16步反应，总收率提高4.5倍(图3)。

田伟生课题组所发展的从甾体-16-羟基-22-酸内酯合成天然胆甾醇的策略也被其他同行关注和应用 (B. Jiang et al, *Tetrahedron*, **2008**, *64*, 469; D. P. Zhu, B. Yu, *J. Am. Chem. Soc.*, **2015**, *137*, 15098; DOI: 10.1021/jacs.6b00322)。

该课题组准备将其甾体-16-羟基-22-酸内酯类化合物的专利技术交相关企业进行规模化制备，届时将能充分保障各种所需甾体-16-羟基-22-酸内酯类化合物供给，使其在甾醇类化合物合成化学和生物学研究发挥应有作用。该项目得到国家基金委面上项目经费支持。

田伟生