



中国化学会

天然产物全合成-青年学术研讨会

**Natural Product Synthesis–
Young Investigator Forum 2012**



论文摘要

2012 年 6 月 19 - 20 日

中国·上海



天然产物全合成—青年学术研讨会

**Natural Product Synthesis—
Young Investigator Forum 2012**

中国科学院上海有机化学研究所
中科院天然产物有机合成化学重点实验室

2012 年 6 月 19—20 日，中国上海



“天然产物全合成—青年学术研讨会” NPS-YI 2012

会议主席：姜标、赵刚

会议组织秘书处：洪然、余冰、丁凯、魏邦国（复旦）、姜雪峰、高栓虎（华师大）

感谢以下单位的大力支持：

国家自然科学基金委员会
中国化学会
中国科学院上海有机化学研究所
中国科学院上海高等研究院
中国科学院昆明植物研究所
中国科学院长春应用化学研究所
中国科学院生态环境研究中心
中国科学院广州生物医药与健康研究院
四川大学
中国药科大学
北京大学药学院
南开大学
清华大学
天津大学
北京理工大学
中国海洋大学
大连理工大学
辽宁石油化工大学
哈尔滨工业大学
山东大学
兰州大学
西北大学
西安交通大学
复旦大学
华东师范大学
南京大学
中国科学技术大学
北京大学深圳研究生院
浙江大学
厦门大学

感谢以下公司赞助：

北京伊诺凯科技发展有限公司上海分公司
梯希爱（上海）化成工业发展有限公司
阿法埃莎（天津）化学有限公司
梅特勒—托利多国际贸易（上海）有限公司
上海翔雅仪器设备有限公司

序 言

近年来,国内高等院校和科研院所引进了一批从事有机化学研究领域的优秀青年人才,致力于开展天然产物全合成方面的研究工作。国家基金委和科技部等部门也加强了天然产物全合成领域研究的支持。2009年科技部启动了973项目“具有重要生物活性的天然产物的化学合成”,今年国家自然科学基金委也设立了重大项目“具有重要药用价值的多环天然产物高效合成”。

天然产物全合成作为有机化学研究的核心和新反应的试验场,一直占有重要地位,代表着一个国家有机化学学科的发展水平。在具有生理活性的结晶牛胰岛素全合成和青蒿素的结构鉴定和全合成工作中,我国老一辈合成化学家展示了卓越的研究水平,在国际上享有盛誉。值此“中国化学会八十华诞”之际,为了弘扬老一辈科学家的优良学术传统,同时给青年学者搭建良好的学术交流平台,由中国科学院上海有机化学研究所主办,中科院天然产物有机合成化学重点实验室承办的“天然产物全合成—青年学术研讨会”将在2012年6月19日至20日在中科院上海有机所召开。该研讨会得到了中国化学会、国家自然科学基金委、各高校和研究所以及上海有机所研究同仁的大力支持。

此次研讨会邀请了国内从事天然产物全合成的六十多位优秀的青年学者,共有17个邀请报告和4个特邀报告,其中在19日下午特设“药物化学和化学生物学”的讨论专题。研讨会将就天然产物合成领域的国内外发展趋势和共同关注的热点问题如天然产物合成与合成方法学、化学生物学、药物化学以及制药工艺研究等方面展开广泛和深入的讨论。

我们热诚欢迎参加此次“天然产物全合成—青年学术研讨会”的各位专家,并预祝会议取得圆满成功!

会议主席: 姜 标 研究员、赵 刚 研究员



中国科学院天然产物有机合成化学重点实验室

中国科学院上海有机化学研究所

二〇一二年六月六日

NPS-YI 2012
Scientific Program
Shanghai Institute of Organic Chemistry, CAS, Shanghai

18 June-Mon 2-5 pm Conference Set-up
Delegate Arrival & Registration (Jun Mou Building)
5:30 pm NPS-YI 2012 Welcome Reception (徐家汇金钱豹国际美食百汇)

19 June-Tue
8:45-9:00am **Opening ceremony (Chairperson: Dr. Ran Hong)**

Chairperson (Dr. Bo Liu)
9:00-9:30am Dr. Chuang-Chuang Li
Total synthesis of Fusarisetin A
9:30-10:00am Dr. Guangxin Liang
Total Synthesis of Echinopines
10:00-10:20am Coffee Break

Chairperson (Dr. Chun-An Fan)
10:20-10:50am Dr. Ang Li
Divergent Total Syntheses of Indole Terpenoids
10:50-11:20am Dr. Bang-Guo Wei
Diverse Synthesis of the Puzzled Lagunamide A
11:20-11:50am Dr. Sheng Jiang
From Total Synthesis of Natural Products to Discovery of New Histone
Deacetylase inhibitors

11:50-12:10am Group Photo
12:15-13:20pm Lunch and Coffee Break

Special Topic: Natural Product in Medicinal Chemistry and Chemical Biology

Chairperson (Dr. David Zhigang Wang)
13:20-14:05pm Prof. Yong Qin
系列吲哚生物碱的全合成
14:05-14:50pm Prof. Fa-Jun Nan
基于天然产物“优势结构”的活性多样性药物设计研究
14:50-15:20pm Coffee Break

Chairperson (Dr. Yanxing Jia)
15:20-15:50pm Dr. Xiaoguang Lei
The Chemistry and Biology of Complex Natural Products
15:50-16:35pm Prof. Zhu-Jun Yao
天然产物合成化学研究的几点心得体会
16:35-17:20pm Prof. Wen Liu
药用天然产物的生物合成及代谢途径的遗传改造研究

18:00-20:30pm NPS-YI 2012 Dinner & Business Meeting (陆家嘴“廊亦舫”)

20 June-Wed

Chairperson (Dr. Chuang-Chuang Li)

8:45-9:15am	Dr. Zhi-Xiang Xie Biomimetic Total Synthesis of (-)-Isatisine A
9:15-9:45am	Dr. Xiao Zheng 基于氮 α 位新型自由基偶联反应的若干生物碱的不对称全合成研究
9:45-10:15am	Dr. Zhen-Lei Song 新有机硅合成子和新反应导向的活性天然产物及药物分子的合成
10:15-10:35am	Coffee Break

Chairperson (Dr. Zhi-Xiang Xie)

10:35-11:05am	Dr. David Zhigang Wang Total Synthesis on <i>Daphniphyllum</i> alkaloids
11:05-11:35am	Dr. Jin-Song Yang 多羟基吲哚里西丁氮杂糖以及细胞表面寡糖的合成
11:35-12:05am	Dr. Yu-Rong Yang Synthetic Studies on the Paniculatine-type <i>Lycopodium</i> Alkaloids

12:15-13:30pm Lunch and Coffee Break

Chairperson (Dr. Wenjun Tang)

13:30-14:00pm	Dr. Yefeng Tang Development of Controllable Dyotropic Rearrangement of γ -lactone and Its Application in Natural Product Synthesis
14:00-14:30pm	Dr. Chun-An Fan Synthetic Studies of the <i>Lycopodium</i> alkaloid Palhinine A
14:30-15:00pm	Dr. Ran Hong Biomimetic Synthesis: Efficiency, Inspiration and Simulation
15:00-15:20pm	Coffee Break

Chairperson (Dr. Ran Hong)

15:20-15:50pm	Dr. Bo Liu 若干萜类天然产物的全合成研究
15:50-16:20pm	Dr. Yanxing Jia 几种吲哚生物碱的全合成研究

16:20-16:40pm NPS-YI 2012 Closing ceremony & NPS-YI 2013

20/21 June-Wed/Thur Departure

“天然产物全合成—青年学术研讨会”会议日程（中文）

6月18日下午2-5 PM 报到注册（君谋楼一楼大厅南侧）
 5:30 PM 晚宴（徐家汇金钱豹国际美食百汇）
 6月19日全天 会议（君谋楼一楼会议厅）（晚宴）
 6月20日上午和下午 会议（下午4:40会议结束；晚上自由时间）

日期	事件	主持人	时间	报告人	题目
6月18日	报到注册				
6月19日	开幕式	洪然	8:45-9:00	开幕式	
		刘波	9:00-9:30	报告	李闯创
			9:30-10:00	报告	梁广鑫
	茶歇		10:00-10:20		
		樊春安	10:20-10:50	报告	李昂
			10:50-11:20	报告	魏邦国
			11:20-11:50	报告	蒋晟
	合照		11:50-12:10		
	午餐、自由讨论		12:15-13:20		
专题讨论： 天然产物与 药物化学和 化学生物学		王智刚	13:20-14:05	特邀报告	秦勇
			14:05-14:50	特邀报告	南发俊
	茶歇		14:50-15:20		
		贾彦兴	15:20-15:50	报告	雷晓光
			15:50-16:35	特邀报告	姚祝军
			16:35-17:20	特邀报告	刘文
	晚宴：陆家嘴“廊亦舫”		18:00-20:30		
6月20日		李闯创	8:45-9:15	报告	谢志翔
			9:15-9:45	报告	郑啸
			9:45-10:15	报告	宋振雷
	茶歇		10:15-10:35		
		谢志翔	10:35-11:05	报告	王智刚
			11:05-11:35	报告	杨劲松
			11:35-12:05	报告	杨玉荣
	午餐、自由讨论		12:00-13:30		
		汤文军	13:30-14:00	报告	唐叶蜂
			14:00-14:30	报告	樊春安
			14:30-15:00	报告	洪然
	茶歇		15:00-15:20		
		洪然	15:20-15:50	报告	刘波
			15:50-16:20	报告	贾彦兴
	闭幕式		16:20-16:40	闭幕式& NPS-YI 2013	
6月20/21日	离沪				

Fusarisetin A 的全合成研究

Chuang-Chuang Li

School of Chemical Biology and Biotechnology
Shenzhen Graduate School, Peking University
Shenzhen University Town, Shenzhen 518055, China

Fusarisetin A 是从一种镰孢菌 (*Fusarium*) 属真菌的次级代谢产物中分离得到的新颖天然产物。除了罕见的[6, 6, 5, 5, 5]五环骨架结构之外, Fusarisetin A 能够有效抑制人乳腺癌细胞 MDA-MB-231 的形成和迁移, 并且并未表现出明显的细胞毒性。因而, Fusarisetin A 不仅极有希望成为研究新型抑制癌症转移抗癌药物的先导化合物, 而且有助于进一步地研究癌细胞转移的具体机制。

我们课题组以上述具有重要生理活性的复杂天然产物为靶标进行多样性导向的全合成研究, 不仅有助于进一步阐明其生理作用机制, 并且通过进一步的结构优化和化学修饰, 有望得到具有更高活性的天然产物类似物, 为新型抗癌药物的开发提供良好的基础。

【简历】李闯创



Associate Professor (2008-now)

Key Laboratory of Chemical Genomics,
School of Chemical Biology and Biotechnology
Shenzhen Graduate School, Peking University
E-mail: chuangli@pku.edu.cn
Tel: 0755-26032190 Fax: 0755-26032190 Cell: 13686440440

RESEARCH INTERESTS

Development of novel synthetic methodology, Chemical biology and
Total synthesis of biologically active and structurally interesting natural products

EDUCATION

2006-2008: Postdoctoral Associate

The Scripps Research Institute, CA, USA Advisor: Professor *Phil S. Baran*
Research project: Total Synthesis of Cortistatin A, Chartelline C and Securine A

2001-2006: Ph.D. graduate student in Organic Chemistry College of Chemistry
• Peking University • P.R. China Advisor: Professor *Zhen Yang*
Doctoral Thesis: Total Synthesis of Wedelolactone and Guanacastepene A

1997-2001: B.S. in Chemistry

College of Applied Chemistry • China Agricultural University
Advisor (2000-2001): Professor *Dao-quan Wang*

SELECTIVE PUBLICATIONS

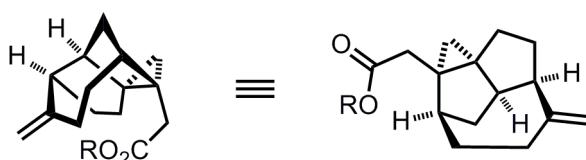
1. Total Syntheses of Drimane-Type Sesquiterpenoids Enabled by a Gold-Catalyzed Tandem Reaction, Shi, H.; Fang, L.; Tan, C.; Shi, L.; Zhang, W.; **Li, C.-C.***; Luo, T.*; Yang, Z.* *J. Am. Chem. Soc.*, **2011**, *133*, 14944.
2. Total Synthesis of Pseudolaric acid A, Xu, T.; **Li, C.-C.***; Yang, Z.* *Org. Lett.*, **2011**, *13*, 2630.
3. Formal Synthesis of Cortistatins Fang, L.; Chen, Y.; Huang, J.; Liu, L.; **Li, C.-C.***; Yang, Z.* *J. Org. Chem.*, **2011**, *76*, 2479.
4. Total Synthesis of (\pm) Maoecrystal V, Gong, J.; Lin, G.; Sun, W.; **Li, C.-C.***; Yang, Z.* *J. Am. Chem. Soc.*, **2010**, *132*, 16745.

Total Synthesis of Echinopines

Guangxin Liang

State Key Laboratory of Elemento-organic Chemistry
Nankai University, Tianjin, China
E-mail: lianggx@nankai.edu.cn

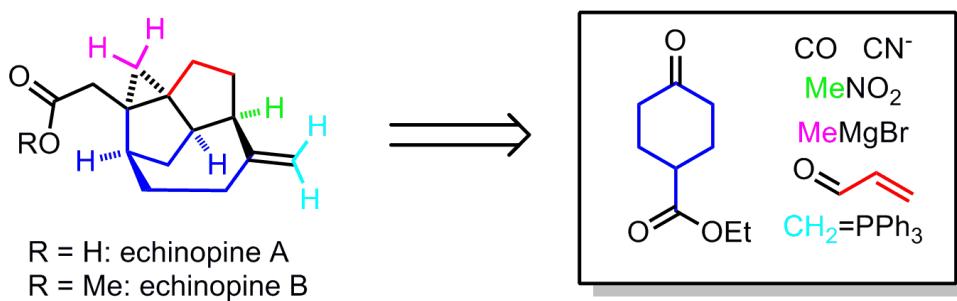
The creativity of Mother Nature is beyond imagination. In the chemistry world, one of the tremendous wonders it demonstrates is how diverse the structures of terpenoids could be. With the efforts of natural product chemists, Nature continues to surprise us with novel structures. Therefore, to overcome complex terpenoids with unique structures become an endless campaign in the synthetic community.



R = H: echinopine A; R = Me: echinopine B

Scheme 1: Structures of Echinopines

Echinopine A and B (Scheme 1) were two structurally unique sesquiterpenes recently isolated from the root of *Echinops spinosus* by Shi, Kiyota and co-workers.^[1] The skeleton of the molecules is characterized by an unprecedented [3.5.5.7] carbon framework with five contiguous stereogenic centers. Their unusual structural architecture poses significant synthetic challenges and attracted a lot of attention from synthetic community in the past years.^[2] Herein we will report our efforts on these natural products with new synthetic strategy and readily available building blocks (Scheme 2).



Scheme 2: Total Synthesis of Echinopines

Reference

- [1] Dong, M.; Cong, B.; Yu, S.-H.; Sauriol, F.; Huo, C.-H.; Shi, Q.-W.; Gu, Y.-C.; Zamir, L. O.; Kiyota, H. *Org. Lett.* **2008**, *10*, 701–704.
- [2] For representative total syntheses of echinopines, see: (a) Nicolaou, K. C.; Ding, H.; Richard, J.-A.; Chen, D. Y.-K. *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 3815–3818. (b) Peixoto, P. A.; Severin, R.; Tseng, C.-C.; Chen, D. Y.-K. *Angew. Chem., Int. Ed.* **2011**, *50*, 3013–3016. (c) Magauer, T.; Mulzer, J.; Tiefenbacher, K. *Org. Lett.* **2009**, *11*, 5306–5309. (d) Peixoto, P. A.; Richard, J.; Severin, R.; Chen, D. Y.-K. *Org. Lett.* **2011**, *13*, 5724–5727.

【简历】梁广鑫

教授，博士生导师

南开大学元素有机化学国家重点实验室



Guangxin Liang () got his bachelor's degree in chemistry in Nankai University in 1997. In 2000, he went to USA to study new glycosylation reactions with Professor Todd Lowary in the Ohio-State University and got his Master's degree in 2002. He then transferred to University of California, Berkeley to study under the supervision of Professor Dirk Trauner and got his Ph.D. degree in 2007.

During his Ph.D. research, he accomplished the first catalytic asymmetric Nazarov cyclization, finished 13 polyketide and 4 terpenoid natural products, developed a new synthetic pathway towards the asymmetric synthesis of the core structure in Haouamines and proposed the biosynthetic origin of Sporolides. His Ph.D. research was recognized by Roche graduate fellowship, Bristol-Myers Squibb graduate fellowship and Thieme publications “SynStar” award. After graduation in 2007, he moved to industry to work in Abbott Laboratory for drug development and received Excellent Performance Award and the Robert G. Stern Award during his service there. In 2009, he was attracted back to academia and became a professor in the State Key laboratory of Elemento-organic chemistry in Nankai University in China. His major research interest is the total synthesis of complex natural products of important biological and medicinal or structural interests.

Divergent Total Syntheses of Indole Terpenoids

Ang Li

A divergent strategy for the total syntheses of the indole terpenoid anominine and its natural congener tubingensin A has been developed. A common intermediate bearing all of the required stereogenic centers for both natural products was first assembled by employing a Ueno–Stork radical cyclization and a $\text{Sc}(\text{OTf})_3$ -mediated Mukaiyama aldol reaction to form the key C–C bonds in a stereocontrolled manner. The route to anominine features a radical deoxygenation followed by an efficient side-chain installation, while the path to tubingensin A exploits a CuOTf -promoted electrocyclization/aromatization sequence to forge the central region of the pentacyclic scaffold.

【简历】李昂

研究员，博士生导师

中国科学院上海有机化学研究所
生命有机化学国家重点实验室
上海市徐汇区零陵路 345 号, 200032
电话: 86-21-54925466
E-mail: ali@sioc.ac.cn
研究组主页: www.bnpc.labs.gov.cn/LiAng/



个人简历及研究领域介绍: 2004 年于北京大学获得理学学士学位, 本科期间在杨震教授指导下从事硫脲配体的合成研究。2004 至 2009 年在美国 The Scripps Research Institute 进行博士研究, 在 K. C. Nicolaou 教授指导下完成了 platensimycin 家族和 diversonol 家族中一些天然产物的全合成, 并于 2009 年获得博士学位。2010 年 1 月起在 Nicolaou 教授建于新加坡 Institute of Chemical and Engineering Sciences 的实验室进行博士后研究后, 于同年 9 月加入中国科学院上海有机化学研究所, 任“百人计划”研究员。研究兴趣主要包括天然产物的发散性全合成和对称性在天然产物全合成中的应用。独立工作后已完成 fusarisetin A、anominine、tubingensin A 等天然产物的全合成。

Diverse Synthesis of the Puzzled Lagunamide A

Wei Huang, Rong-Guo Ren, Bang-Guo Wei* and Guo-Qiang Lin

Department of Chemistry and Institutes of Biomedical Sciences, Fudan University, 220

Handan Road, Shanghai 200433, China Email: bgwei1974@fudan.edu.cn

Lagunamides A (**1**) and B (**2**) were isolated from the marine cyanobacterium *Lyngbya majuscule* obtained from Pulau Hantu Besar, Singapore in 2010 by Tan and his co-workers (Figure 1).¹ The absolute configurations of these two molecules were determined by 2D NMR experiments, Marfey's method and $^3J_{\text{H-H}}$ coupling constant values. Those two isolated marine depsipeptides show significant antimalarial properties, with IC_{50} values of 0.19 and 0.91 μM , respectively, when tested against *Plasmodium falciparum*. Furthermore, Lagunamides A and B also possessed potent cytotoxic activity against P388 murine leukemia cell lines, with IC_{50} values of 6.4 and 20.5 nM, respectively. As one part of our continuous interests in pursuing new drug candidate or discovery from natural products,² we have finished the diverse synthesis of Lagunamide A.

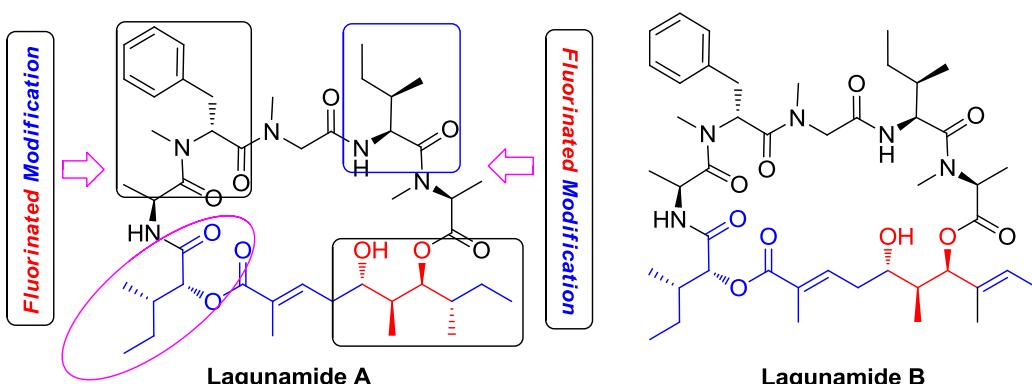


Figure 1. The structures of Lagunamides A (1) and B (2)

Key words: Leukemia; Diverse synthesis; Natural product; Depsipeptide; Lagunamide

Acknowledgments: We thank the National Natural Science Foundation of China (21072034, 20832005) and the fund of CAS key laboratory of synthetic chemistry of natural substances

References.

1. Tripathi, A.; Puddick, J.; Prinsep, M. R.; Rottmann, M. and Tan, L.T. *J. Nat. Prod.* **2010**, *73*, 1810.
2. (a) Liu, R.-C.; Wei, J.-H.; Wei, B.-G.; Lin, G.-Q. *Tetrahedron: Asymmetry* **2008**, *19*, 2731; (b) Liu, R.-C.; Huang, W.; Ma, J.-Y.; Wei, B.-G.; Lin, G.-Q. *Tetrahedron Lett.* **2009**, *50*, 4046; (c) Ma, J.-Y.; Xu, L.-F.; Huang, W.-F.; Wei, B.-G.; Lin, G.-Q. *Synlett* **2009**, 1307; (d) Huang, W.-F.; Li, Q.-R.; Chao, L.-M.; Lei, X.-S.; Wei, B.-G. *Tetrahedron Lett.* **2010**, *51*, 4317; (e) Wang, X.-L.; Huang, W.F.; Lei, X.-S.; Wei, B.-G.; Lin, G.-Q. *Tetrahedron* **2011**, *67*, 4919; (f) Ma, J.-Y.; Huang, W.; Wei, B.-G. *Tetrahedron lett.* **2011**, *52*, 4598; (g) Huang, W. Ma, J.-Y.; Yuan, M.; Xu, L.F. and Wei, B.-G. *Tetrahedron* **2011**, *67*, 7829; (h) Xarnod, C.; Huang, W.; Ren, R.-G.; Liu R.-C. and Wei, B.-G. *Tetrahedron* **2012**, DOI: 10.1016/j.tet.2012.05.120.

【简历】魏邦国

副研究员

复旦大学化学系

上海市杨浦区邯郸路 220 号, 200433

电话: (86)-21-54237757; Fax: (86)-21-54237757

E-mail: bgwei1974@sioc.ac.cn



研究领域介绍:

重点研究以廉价资源为手性源构筑重要手性片段的不对称合成方法，并应用于具有重要生理活性天然产物的结构多样性合成。开展哌啶、吡咯类生物碱、复杂结构的海洋环肽酯、大环内酯及其类似物的不对称合成和活性评价等研究。目前已完成了 Febrifugine, Apratoxins D,E, emericellamides A,B 等天然产物的不对称合成。

From Total Synthesis of Natural Products to Discovery of New Histone Deacetylase Inhibitors

Sheng Jiang, Yiwu Yao, Shang Li, Zhenchao Tu

Lab of Peptide Chemistry, Guangzhou Institute of Biomedicine and Health, CAS, Kai
Yuan Ave 190, Guangzhou, 710730

Tumorigenesis is a multi-step process caused by genetic and epigenetic changes. During the course of the tumorigenesis, many genes are involved and their expressions are deregulated. Histone deacetylases (HDACs) are a family of enzymes that catalyze the deacetylation of lysine side chains in chromatin, and thereby these enzymes are involved in a wide range of biological processes such as cell differentiation, proliferation, angiogenesis, and apoptosis.^{1,2} Concerned about the abnormal expressions of HDAC in cancers, the field of HDACs has grown into one of the dynamic areas of biological research in recent years. Many researchers have reported that HDAC1, which belongs to the Class I HDAC family, was elevated expressed in many types of cancers, including gastric cancer, pancreatic cancer, colorectal cancer, prostate cancer and hepatocellular carcinoma. In lung cancer, which is the leading cause of cancer-related death in both men and women, a trend of higher HDAC1 expression in advanced stage disease compared with low stage was reported in a series of 102 samples. Taken together, histone deacetylases (HDACs) are ideal targets for anticancer drug development as attested by the approval of suberoyl anilide hydroxamic acid (SAHA, vorinostat) and the depsipeptide FK228 (romidepsin) for the treatment of cutaneous T cell lymphoma. Based on our total synthesis of largazole, FK228 and spiruchostatin A, a series of new histone deacetylase inhibitors was designed and synthesized. Many of them show promising anti-cancer activities in nanomolar order.

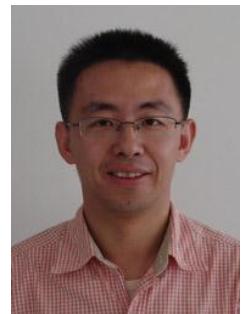
Reference:

1. de Ruijter, A.J., et al., *Histone deacetylases (HDACs): characterization of the classical HDAC family*. *Biochem J*, **2003**. 370(Pt 3): p. 737-49.
2. Gray, S.G. and B.T. Teh, *Histone acetylation/deacetylation and cancer: an "open" and "shut" case?* *Curr Mol Med*, **2001**. 1(4): p. 401-29.
3. Gray, S.G. and T.J. Ekstrom, *The human histone deacetylase family*. *Exp Cell Res*, **2001**. 262(2): p. 75-83.
4. Marks, P., et al., *Histone deacetylases and cancer: causes and therapies*. *Nat Rev Cancer*, **2001**. 1(3): p. 194-202.
5. Bolden, J.E., M.J. Peart, and R.W. Johnstone, *Anticancer activities of histone deacetylase inhibitors*. *Nat Rev Drug Discov*, **2006**. 5(9): p. 769-84.
6. Khan, O. and N.B. La Thangue, *Drug Insight: histone deacetylase inhibitor-based therapies for cutaneous T-cell lymphomas*. *Nat Clin Pract Oncol*, **2008**. 5(12): p. 714-26.

【简历】蒋晟

研究员，博士生导师

中科院再生生物学重点实验室
中国科学院广州生物医药与健康研究院
广州科学城开源大道 190 号, 510530
电话: (86)-20-32015318;
Fax: (86)-20-32015229; 手机: 1868888237
E-mail: jiang_sheng@gibh.ac.cn



研究领域介绍: (1) 具有抗肿瘤活性天然产物的全合成及其结构修饰; (2) 针对特定致病基因的活性小分子和多肽化合物的合理设计、合成和生物活性评价。

系列吲哚生物碱的全合成

秦勇



【简历】秦勇，教授、博士生导师

药物化学专业教授，教育部长江学者特聘教授（药学）、国家杰出青年基金获得者（有机化学），全国百篇优博论文指导教师（药学）。曾获四川省科技进步一等奖和四川省青年科技奖。获人事部新世纪百千万人才、四川省学术技术带头人、成都市有突出贡献的优秀专家等荣誉称号，享受国务院政府津贴。

1989 年本科毕业于云南大学化学系；1992 年 7 月在中科院成都有机所获理学硕士学位；1995 年在中科院化学研究所获理学博士学位；1995 年至 1996 年，在中科院成都有机化学研究所任助理研究员，副研究员；1996 年至 2000 年，美国佛蒙特大学化学系博士后；2000 年至 2003 年，美国圣地亚哥生物制药公司 Triad Therapeutics Inc. 公司任研究科学家。2003 年至 2011 年，四川大学华西药学院教授，副院长（2005 年至 2011 年）；2011 年至今，重庆大学创新药物研究中心和重庆大学化学化工学院教授，创新药物研究中心主任。

目前主要从事具有重要生理活性的天然产物的全合成及药物化学研究。回国 8 年来，在包括 *Nature Chem. Biol.*, *Angew. Chem.*, *J. Am. Chem. Soc.* 等一级学科及以上国际著名学术刊物上发表多篇具有重要学科影响力的关于复杂天然产物全合成的研究论文，得到国内外同行的广泛关注和赞誉，研究成果被“*Chemistry World*”, “*Nature China*”和“*Syndrom*”等科技新闻刊物多次报道。

近年代表性论文：

- [1] Zhang, D.; Song, H.; **Qin, Y.*** Total Synthesis of Indoline Alkaloids: A cyclopropanation Strategy. *Acc. Chem. Res.* **2011**, *44*, 447.
- [2] Wu, H. X.; Xue, F.; Xiao, X.; **Qin, Y.*** Total Synthesis of (+)-Perophoramide. Determination of the Absolute Configuration. *J. Am. Chem. Soc.* **2010**, *132*, 14052.
- [3] Zhang, M.; Huan, X.; Shen, L.-Q.; **Qin, Y.*** Total Synthesis of (\pm)-Vincorine. *J. Am. Chem. Soc.* **2009**, *131*, 6013.
- [4] Shen, L.-Q.; Zhang, M.; Wu, Y.; **Qin, Y.*** Highly Efficient Assembly of Indole Alkaloid Skeleton via Cyclopropanation: Concise Total Synthesis of (\pm)-Minfiensine. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2008**, *47*, 3618.
- [5] Yajima, A.;* **Qin, Y.**;* Zhou, X.; Kawanishi, N.; Xiao, X.; Wang, J.; Zhang, D.; Wu, Y.; Nukada, T.; Yabuta, G.; Qi, J.-H.;* Asano, T.; Sakagami, Y.; Synthesis and Absolute Configuration of Hormone a1. *Nat. Chem. Biol.* **2008**, *4*, 235.
- [6] Yang, J.; Wu, H.-X.; Shen, L.-Q.; **Qin, Y.*** Total Synthesis of (\pm)-Communesin F. *J. Am. Chem. Soc.* **2007**, *129*, 13794.

基于天然产物“优势结构”的活性多样性药物设计研究

南发俊

新药研究国家重点实验室，中科院上海药物所

天然产物中存在的某些优势结构或结构单元，代表着一类理想的先导化合物来源。以这些优势结构为基本骨架，通过多样性导向的合成(Diversity-Oriented Synthesis,DOS)策略，运用组合化学的一些手段，在保留天然产物优势结构所具有的生物相容性和类药性基础上，尽可能地拓展“化学空间(Chemical space)”，设计合成中小规模的“类天然产物化合物库(Natural product-like library)”，再结合多靶点生物活性测试系统(特别是一些成熟的细胞模型)，不仅可以改善天然产物本身的生物活性和成药性，获得结构简化、更具类药性的类天然化合物；同时更为重要的是可以发现新的生物活性化合物，达到“生物学空间”(Biological space)的拓展，为生物学研究提供结构新颖的探针工具或为药物研究提供新型先导化合物。

【简历】南发俊

研究员，博士生导师

新药研究国家重点实验室副主任
中国科学院上海药物研究所

1991年，兰州大学化学系

1997年，中科院上海有机所（理学博士）

1997年—2000年，美国乔治城大学医学中心从事博士后研究

2000年，“中国科学院引进国外杰出人才计划”（百人计划）

2007年，国家杰出青年基金



研究方向：

运用有机化学和组合化学相结合的方法设计与合成某些具有生物活性的有机分子及探针工具，并通过系统的药物构效关系研究发现针对重大疾病的药物先导化合物或工具化合物。研究方向主要集中在以下三个方面：多样性导向的类天然产物库合成及先导物发现；靶向化合物库设计与合成—药物构效关系研究；分子探针设计与合成及其在化学生物学研究中的应用。

科研成果：

课题组自2000年成立以来，已在 *J. Med. Chem.*、*J. Biol. Chem.*、*Org. Lett.*、*J. Comb. Chem.*、*J. Org. Chem.*、*ChemBioChem*，中国药理学报等国内外刊物上发表论文70余篇，申请专利30余项，获得授权10项。完成一个候选新药的临床前研究，发现了一批具有进一步研究价值的药物先导化合物。

The Chemistry and Biology of Complex Natural Products

Xiaoguang Lei, Ph.D.

北京生命科学研究所; 天津大学, 药物科学与技术学院
北京市中关村生命科学园, 102206

Complex natural products provide tremendous opportunities to shape the landscape of the state of the art and science of organic synthesis, as well as to impact the biomedical research and drug discovery. My laboratory conducts research at the interface between chemistry and biology. We systematically use bioactive small molecules, particularly natural products, to study their biological functions, elucidate molecular mechanisms of the important biological pathways, and develop novel therapeutic agents for currently intractable diseases. Herein, I would like to disclose our recent endeavors towards the biomimetic synthesis of a number of complex natural products and subsequent chemical genetics studies using these bioactive chemical probes.

【简历】雷晓光

教授, 博士生导师

北京生命科学研究所

天津大学 药物科学与技术学院

北京市中关村生命科学园, 102206

电话: (86)-10-80704786; Fax: (86)-10-80704785

E-mail: leixiaoguang@nibs.ac.cn

小组网页: <http://www.nibs.ac.cn/xlei/home.htm>



Dr. Xiaoguang Lei

Education:

2001– 2006 Ph.D., Organic Chemistry Boston University (BU), Boston, MA, USA
(CMLD-BU) (Advisor: Professor John A. Porco, Jr.)

Thesis: “Target and Diversity-Oriented Synthesis Using Epoxyquinoid Scaffolds”

1997– 2001 B.S., Organic Chemistry Peking University (PKU), Beijing, P.R. China
Department of Chemistry (Advisor: Professor Jianbo Wang)

Honors and Awards

- New Century Excellent Talents in University Award, 2010
- WuXi PharmaTech 2010 Life Science and Chemistry Award, 2010
- IUPAC Young Chemist Award, 2009

NESACS-JCF/GDCh Exchange Scholarship to Germany, 2005

Student Fellowship for the Gordon Research Conference on Combinatorial Chemistry, 2005

Sugata Ray Memorial Award for Excellence in Research and Teaching at Boston University, 2005

Research Interests

- Total synthesis of structurally complex and bioactive natural products
- Development of new synthetic methodology inspired by natural product synthesis
- Chemical genetic studies of important biological pathways with small molecule probes
- Development of new bioorthogonal reactions
- Development of novel therapeutically useful small molecules

Recent Publications

1. Sun, L.; Wang, H.; Wang, Z.; He, S.; Chen, S.; Liao, D.; Wang, L.; Yan, J.; Liu, W.; **Lei, X.***; Wang, X.* “Mixed Lineage Kinase Domain-like Protein Mediates Necrosis Signaling Downstream of RIP3 Kinase” *Cell* **2012**, *148*, 213-227. (News story describing this work was highlighted in *Chem. & Eng. News* 2012, 5, 40; *Nature China* 2012, February 1; *Asian Scientist* 2012, January 31)
2. Li, H.; Wang, X.; **Lei, X.*** “Total Syntheses of *Lycopodium* Alkaloids (+)-Fawcettimine, (+)-Fawcettidine and (-)-8-Deoxyserratinine” *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 491-495; *Angew. Chem.* **2012**, *124*, 506-510.
3. Liao, D.; Li, H.; **Lei, X.*** “Efficient Generation of ortho-Quinone Methide: Application to the Biomimetic Syntheses of (\pm)-Schefflone and Tocopherol Trimmers” *Org. Lett.* **2012**, *14*, 18-21.
4. Chou, T.; Dong, H.; Zhang, X.; **Lei, X.***; Hartung, J.; Zhang, Y.; Lee, H. L.; Wilson, R. M.; Danishefsky, S. J. * “Multifaceted Cytoprotection by Synthetic Polyacetylenes Inspired by the Ginseng-derived Natural Product Panaxytriol” *Proc. Natl. Acad. Sci. USA* **2011**, *108*, 14336-14341.
5. Li, C.; Tu, S.; Wen, S.; Li, S.; Chang, J.; Shao, F.; **Lei, X.*** “Total Synthesis of the G2/M DNA Damage Checkpoint Inhibitor Psilostachyin C” *J. Org. Chem.* **2011**, *76*, 3566-3570.
6. Li, C.; Yu, X.; **Lei, X.*** “A Biomimetic Total Synthesis of (+)-Ainsliadimer A” *Org. Lett.* **2010**, *12*, 4284-4287.
7. Gong, Y.; Wang, X.; Wang, J.; Yang, Z.; Li, S.; Yang, J.; Liu, L.; **Lei, X.***; Shao, F. * “Chemical Probing Reveals Insights into the Signaling Mechanism of Inflammasome Activation” *Cell Res.* **2010**, *20*, 1289-1305.
8. Han, Z.; Niu, T.; Chang, J.; **Lei, X.***; Zhao, M.; Wang, Q.; Cheng, W.; Wang, J.; Feng, Y.; Chai, J. “Crystal structure of the FTO protein reveals basis for its substrate specificity” *Nature* **2010**, *464*, 1205-1209.

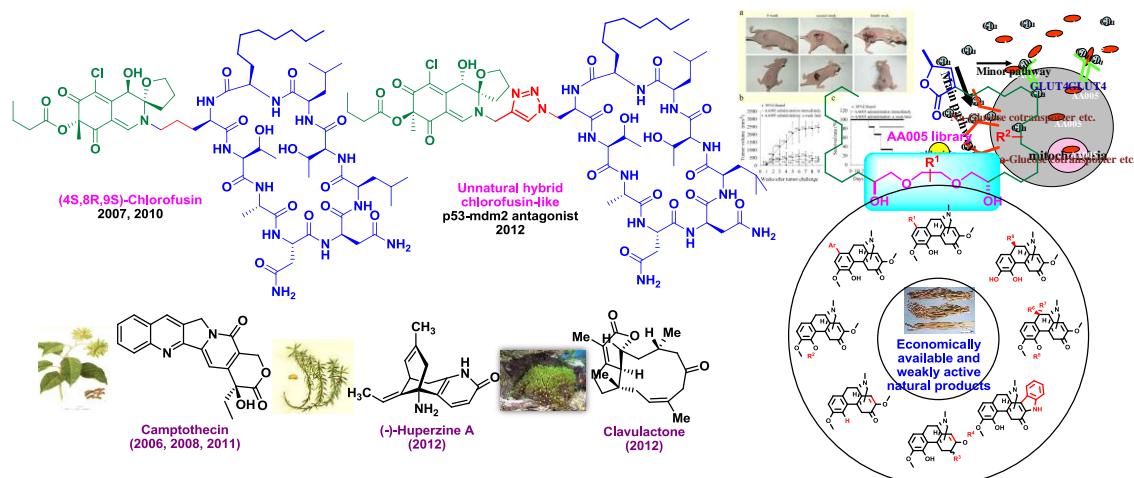
天然产物合成化学研究的几点心得体会

姚祝军

江苏省南京市汉口路22号, 南京大学化学化工学院, 南京微结构国家实验室(筹) (210093)
上海市零陵路345号, 中国科学院上海有机化学研究所生命有机化学国家重点实验室 (200032)
yaoz@nju.edu.cn or yaoz@sioc.ac.cn

天然产物的合成化学(亦称全合成)一直是有机化学中的代表性研究领域, 经典而厚重。它历经180多年的发展仍持续不断地为现代科学的发展提供新的热点, 添加新的科学内容, 造就了一代代的有机合成大师, 是今天最吸引年轻化学家的科学分支之一。随着科学进步的步伐, 今天的天然产物合成化学也已经不再局限于化学合成本身, 更多的是通过天然产物作为起点揭示新的科学规律, 进行新的发明创造, 全面诠释合成化学的分子创新威力和随之起舞的多重科学意义。

本研究组在过去若干年对一系列不同类型的生理活性天然产物开展了合成化学研究, 先后完成了10余例天然产物的不对称合成, 包括最近针对源于中国自然资源的几个具有显著生理活性的天然产物喜树碱^[1]、石杉碱甲^[2]、群蛭虫内酯^[3]等的合成工作; 通过建立的这些合成化学基础, 我们又相应地开展了有关药物化学和化学生物学的研究工作, 也或多或少有些收获。本报告将以示例方式探讨目标导向的化学合成方法在发现新的生理活性物质中的独特应用。



References:

- (a) Yao, Y.-S.; Liu, J.-L.; Xi, J.; Miu, B.; Liu, G.-S.; Wang, S.; Meng, L.*; Yao, Z.-J.* *Chem. Eur. J.* **2011**, *17*, 10462-10469. (b) Liu, G.-S.; Yao, Y.-S.; Xu, P.; Wang, S.-z. Yao, Z.-J.* Efficient Total Synthesis of (S)-14-Azacamptothecin. *Chem. Asian J.* **2010**, *5*, 1382-1388. (c) Liu, G.-S.; Dong, Q.-L.; Yao, Y.-S.; Yao, Z.-J.* **2008**, *10*, 5393-5396. (d) Zhou, H.-B.; Liu, G.-S.; Yao, Z.-J.* *J. Org. Chem.* **2007**, *72*, 6270-6272. (e) Zhou, H.-B.; Liu, G.-S.; Yao, Z.-J.* *Organic Letters* **2007**, *9*, 2003-2006.
- Ding, X.-H.; Li, X.; Liu, D.; Cui, W.-C.; Ju, X.; Wang, S.-z.; Yao, Z.-J.* *Tetrahedron* **2012**, *68*, in press.
- Yang, Z.-Y.; Liao, H.-Z.; Sheng, K.; Chen, Y.-F.; Yao, Z.-J.* *Angew. Chem., Int. Ed.* **2012**, *51*, in press.

【简历】姚祝军 (Zhujun Yao)

研究员, 博士生导师

E-mail: yaoz@mail.sioc.ac.cn

电话: 021-54925133



研究方向:

生理活性天然产物全合成、合成方法学以及化学生物学
类天然产物化学以及中药有效成分的药物化学
生理活性天然小分子化合物的标记以及影像学应用

工作经历:

2008 年 12 月至今: 中科院上海有机化学研究所, 二级研究员

2007 年 12 月至 2008 年 12 月: 中科院上海有机化学研究所, 三级研究员

1999 年 11 月至 2007 年 12 月: 中科院上海有机化学研究所, 研究员

1996 年 9 月至 1999 年 9 月: 美国 NIH 癌症研究所, 博士后访问研究员

1995 年 9 月至 1996 年 9 月: 中国科学院上海有机化学研究所, 助理研究员

教育背景:

1993 年 1 月至 1995 年 7 月: 中科院上海有机所理学博士。导师: 吴毓林教授

1990 年 9 月至 1992 年 12 月: 中科院上海有机所理学硕士。导师: 吴毓林教授

1986 年 9 月至 1990 年 7 月: 复旦大学化学学院理学学士。导师: 姚子鹏教授

主要获奖情况:

2008 年上海市领军人才 (上海市人力资源与社会保障局、市委组织部)。

第一届中国科学院“朱李月华”优秀教师奖 (2008 年 8 月)。

第一届中国科学院上海分院“杰出青年创新人才”称号 (2008 年 5 月)

第一届药明康德生命化学奖二等奖 (2007 年 12 月)

中国科学院优秀教师 (2006 年 8 月)

2005-2006 年度中国化学会-巴斯夫青年创新奖 (2005 年 12 月)

学术任职

学术刊物编委:

“Current Chemical biology”, “Chemical Biology and Drug Discovery”, “Letters in Drug Design and Development”, “Anticancer agents in Medicinal Chemistry”, “Science in China B: Chemistry”, “Chinese Journal of Chemistry”

国际纯粹与应用化学联合会第七专业委员会, 中国国家代表 (2008-2009)

中国化学会化学生物学专业委员会主任 (2007-2011)

药用天然产物的生物合成及代谢途径的遗传改造研究

刘文

中国科学院上海有机化学研究所, 生命有机国家重点实验室,
wliu@mail.sioc.ac.cn

代谢途径的遗传改造是近年来在生物技术的推动下、发展起来的一种用于新药发现和发展的新方法。它是以天然产物的代谢合成机制研究为基础, 从基因水平对天然产物的生物合成途径进行合理化的遗传修饰或重组, 建立结构复杂的天然产物类似物库, 以利于从中开发更具有临床应用价值的药物。由于目的代谢产物可以由获得的重组菌株发酵大量生产, 因而可以降低生产成本和减少环境污染。目前, 代谢工程无论是在学术研究还是工业领域, 对于新药开发和生产的巨大影响力正逐渐为科学家们所认识。它们的成功运用, 关键是在基因和蛋白功能水平上认识和理解复杂天然产物的生物合成及其调控机制, 这是在微生物体内针对代谢途径进行遗传操作的分子和生化基础。天然产物的生物合成——即如何从小分子的前体经过顺序协作的酶催化反应形成不同的化学结构——是一个相当复杂的过程, 不但包括多步骤的生物合成途径, 还需要对代谢网络的协调控制。其中, 阐明负责独特化学结构和生物活性中心形成的关键酶反应机制是研究的核心内容。

基于天然产物在生物、化学和医药领域的重要作用, 我室以具有良好生物活性、独特化学结构和新颖作用机制的天然抗生素为目标, 开展了它们的生物合成机制研究, 探索运用组合生物合成的原理发现和发展新型药物的途径。同时, 针对目前我国大宗发酵产品抗生素(如红霉素)普遍存在的产品发酵单位低、产物复杂等问题, 在基因和酶催化两个层次充分理解其生物合成和调控机制的基础上, 对代谢途径进行合理化遗传修饰以提高目标组份的比例, 从而提高产品的质量和产量, 促进我国抗生素生产工业的发展。

【简历】刘文

研究员，博士生导师

生命有机国家重点实验室副主任
中科院湖州生物制造创新中心主任
中国科学院上海有机化学研究所
电话 #: 86-21-54925111
电子信箱: wliu@mail.sioc.ac.cn



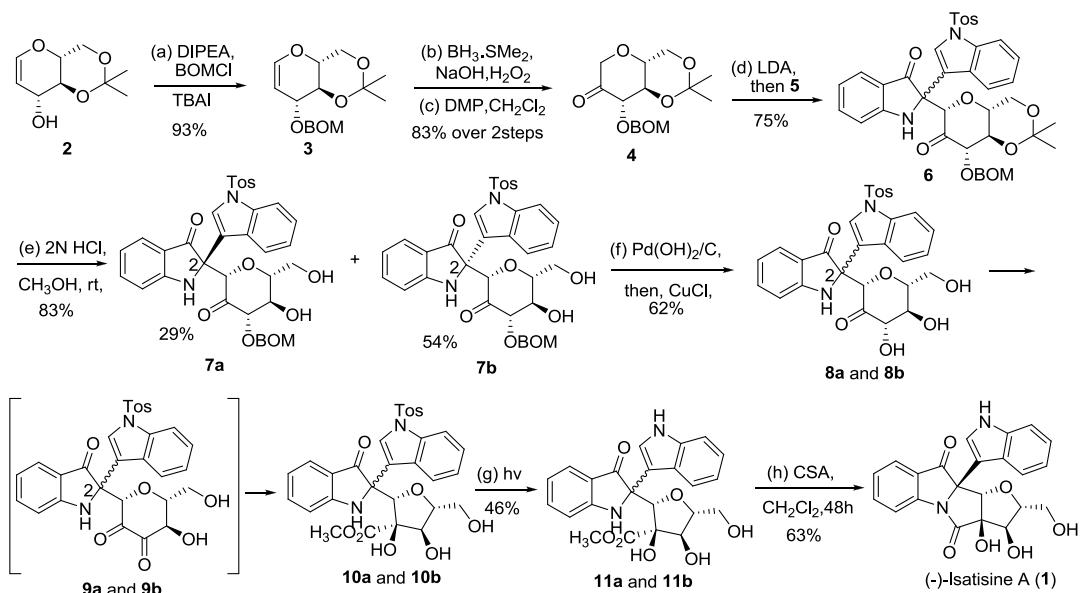
刘文于 2000 年在中国医学科学院（中国协和医科大学）获得博士学位。在加州大学戴维斯分校化学系（2000-2001）和威斯康星大学麦迪逊分校药学院（2001-2003）完成博士后阶段学习以后，于 2003 年加入中国科学院上海有机化学研究所。国家自然科学基金委 2005 年度“杰出青年基金”获得者，上海市科委和人事局 2005 年度“浦江学者”、上海市科委 2005 年度“启明星计划”及 2009 年度“启明星追踪计划”入选者。2009 年中科院优秀“百人计划”获得者；2010 年获国务院政府特贴、中国药学会-赛诺菲安万特青年生物奖、治乳业生命科学奖（优秀奖）；2011 年获中科院优秀导师奖。现任中国微生物学会分子微生物学与生物工程专业委员会副主任委员和分子生物学专业委员会委员、中国医药生物技术协会酶工程与发酵工程专业委员会委员、上海市化学化工学会有机化学专业委员会委员、华东 6 省市生物化学与分子生物学学会理事会理事、《有机化学》编委和《中国抗生素杂志》编委。他的研究兴趣包括：1) 天然产物的生物合成（遗传学、生物化学和化学）；2) 致力于产量提高和结构多样性的组合生物合成；3) 基于基因组或转录组发掘的微生物天然产物的发现。

Biomimetic Total Synthesis of (-)-Isatisine A

Zhi-Xiang Xie

State Key Laboratory of Applied Organic Chemistry, Lanzhou University,
Lanzhou, 730000, P. R. China

(-)-Isatisine A (1) was isolated from the leaves of *Isatis indigotica* Fort. (Da-Qing-Ye) in 2007 by Chen and coworkers.¹ Its uncharacterized bioactivity and intriguing molecular architecture have drawn our attention. Herein, we report our biomimetic total synthesis of (-)-isatisine A (1). Our biomimetic synthetic strategy features a convergent nucleophilic addition for installation of the indole moiety and, subsequently, an unprecedented benzilic ester rearrangement for construction of the densely substituted furan subunit.²



Scheme 1: Biomimetic Total Synthesis of (-)-Isatisine A

Acknowledgement:

This work was supported by 973 Program (No. 2010CB833203), the National Natural Science Foundation of China (No. 21072083), and the Fundamental Research Funds for the Central Universities (No. lzujbky-2012-56).

References

1. Liu, J. F.; Jiang, Z. Y.; Wang, R. R.; Zheng, Y. T.; Chen, J. J.; Zhang, X. M.; Ma, Y. B. *Org. Lett.* **2007**, *9*, 4127.
2. Wu, W.; Xiao, M-X.; Wang, J-B.; Li, Y.; Xie, Z-X., *Org. Lett.* **2012**, *14*, 1624.

【简历】谢志翔

教授，博士生导师

功能有机分子化学国家重点实验室

兰州大学，兰州市城关区天水南路 222 号

邮编：730000

电话：13993173202

E-mail: xiezx@lzu.edu.cn



主要研究领域：

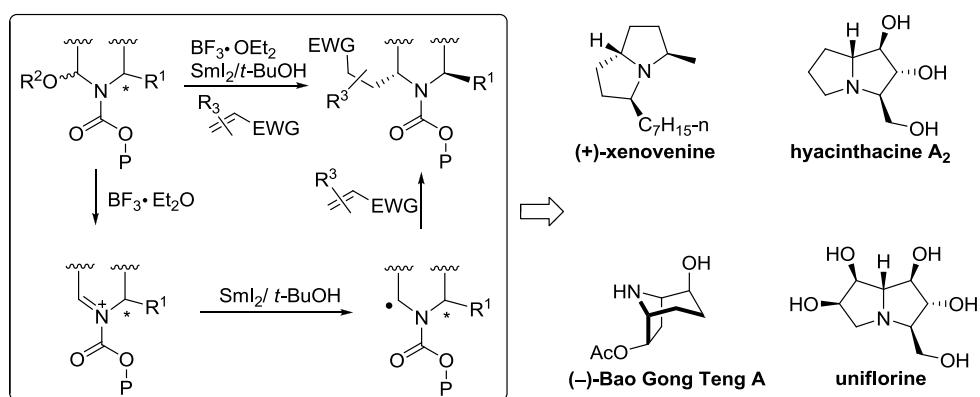
抗艾滋病生理活性天然产物合成研究、天然产物仿生合成及合成方法学研究、以及药物合成工艺开发等。研究项目有：主持国家自然科学基金两项、作为骨干成员参与 973 项目一项；至今已发表研究论文二十多篇。

基于氮 α 位新型自由基偶联反应的若干生物碱的不对称全合成研究

郑 哛

厦门大学化学系，福建厦门

氮 α 位碳—碳键的形成对于许多生物碱及含氮药物的合成至关重要。最近，基于单电子还原酰亚胺鎓离子形成氮 α 位自由基的概念，我们发展了一种以 Lewis 酸 $\text{F}_3\text{B}\bullet\text{OEt}_2$ 作用于氮杂(半)缩醛形成酰亚胺鎓，再以二碘化钐还原产生氮 α 位自由基，进而与 α,β -不饱和化合物偶联形成碳—碳键的新方法¹。应用该方法，成功地实现了蚂蚁毒素吡咯里西啶生物碱(+)-xenovenine¹，托品烷生物碱包公藤甲素²和氮杂糖生物碱 hyacinthacine A₂，uniflorine A³的不对称全合成。



参考文献：

1. Xiang, Y.-G.; Wang, X.-W.; Zheng, X.; Ruan, Y.-P.; Huang, P.-Q. *Chem. Commun.* **2009**, 7045–7047.
2. Lin, G.-J.; Zheng, X.; Huang, P.-Q. *Chem. Commun.* **2011**, 47, 1545–1547.
3. Liu, X.-K.; Qiu, S.; Xiang, Y.-G.; Ruan, Y.-P.; Zheng, X.; Huang, P.-Q. *J. Org. Chem.* **2011**, 76, 4952–4963.

【简历】郑啸

副教授

厦门大学化学化工学院化学系

福建厦门 361005

电话: (86)-592-2180992

E-mail: zxiao@xmu.edu.cn



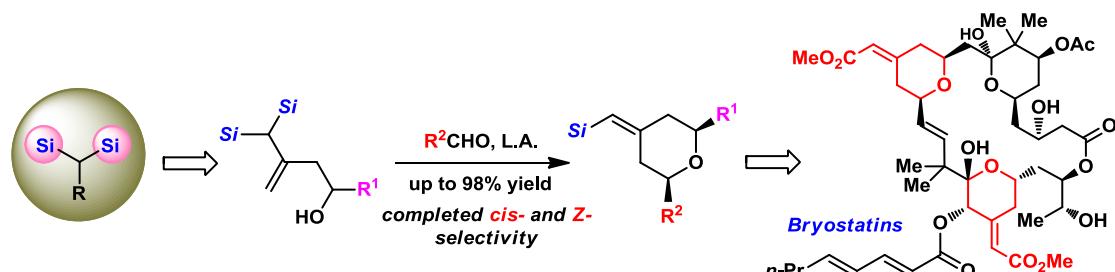
研究领域介绍:主要研究方向为基于新型自由基偶联反应的碳—碳键形成方法学研究，及其在天然产物不对称全合成中的应用。

新有机硅合成子和新反应导向的活性天然产物及药物分子的合成

宋振雷

四川大学华西药学院药物化学系，四川成都

硅和碳是同属第IV主族的元素，但是二者在物理和化学性质上却有着很大的差别，而这也赋予了有机硅化化合物诸多独特的反应性质。近年来，本小组在有机硅化学领域开展了一系列探索性的研究工作。我们的整体思路是：希望在结构新颖的有机硅分子的开发，新反应方法学的发展以及活性分子和药物分子的合成这三个部分的研究之间建立一种紧密互动、相辅相成的研究模式。最近，在结构新颖独特的双硅类化合物的合成和性质研究过程中，我们开发了一系列有趣的新反应方法学，并初步展示了这类化合物作为双官能团合成子的潜在的应用价值。例如，我们通过双硅高烯丙醇化合物和醛的 Prins 环化反应，实现了含有环外 Z-式构型双键、2,6-位顺式取代的四氢吡喃结构的高效合成。应用该方法，我们成功地实现了具有广谱抗癌活性的Bryostatin类天然产物关键环骨架的构筑，为正在开展的这类天然产物的全合成工作提供了一个新的策略。



Scheme 1.

参考文献：

1. Lu, J.; Song, Z. L.; Zhang, Y. B.; Gan, Z. B.; Li, H. Z. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 5367-5370.
2. Gao, L.; Lin, X. L.; Lei, J.; Song, Z. L.; Lin, Z. *Org. Lett.* **2012**, *14*, 158-161.
3. Sun, X. W.; Lei, J.; Sun, C. Z.; Song, Z. L.; Yan, L. *J. Org. Lett.* **2012**, *14*, 1094-1097.
4. Song, Z. L.; Kui, L. Z.; Sun, X. W.; Li, L. *J. Org. Lett.* **2011**, *13*, 1440-1443.
5. Wang, C.; Gan, Z. B.; Lu, J.; Wu, X.; Song, Z. L. *Tetrahedron Lett.* **2011**, *52*, 2462-2464.
6. Song, Z. L.; Lei, Z.; Lu, G.; Wu, X.; Li, L. *J. Org. Lett.* **2010**, *12*, 5299-5302.

【简历】宋振雷

副教授，博士生导师

四川大学华西药学院药物化学系，
靶向药物及释药系统教育部重点实验室
四川省成都市人民南路三段 17#，610041
电话: (86)-28-85501062; 13281071169
E-mail: zhenleisong@scu.edu.cn



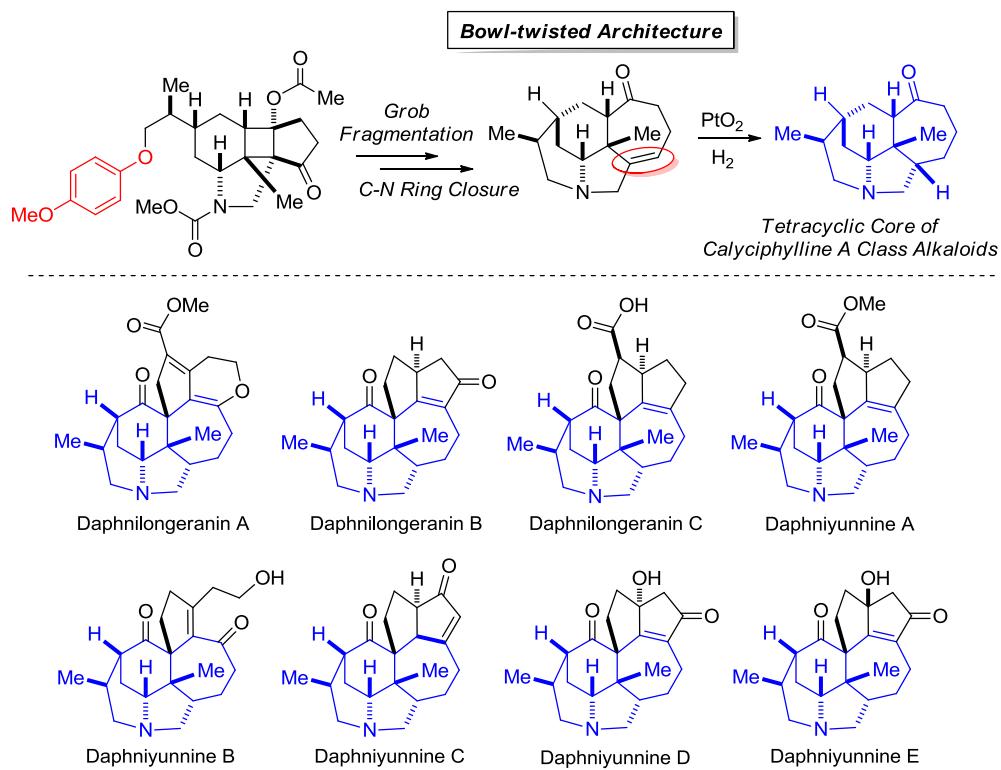
研究领域：新有机硅合成子和新反应导向的活性天然产物及药物分子的合成。

Total Synthesis on *Daphniphyllum* Alkaloids

Zhigang Wang (王志刚)

School of Chemical Biology and Biotechnology, Shenzhen Graduate School,
Peking University

We will elaborate in this talk a stereochemically controlled route to the enantio-pure [6-6-5-7] tetracyclic core of *Calyciphylline* A class alkaloids, which strategically involves Overman rearrangement, [2+2] photochemical cycloaddition, Grob fragmentation, C-N bond-forming nucleophilic displacement, and ring strain-directed hydrogenation as key transformations.



【简历】Zhigang Wang (王志刚)

教授，博士生导师

School of Chemical Biology and Biotechnology
Shenzhen Graduate School, Peking University
Shenzhen University Town, Shenzhen 518055, China
Tel: 0086-(0)755-26032702
Fax: 0086-(0)755-26035326
E-mail: asycata@gmail.com



David Zhigang Wang was born in 1975 in Hubei Province of China. His scientific training includes a B.S. in Chemistry from Lanzhou University in 1995 (graduated one year ahead of time with Presidential Honor), an M.S. in Physical Chemistry from the Chinese Academy of Sciences in 1998, and a Ph.D. in Organic Chemistry from Columbia University (with Professor Thomas J. Katz) in 2005. Following a postdoctoral stint with Professor Samuel J. Danishefsky at Columbia and the Sloan-Kettering Cancer Center, he joined the Shenzhen Graduate School of Peking University as an Associate Professor in 2007. His research programs concern primarily enantioselective catalysis and natural products total synthesis.

His major accomplishment is the development of a new electronic theory for molecular chiralities and chiral interactions, which leads to his current research focus on helix theory-guided rational design of enantioselective catalysis. His work in the area of natural products emphasizes new strategic plannings as well as biomimetic cascades for complexity-oriented synthesis.

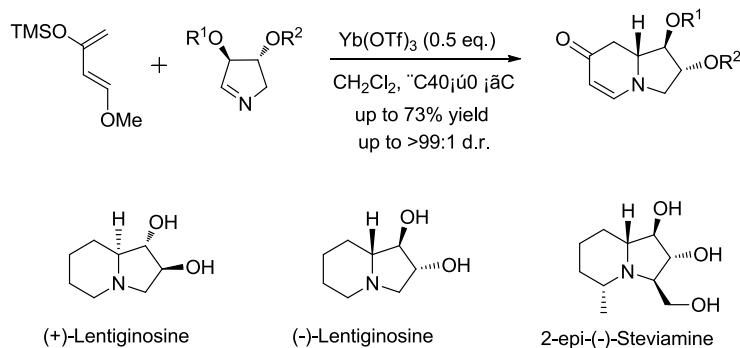
He will discuss on this symposium the latest results from his laboratory concerning total synthesis of some members of the *Daphniphyllum* class alkaloids.

多羟基吲哚里西丁氮杂糖以及细胞表面寡糖的合成

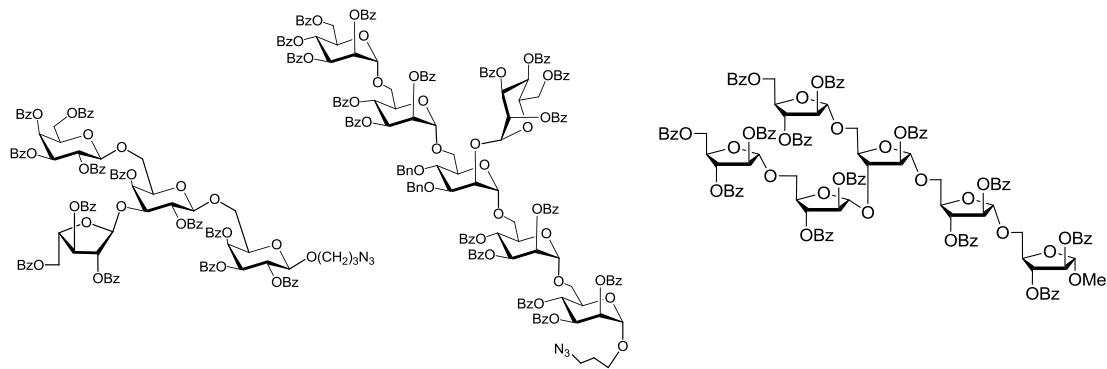
邵佳, 梁兴勇, 邓丽敏, 刘强维, 杨劲松*

(四川大学华西药学院, 四川 成都 610041)

Lentiginosine (斑荚素)、swainsonine (苦马豆素)和 castanospermine (澳栗精胺)等天然多羟基吲哚里西丁类生物碱具有与糖环相似的空间构象和羟基构型, 能模拟糖苷酶催化水解糖苷键所形成的过渡态, 从而具有优异的糖苷酶抑制活性。我们小组利用 Danishefsky 双烯与非活化的手性五元环亚胺的氮杂 Diels-Alder 反应, 高区域和高非对映选择性地一步构建多羟基吲哚里西丁骨架, 反应的化学收率最高达 73%, 非对映选择性最高达 >99:1。五元环亚胺可由廉价的 D/L-酒石酸或阿拉伯糖为起始原料进行合成。我们利用该反应简洁高效地完成了(+)-lentiginosine 及其对映异构体以及天然产物类似物 2-*epi*-steviamine 的全合成。



我们利用少保护糖苷化的策略, 完成了一系列具有重要生物学功能的吡喃和呋喃寡糖的一锅糖苷化组装。这些寡糖包括来自结核分支杆菌细胞表面的线型三糖 (2 个) 和分支六糖 (2 个) 结构片段、具有潜在免疫学功能的肺炎链球菌血清型 35A 荚膜多糖中线型 3 糖片段、分自茅苍术根茎中具有肠内免疫调节活性的分支四糖片段以及甜菜糖中的分支呋喃五糖片段。该方法相比其它寡糖合成策略而言, 具有快速高效的特点。通过该工作, 我们为寡糖, 尤其是分支寡糖的合成提供了新的途径, 能快速完成寡糖库的构建, 为深入的构效关系和生物活性研究提供原料。



【简历】杨劲松

教授，博士生导师

四川大学华西药学院

四川省成都市人民南路 3 段 17 号， 610041

电话：(86)-28-85503723, 85501393;

传真：(86)-28-85503723

E-mail: yjs@scu.edu.cn; yjscd@163.com

组页：http://pharmacy.scu.edu.cn/03rencaipeiyang/index_daoshi/bo/yangjs.htm



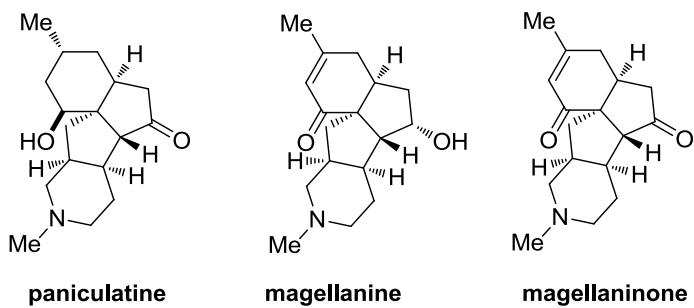
杨劲松，1992 年本科毕业于四川大学化学系，1995 年获南开大学有机化学专业硕士学位，1998 年获华西医科大学药物化学专业博士学位。1998 至 1999 年在日本东邦大学药学部做博士后研究。2000 年至今在四川大学华西药学院从事天然药物化学教学和科研工作，历任讲师、副教授、教授、博士生导师。主要从事复杂天然糖类化合物的全合成以及寡糖组装的方法学研究，近 5 年在国际学术刊物发表论文 12 篇。2008 年获教育部新世纪优秀人才支持计划以及四川省杰出青年基金资助。

Synthetic Studies on the Paniculatine-type *Lycopodium* Alkaloids

Yu-Rong Yang

State Key Laboratory of Phytochemistry and Plant Resources in West China,
Kunming Institute of Botany, CAS Email: yangyurong@mail.kib.ac.cn

Among the alkaloids in *Lycopodium* plants, paniculatine,¹ magellanine² and magellaninone³ are particularly interesting due to the unique structures, which are quite different from those of fawcettimine-type alkaloids accomplished recently by the mainland scholars.⁴ The highly condensed tetracyclic nucleus with five or six adjacent stereogenic centers is synthetically challenging. We will present our recent efforts toward a highly convergent and general strategy for this class of compounds.



References

- (a) Castillo, M.; Morales, G.; Loyola, L. A.; Singh, I.; Calvo, C.; Holland, H. L. *Can. J. Chem.* **1975**, *53*, 2513. (b) Castillo, M.; Morales, G.; Loyola, L. A.; Singh, I.; Calvo, C.; Holland, H. L. *Can. J. Chem.* **1976**, *54*, 2900. (c) Sha, C.-K.; Lee, F.-K.; Chang, C.-J. *J. Am. Chem. Soc.* **1999**, *121*, 9875.
- (a) Castillo, M.; Loyola, L. A.; Morales, G.; Singh, I.; Calvo, C.; Holland, H. L.; MacLean, D. B. *Can. J. Chem.* **1976**, *54*, 2893. (b) Hirst, G. C.; Johnson, T. O., Jr.; Overman, L. E. *J. Am. Chem. Soc.* **1993**, *115*, 2992. (c) Paquette, L. A.; Friedrich, D.; Pinard, E.; Williams, J. P.; St. Laurent, D.; Roden, B. A. *J. Am. Chem. Soc.* **1993**, *115*, 4377. (d) Yen, C.-F.; Liao, C.-C. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2002**, *41*, 4090. (e) Ishizaki, M.; Niimi, Y.; Hoshino, O.; Hara, H.; Takahashi, Y. *Tetrahedron* **2005**, *61*, 4053. (f) Kozaka, T.; Miyakoshi, N.; Mukai, C. *J. Org. Chem.* **2007**, *72*, 10147.
- Loyola, L. A.; Morales, G.; Castillo, M. *Phytochemistry* **1979**, *18*, 1721.
- (a) Zhang, X.-M.; Tu, Y.-Q.; Zhang, F.-M.; Shao, H.; Meng, X. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2011**, *50*, 3916. (b) Yang, Y.-R.; Shen, L.; Huang, J.-Z.; Xu, T.; Wei, K. *J. Org. Chem.* **2011**, *76*, 3684. (c) Li, H.; Wang, X.; Lei, X. *Angew. Chem. Int. Ed.* **2012**, *51*, 491.

【简历】杨玉荣

研究员，博士生导师

中国科学院“百人计划”择优资助

植物化学与西部植物资源持续利用国家重点实验室

中国科学院昆明植物研究所

昆明市黑龙潭蓝黑路 132 号, 650204

电话: (86)-871-5223126; 传真: (86)-871-5223179

E-mail: yangyurong@mail.kib.ac.cn



Yu-Rong Yang was born in Yunnan in 1977. He is currently a Research Professor in Organic Chemistry at the Kunming Institute of Botany (KIB). He received his BSc degree in chemistry from the Lanzhou University in 2000 where he remained to undertake his PhD studies (2000-2005) under the guidance of Professor Wei-Dong Li. He carried out postdoctoral studies at Harvard University (2005-2007) with Professor Yoshito Kishi before returning to hometown to take up a professorship in 2008 at the KIB. His research interests focus on the total synthesis of biologically important and structurally interesting natural products.

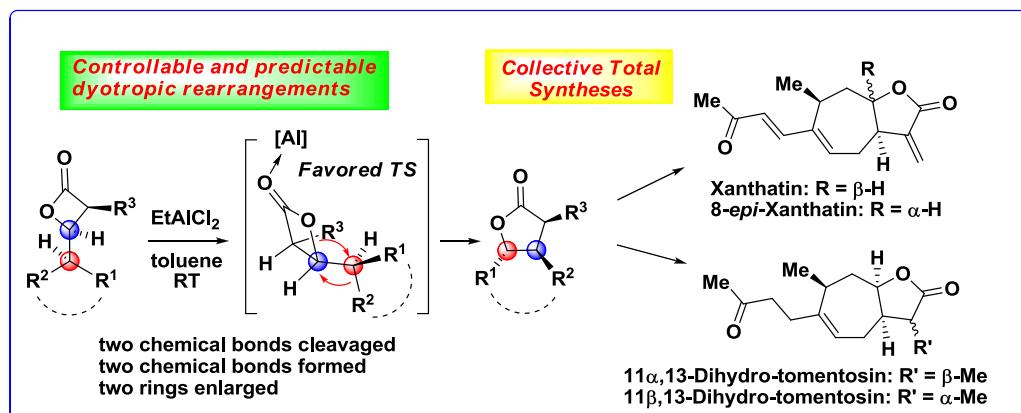
Development of Controllable Dyotropic Rearrangement of γ -lactone and Its Application in Natural Product Synthesis

可控性 γ -环丁内酯 dyotropic 重排反应研究及其在天然产物合成中的应用

唐叶峰

清华大学医学院药学系

利用骨架迁移和重排反应快速高效合成目标分子是有机合成化学研究热点之一, 其挑战性在于如何有效控制反应中化学键断裂和重组的化学、区域和立体选择性。 γ -环丁内酯在 Lewis 酸催化下可发生 dyotropic 重排反应生成 γ -环戊内酯^[1]。然而由于该反应受底物类型和反应条件影响较大, 产物分布往往难以控制和预测, 因而其在合成上的应用非常受限。我们组系统研究了具有三个连续手性中心的顺式 γ -环丁内酯的 dyotropic 重排反应, 建立了新的 Lewis 酸催化体系, 实现了该重排反应化学、区域和立体选择性可调可控, 且具有较好的底物适用性。在此基础上, 我们以 γ -环丁内酯 dyotropic 重排反应为关键步骤, 对两类具有重要生物活性的天然产物苍耳烷型倍半萜和百部生物碱展开全合成研究, 以简洁高效、立体可控的合成路线完成了上述天然产物 5-7 双环或 5-7-5 三环核心骨架的构建, 并结合多样性合成策略, 完成一系列该家族天然产物的全合成^[2]。



References:

[1]: (a) Mulzer, J.; Brüntrup, G. *Angew. Chem., Int. Ed.* **1979**, *18*, 793-794. (b) Mulzer, J.; Hoyer, K.; Müller-Fahrnow, A. *Angew. Chem., Int. Ed.* **1997**, *36*, 1476-1478.

[2]: Weiwu Ren, Yichao Bian, Ziyang Zhang, Hai Shang, Pengtao Zhang, Yuejie Chen, Zhen Yang, Tuoping Luo, Yefeng Tang, *Angew. Chem., Int. Ed.* **2012**, *51*, in press.

【简历】唐叶峰

副教授

清华大学艾滋病研究中心&清华大学医学院药物化学系

地址: 清华大学医学科学楼 A210; 邮编: 100084

电话: (86)-10-62784677;

E-mail: yefengtang@tsinghua.edu.cn



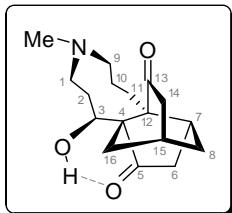
唐叶峰, 本科毕业于兰州大学化学系 (1995-1999), 其后在中国医学科学院药物研究所获硕士学位; 2003-2006 在北京大学化学与分子工程学院杨震教授指导下获博士学位, 随后在美国 The Scripps Research Institute KC Nicolaou 教授实验室从事博士后研究。自 2010 年 5 月起, 在清华大学医学院药学系和艾滋病研究中心任副教授, 开展独立研究工作, 主要从事有机合成、药物化学以及化学生物学方面的研究, 包括: (1) 发展快速、高效、实用和新颖的有机合成方法学, 并用于具有新颖化学结构、重要生物活性以及奇特生源途径的复杂天然产物全合成; 2) 抗病毒 (HIV、HCV 以及 HBV) 药物分子的设计、合成以及活性评估。自 2010 年开展独立研究工作至今, 先后完成了包括 Rossinone B, Katsumadain C 和 Xanthanolides 家族多个天然产物的全合成。另外, 和北大杨震教授一起合作完成了极具挑战性的 Schindilactone A 分子的全合成。目前为止, 在本研究领域重要期刊如 *JACS*, *ACIE*, *OL* 和 *CC* 上发表论文 20 余篇, 总引用次数达 500 余次。

Synthetic Studies of the *Lycopodium* alkaloid Palhinine A

Chun-An FAN (樊春安)

State Key Laboratory of Applied Organic Chemistry & College of Chemistry and Chemical Engineering, Lanzhou University, 222 Tianshui Nanlu, Lanzhou 730000, CHINA

E-mail: fanchunan@lzu.edu.cn, Tel.&Fax: +86-931-8915516



Palhinine A

Palhinine A as one of *Lycopodium* alkaloids was isolated from *Palhinhaea cernua* L. in 2010, and structurally it was featured by the unique tetracyclic framework with five stereogenic centers (two contiguous all-carbon quaternary centers) and one nine-membered nitrogen-containing ring. Presently, there is no report on the total synthesis of Palhinine A. Due to its intriguing bridged core skeleton as well as the potential biological interest, the synthetic studies of Palhinine A was conducted strategically on the basis of intramolecular Diels-Alder reaction as one of key steps. In this report, we will present the recent efforts on the architectural establishment of bridged tricyclic core of Palhinine A.

【简历】樊春安

教授, 博士生导师

兰州大学化学化工学院

功能有机分子化学国家重点实验室

甘肃省兰州市天水南路 222 号, 730000

电话: (86)-931-8915516; 传真: (86)-931-8915516

E-mail: fanchunan@lzu.edu.cn



1999 年毕业于兰州大学化学化工学院有机化学专业, 2004 年获兰州大学有机化学专业理学博士学位。2004 年 10 月至 2005 年 9 月作为法国国家科学研究中心博士后研究员在法国巴黎第十一大学 Henri B. Kagan 教授研究小组从事手性化学研究。2005 年 11 月至 2007 年 10 月作为洪堡学者在德国波恩大学 Andreas Gansaeuer 教授研究小组从事不对称催化研究。2007 年 11 月回国, 工作于兰州大学化学化工学院、功能有机分子化学国家重点实验室。目前主要从事生物活性分子合成、有机合成方法学以及不对称催化研究。

Biomimetic Synthesis: Efficiency, Inspiration and Simulation

Ran Hong (洪然)

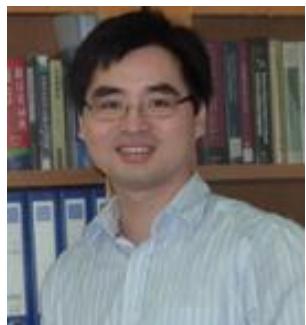
CAS Key Laboratory of Synthetic Chemistry of Natural Substances,
Shanghai Institute of Organic Chemistry, CAS, Shanghai 200032

Mimicking fantastic transformations that involve enzyme participation in nature is a great challenge to synthetic chemists. Cationic cyclization has been widely appreciated as a powerful tool for organic synthesis for numerous natural products. Development of novel cationic transformation stands for a highly desirable field. Following the steps of proposed biosynthetic pathway, a biomimetic approach sets out to simulate the iminium ion-initiated cyclization in the proposed biosynthesis of stemoamide. Tetrapetalones and cephalotaxine alkaloids are also chosen for exploiting the bioinspired cationic cyclization. A successful model study on assembling the 6/5/7/5 ring system and aza-spiro ring structure dictates the feasibility of cationic approach. Several recent intriguing cases in this laboratory will be presented.

【简历】洪然

研究员, 博士生导师

中科院天然产物有机合成化学重点实验室
中国科学院上海有机化学研究所
上海市徐汇区零陵路 345 号, 200032
电话: (86)-21-54925161; Fax: (86)-21-64166128
E-mail: rhong@sioc.ac.cn;
小组网页: honglab.labways.com



个人介绍: 1996 年毕业于四川大学化学系物化专业, 2001 年获得中科院上海有机所理学博士学位 (导师: 林国强研究员)。先后在 University of Houston 的 Jay K. Kochi 实验室和 Brandeis University 大学 Li Deng 实验室从事博士后研究。2007 年加入中科院上海有机所, 获得中国科学院“百人计划”择优支持 (2010) 和上海市青年科技启明星 (2008)。目前担任“拜尔-上海有机所药物联合研发项目”的项目科学顾问 (2010-) 和“浙江医药-上海有机所药物联合实验室”的项目负责人 (2010-)。致力于将酶催化的策略应用于反应方法学的发展和具有重要生理活性的复杂天然产物全合成研究。

若干萜类天然产物的全合成研究

刘 波

四川大学化学学院, 成都, 610064

*Email: chembliu@scu.edu.cn

萜类化合物是天然产物中结构多样性最为广泛的分子集合之一, 其中众多化合物具有重要的生物活性。从向日葵中分离出的heliespirool和heliespirone类倍半萜化合物被证明具有较好的除草活性, 特别是heliespirone类化合物具有有趣的氧杂螺环结构, 我们通过简洁的路线合成得到这类天然产物, 并发现不同官能化导致的构象效应强烈影响反应的立体选择性。^[1]半个世纪以来, 天然产物化学家从金粟兰属植物中分离了近90种结构独特的乌药烷型倍半萜及其二聚体, 其中包括倍半萜金粟兰内酯chloranthalactones A—G、银杏草内酯shizukanolides A—F等及二聚体shizukaols A—P、chlorahololides A—F、spicachlorantins A—J、chloramultilides A—D等, 这些天然产物中, 大多数展示了良好的生物活性, 从易得的商品化试剂出发, 我们成功构建了这类倍半萜的*cis, trans*-3/5/6并环骨架结构, 完成了倍半萜金粟兰内酯和银杏草内酯的消旋及不对称合成。^[2]Leucosceptroid类化合物是2010年分离的一类结构新颖、具有昆虫拒食活性的二倍半萜, 具有多个叔碳和季碳手性中心及5/6/5顺-反并环骨架结构, 我们也对这类天然产物展开了全合成研究。

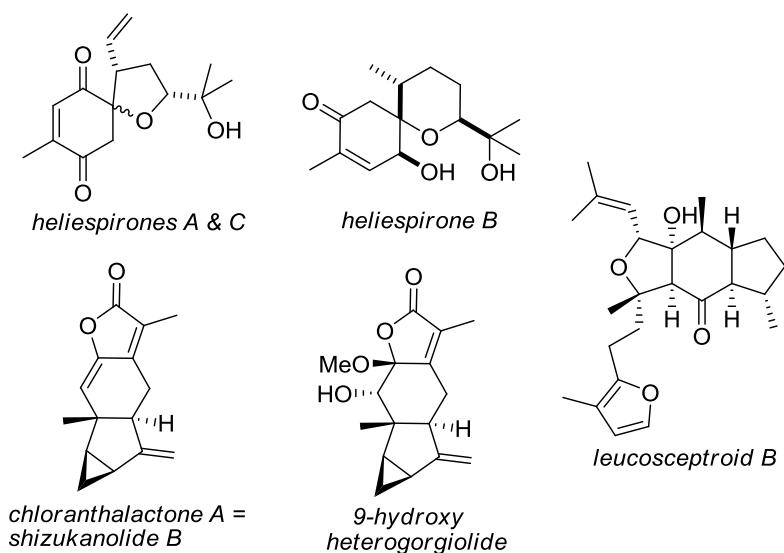


Fig. 1 Selected Target Molecules

关键词: 倍半萜; 乌药烷; 金粟兰内酯; 银杏草醇; 全合成

参考文献

- [1] Chong Huang, Bo Liu*, *Chem. Commun.* **2010**, 46, 5280.
- [2] Yue, G.; Yang, L.; Yuan, C.; Jiang, X.; Liu, B. *Org. Lett.* **2011**, 13, 5406.

【简历】刘波

教授，博士生导师

教育部绿色化学与技术重点实验室

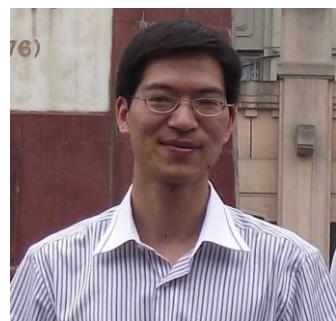
四川大学化学学院

成都市望江路 29 号， 610064

电话: (86)-28-85413712; Fax: (86)-28-85413712

E-mail: chembliu@scu.edu.cn

小组网页: <http://chem.scu.edu.cn/professor/liubo.htm>



1994.9.---1998.7. 在西南师范大学化学化工学院学习，环境学专

1998.9.---2001.7. 在中科院成都有机化学研究所学习，硕士研究生，主要从事不对称催化反应研究；

2001.9.---2004.7. 在中科院上海有机化学研究所学习，博士研究生，主要从事天然产物全合成研究；

2004.9.---2007.3. 在美国德克萨斯大学西南医学中心作博士后研究，主要从事过渡金属催化的反应研究及天然产物全合成；

2007.6.--- 至今 四川大学化学学院从事教学科研工作

研究领域介绍: 主要致力于有生理活性的天然产物全合成，目前的研究重点是复杂萜类天然产物的多策略全合成。

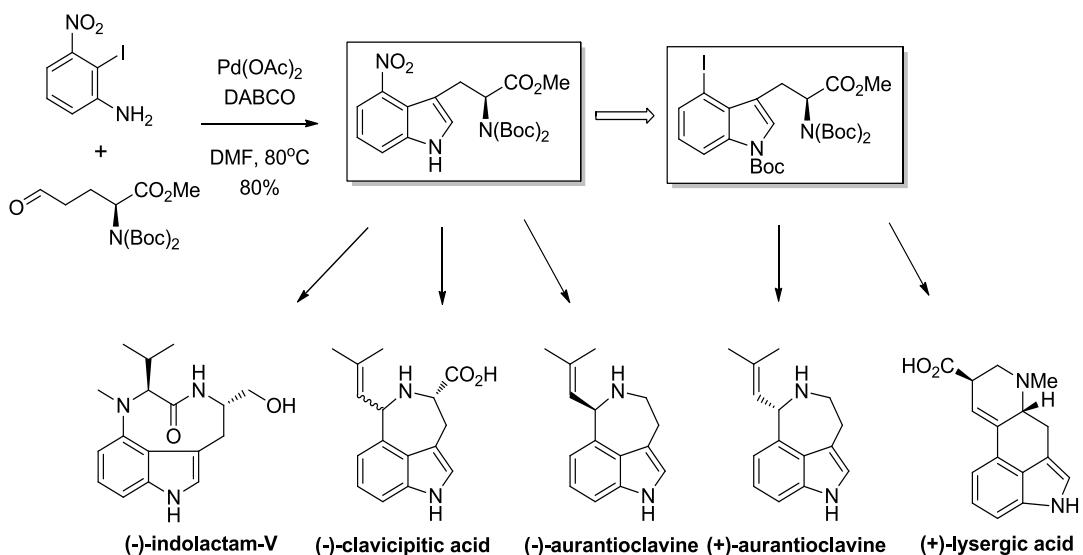
几种吲哚生物碱的全合成研究

贾彦兴

北京大学药学院、天然药物及仿生药物国家重点实验室

3,4-二取代吲哚生物碱 (+)-lysergic acid (麦角酸)、(-)-clavicipitic acid、(-)-indolactam V、(-)-和(+)-aurantioclavine 等是一类结构特殊的吲哚生物碱。由于其多取代吲哚的独特结构特征和良好的生物活性,这些分子早已引起有机合成化学家的广泛兴趣。但用经典的合成方法制备这些 3,4 二取代的吲哚仍然存在一些困难,尤其是直接构筑 4 位取代的手性色氨酸。

我们利用钯催化合成吲哚的新方法¹能够快速、大量制备手性的 4-硝基色氨酸,其可用于 ILV 的手性全合成,²4-硝基色氨酸可转化生成 4-碘色氨酸衍生物,以其为关键中间体,完成了 clavicipitic acid、aurantioclavine³、和麦角酸 (lysergic acid)⁴的手性全合成。至此,我们以同一中间体 4-硝基色氨酸完成了吲哚生物碱 lysergic acid、clavicipitic acid、indolactam V、和 aurantioclavine 的集体手性全合成⁵。



References:

1. Yanxing Jia, Jieping Zhu*. *J. Org. Chem.* **2006**, *71*, 7826–7834.
2. Zhengren Xu, Fengying Zhang, Lihe Zhang, Yanxing Jia*. *Org. Biomol. Chem.* **2011**, *9*, 2512–2517.
3. Zhengren Xu, Weimin Hu, Qiang Liu, Lihe Zhang, Yanxing Jia*. *J. Org. Chem.* **2010**, *75*, 7626–7635.
4. Qiang Liu, Yanxing Jia*. *Org. Lett.* **2011**, *13*, 4810–4813.
5. Jones, S. B.; Simmons, B.; Mastracchio, A.; MacMillan, D. W. C. *Nature* **2011**, *475*, 183–188.

【简历】贾彦兴

教授, 博士生导师

生于 1975 年 5 月 1 日, 河北满城
地址 天然药物及仿生药物国家重点实验室
北京大学药学院
北京市海淀区学院路 38 号, 100191
电话 & 传真: +86-10-82805166
邮箱: yxjia@bjmu.edu.cn



学习经历:

1993-1997 理学学士, 兰州大学化学系应用化学专业
1997-2002 理学博士, 兰州大学化学系有机化学专业 (导师: 涂永强 院士)
2002-2007 博士后, 法国国家科学研究中心, 天然产物化学研究所 (导师: 祝介平)

任职:

2007.8 副教授, 北京大学, 课题组长
2011.8 教授, 北京大学

研究方向与兴趣:

1. 具有重要生物活性天然产物的全合成及仿生合成;
2. 药物合成及构效关系研究;
3. 有机合成新方法、新策略的研究。

获奖情况:

2011 2011 CAPA Distinguished Faculty Award (Chinese-American Chemistry & Chemical Biology Professors Association) (中美化学与化学生物学教授联合会“杰出青年教授奖”)
2010 Asian Core Program Lectureship Award, the Asian Cutting-Edge Organic Chemistry programs, 2010
2009 新世纪优秀人才支持计划
2008 第十一届中国药学会-施维雅青年药物化学奖
2002 甘肃省科技进步奖, 一等奖 (排名第五)

论文及专著:

迄今为止已在国内外重要学术刊物上发表研究论文 45 篇。

附件一：“天然产物全合成—青年学术研讨会”邀请报告人名单

谢志翔（兰州大学）
樊春安（兰州大学）
刘波（四川大学）
杨劲松（四川大学）
宋振雷（四川大学）
杨玉荣（昆明植物所）
李闯创（深圳研究生院）
王智刚（深圳研究生院）
蒋晟（广州医药健康研究院）
郑啸（厦门大学）
魏邦国（复旦大学）
李昂（上海有机所）
洪然（上海有机所）
贾彦兴（北京大学）
雷晓光（NIBS、天津大学）
唐叶峰（清华大学）
梁广鑫（南开大学）

特邀报告（19日下午专题）：“天然产物与药物化学和化学生物学”

秦勇（重庆大学药学院）
姚祝军（中科院上海有机所）
南发俊（中科院上海药物所）
刘文（中科院上海有机所）

附件二：“天然产物全合成—青年学术研讨会”邀请参加人员名单

Natural Product Synthesis—Young Investigator Forum 2012

课题组（单位）	联系方式
刘波（四川大学）	chembliu@scu.edu.cn
陈小川（四川大学）	chenxc@scu.edu.cn
宋振雷（四川大学）	zhenleisong@scu.edu.cn
杨劲松（四川大学）	yjs@scu.edu.cn
董琳（四川大学）	dongl@scu.edu.cn
杨玉荣（中科院昆明植物所）	yangyurong@mail.kib.ac.cn
吴滨（中科院昆明植物所）	wubin@mail.kib.ac.cn

夏成峰 (中科院昆明植物所)	xiachengfeng@mail.kib.ac.cn
秦红波 (中科院昆明植物所)	qinhongbo@mail.kib.ac.cn
姚和权 (中国药科大学)	hyao@cpu.edu.cn
贾彦兴 (北京大学)	yxjia@bjmu.edu.cn
梁广鑫 (南开大学)	lianggx@nankai.edu.cn
陈悦 (南开大学药学院)	yuechen@nankai.edu.cn
唐叶峰 (清华大学药学院)	yefengtang@gmail.com
雷晓光 (天津大学, NIBS)	leixiaoguang@nibs.ac.cn
何伟 (清华大学药学院)	whe@mail.tsinghua.edu.cn
黄木华 (北京理工大学)	mhhuang@bit.edu.cn
李明 (中国海洋大学)	lmsnouc@ouc.edu.cn
刘军 (中科院生态环境研究中心)	junliu@rcees.ac.cn
韩福社 (中科院长春应化所)	fshan@ciac.jl.cn
王博 (中科院长春应化所)	wangbo@ciac.jl.cn
王保民 (大连理工大学)	baominwang@hotmail.com
何宇鹏 (辽宁石化大学)	yupeng.he@googlemail.com
吴彦超 (哈尔滨工业大学)	ycwu@iccas.ac.cn
刘磊 (山东大学)	liuleipitt@gmail.com
唐宇 (天津大学)	tangyu114@gmail.com
樊春安 (兰州大学)	fanchunan@lzu.edu.cn
谢志翔 (兰州大学)	xiezx@lzu.edu.cn
彭羽 (兰州大学)	pengyu@lzu.edu.cn
王少华 (兰州大学)	wangshh@lzu.edu.cn
马宝春 (兰州大学)	mabaochun@lzu.edu.cn
张辅民 (兰州大学)	zhangfm@lzu.edu.cn
谢新刚 (兰州大学)	xiexg@lzu.edu.cn
王永强 (西北大学)	wangyq@nwu.edu.cn
胡向东 (西北大学)	xiangdonghu@nwu.edu.cn
李鹏飞 (西安交通大学)	lipengfei.fist@yahoo.com.cn

洪然 (中科院上海有机所)	rhong@sioc.ac.cn
汤文军 (中科院上海有机所)	tangwenjun@sioc.ac.cn
李昂 (中科院上海有机所)	ali@sioc.ac.cn
孙建松 (中科院上海有机所)	jssun@sioc.ac.cn
孙炳峰 (中科院上海有机所)	bfsun@sioc.ac.cn
丁凯 (中科院上海有机所)	dingkai@sioc.ac.cn
谢卫清 (中科院上海有机所)	xiewq@sioc.ac.cn
魏万国 (上海高等研究院)	weiwg@sari.ac.cn
魏邦国 (复旦大学)	bgwei1974@fudan.edu.cn
高栓虎 (华东师范大学)	shgao@chem.ecnu.edu.cn
姜雪峰 (华东师范大学)	jiangxf@scripps.edu
俞寿云 (南京大学)	yushouyun@nju.edu.cn
郑文华 (南京大学)	whzheng1@gmail.com
顾振华 (中国科学技术大学)	zhgu@ustc.edu.cn
王智刚 (北大深圳研究生院)	asycata@gmail.com
李闯创 (北大深圳研究生院)	chuangli@pku.edu.cn
蒋晟 (广州医药健康研究院)	jiang_sheng@gibh.ac.cn
李志成 (北大深圳研究生院)	lizc@szpku.edu.cn
蔡倩 (广州医药健康研究院)	cai_qian@gibh.ac.cn
吴筱星 (广州医药健康研究院)	wu_xiaoxing@gibh.ac.cn
史炳锋 (浙江大学)	bfshi@zju.edu.cn
丁寒峰 (浙江大学)	hfding@zju.edu.cn
郑啸 (厦门大学)	zxiao@xmu.edu.cn
张延东 (厦门大学)	ydzhang@xmu.edu.cn
陆红健 (南京大学)	hongjianlu@gmail.com

庆祝周维善院士九十华诞学术论文专辑征稿启事

2012年7月是我国著名有机化学家、中国科学院资深院士周维善教授九十华诞。周维善教授于1923年7月14日生于浙江绍兴；1949年毕业于国立上海医学院药学系并留校任教；1952-1956年在军事医学科学院化学系师从著名有机化学家黄鸣龙教授从事科研工作；1956年随黄鸣龙先生调到中国科学院上海有机化学研究所从事科研工作。1991年当选为中科院院士。周维善教授五十多年来主要从事甾体化学、萜类化学和不对称合成研究，为我国甾体激素工业的创建和发展作出了贡献。他参与七步可的松和甾体口服避孕药甲地孕酮（即已广为应用的二号甾体口服避孕药）等的合成。他主持并参与光学活性高效口服避孕药18-甲基炔诺酮的不对称全合成，已投入工业生产并出口。在国际上首次利用我国丰产的猪去氧胆酸为原料发展了新甾体植物生长调节剂油菜甾醇内酯类化合物的合成方法，合成的油菜甾醇内酯类化合物已在田间试用并取得了显著的效果。他主持并参与首次测定了抗疟新药青蒿素的结构并又主持和参与它的全合成。改良了 Sharpless 烯丙醇的不对称环氧化试剂，使其更具有使用价值和扩大了应用范围。并首次将 Sharpless 烯丙醇不对称环氧化反应扩展到烯丙胺- α -糠胺的动力学拆分，并将其应用于天然产物的合成。他还组织领导在我国先期开展昆虫性信息素合成，合成的棉红铃虫性信息素曾用于害虫测报和防治，效果显著。

值此庆贺周维善教授九十华诞之际，《中国化学》编辑部特邀请林国强院士作为特约编辑，进行学术论文专辑的组稿工作（2013年第一期）。

一、稿件要求和格式

应征论文：必须是尚未发表的化学领域中的最新研究成果，应具有原始性和独创性。
所征论文须经专家评审后录用。

论文形式：研究论文、研究通讯、研究专题，其中包括中、英文摘要和图文摘要等。

论文格式：参见《中国化学》（英文版）的投稿须知（available at
<http://www.cjc.wiley-vch.de> under “Author Guidelines”）

投稿时，请注明“庆祝周维善院士九十华诞学术论文专辑”字样。

投稿截止日期：2012年10月20日。

稿件修回日期：2012年11月20日。

二、投稿方式

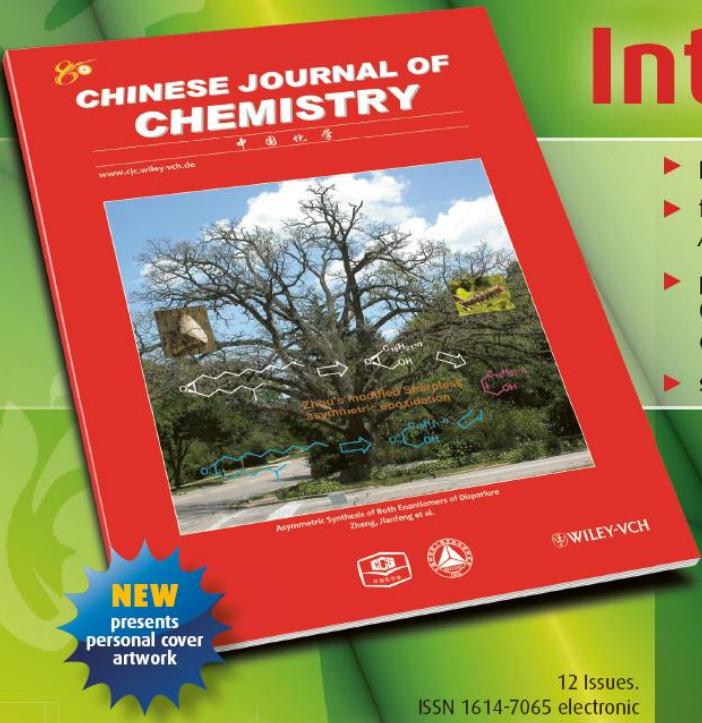
请通过网络投稿（本刊新开通 ScholarOne Manuscript 稿件处理系统，第一次投稿请先注册）。网址：<http://mc.manuscriptcentral.com/cjoc>（投稿时在“Is this submission for a special issue?”一栏中选择 Yes）

特约编辑：林国强 研究员



《中国化学》编辑部

2012年5月30日



CHINESE JOURNAL OF CHEMISTRY
www.cjc.wiley-vch.de
80
年
中
国
化
学
Asymmetric Synthesis of Both Enantiomers of Dapoxetine
Zhang, Jianfeng et al.
WILEY-VCH

12 Issues.
ISSN 1614-7065 electronic
www.cjc.wiley-vch.de

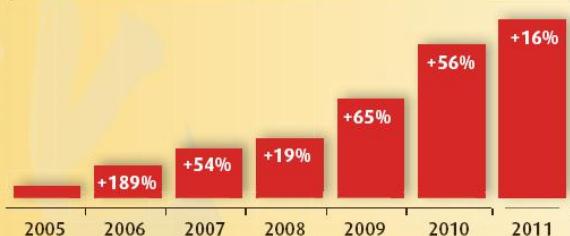
Going International

- peer-reviewed
- founded in 1983 under the name *Acta Chimica Sinica English Edition*
- published by the Shanghai Institute of Organic Chemistry (SIOC), Chinese Academy of Sciences (CAS) and Wiley-VCH
- supported by the Chinese Chemical Society

Editor-in-Chief
Guozhen Ji
SIOC, CAS
e-mail: jigz@mail.sioc.ac.cn

Deputy Associate Editor-in-Chief
Shengming Ma
SIOC, CAS and Zhejiang University
e-mail: masm@mail.sioc.ac.cn

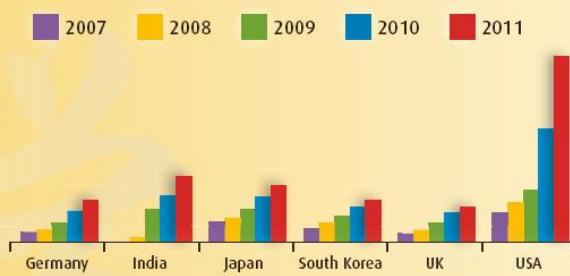
Development of Full-text Downloads 2005-2011



International Advisory Board

Eric V. Anslyn, University of Texas (Austin, USA)
Thorsten Bach, Technische Universität München (Germany)
Jinpei Cheng, Nankai University (Tianjin, China)
Kendall N. Houk, University of California (Los Angeles, USA)
Yuansheng Jiang, Nanjing University (China)
Charles M. Lieber, Harvard University (Cambridge, USA)
Xiyan Lu, Chinese Academy of Sciences (Shanghai, China)
Hiroki Oshio, University of Tsukuba (Japan)
Peter J. Sadler, University of Warwick (UK)
Masato Tanaka, Tokyo Institute of Technology (Yokohama, Japan)
Zhongqun Tian, Xiamen University (China)
Erkang Wang, Changchun Institute of Applied Chemistry, CAS (China)

Development of International Usage



WILEY
ONLINE LIBRARY
wileyonlinelibrary.com

WILEY-VCH

For subscription details please
contact Wiley Customer Service:

► cs-journals@wiley.com
(Americas, Europe, Middle East,
Africa, Asia Pacific)

► cs-germany@wiley.com
(Germany, Austria, Switzerland)

► cs-japan@wiley.com
(Japan)



梅特勒-托利多 自动化化学

提供全自动反应器技术和过程分析技术(PAT)，帮助加速化合物的发现、开发和生产过程



EasyMax™
新一代实验室合成反应器

- 触摸屏控制界面
- 无需油浴和冰水浴
- 新的控温原理
- 实时数据记录功能
- 在线显示热流信息



RC1e™
全自动反应量热器

- 了解反应过程的手段
- 轻松表征反应的途径
- 过程优化的理想工具
- 安全评价的必需工具
- 化工放大的黄金标准



ReactIR™
实时原位FTIR技术

- 反应起点/终点
- 反应进程
- 中间体
- 浓度/转化率
- 反应机理和动力学
- 结晶过程的过饱和度



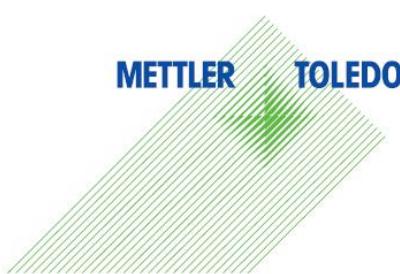
FBRM®和PVM®
实时原位颗粒表征技术

- 粒径、粒数变化程度和变化速率
- 颗粒形貌变化
- 将颗粒的动态变化同工艺条件相关联
- 结晶工艺开发的理想工具

了解更多的产品和应用信息请登录
www.mt.com/autocom

参加或观看在线研讨会请登录
www.mt.com/webinars

参加化学工艺研发与放大的博客请登录
<http://cn.blog.autocom.mt.com>



联系人：
李津：13916460076 邮箱：Gary.li@mt.com
刘慧敏：13761558639 邮箱：Selina.liu@mt.com
通信地址：上海市桂平路589号
邮政编码：200233
网 址：www.mt.com



公司介绍

“以专业的团队和专业的服务”打造一个专业的化学生物试剂公司，这是北京伊诺凯科技有限公司的理念。伊诺凯团队的核心成员，均拥有全球著名化学试剂企业的专业管理背景，公司依托强大的核心团队阵容，以及全球供应商资源，致力于为全球科学家提供优质、综合、全面的化学产品、生命科学试剂和实验室仪器、耗材等，实现一站式服务。

伊诺凯总部位于北京，在美国、香港及上海设有分公司，广州设有办事处。伊诺凯坚持与国际接轨，注重和国际先进企业的合作与交流。其主营业务分为进口品牌代理业务、自主品牌业务及出口业务。

自有品牌： InnoChem

独家代理： 化学试剂：Acros(北方) Maybridge(北方) Accela(北方) HiPureChem

仪器耗材：Boost

非独家代理： 化学试剂：Fisher Chemical TCI Alfa Matrix Apollo Frontier

标准品：USP EP LGC

生化试剂：MP Amresco

仪器耗材：Fisherbrand/LabServ DragonLab



Tel: 400-810-7969

Web: www.inno-chem.com.cn

北京：Tel: 010-59572699 Fax: 010-59572688 Email: info@inno-chem.com.cn

上海：Tel: 021-31262711 Fax: 021-31262711-208 Email: sales@inno-chem.com.cn



全球知名的科研化学品一站式供应商

超过3,3000种产品
近5000种新产品
中国十万多瓶现货库存
当天发货
专业的全球采购
最新推出的强大的电子目录
手机网站（支持Ipad）

Alfa Aesar®
A Johnson Matthey Company

www.alfa.com

800 810 6000 400 610 6006



梯希爱(上海)化成工业发展有限公司

Moving Your Chemistry Forward

梯希爱(上海)化成工业发展有限公司是一家全球领先的化学试剂生产企业。公司以优质的服务,为客户提供21,000多种高品质有机化学试剂,同时我们拥有60多年的生产经验和各种规模的生产设备,可以满足客户对大包装及委托合成服务的要求。公司的宗旨是通过高品质的化学试剂支持各领域的研究和开发,为全世界的化学产业和社会发展做出自己的贡献。

TCI (Shanghai) Development Co., Ltd. is a leading international manufacturer of specialty organic chemicals. We supply more than 21,000 laboratory chemicals. With over 60 years experience and various scale manufacturing plants, TCI satisfies your bulk and customer synthesis requirements. Our aim is to support "R&D activities" by providing a wide variety of laboratory reagents, and to contribute to the development of chemical industry and society all over the world.

试剂产品

有机实验室化学品: • 有机合成化学 • 功能性材料 • 生物化学/糖链 • 分析化学等
精细与专用化学品: • 电致发光化合物 • 液晶结构单元 • 手性结构单元 • 离子液体
• 冠醚等

委托合成

• 有机化合物中间体 • 功能性材料 • 导电及光学材料 • 医药原料药及中间体
• 临床实验用新药 • 化妆品原料药 • 糖链化学 • 化合物库等

色谱柱

• TCI Chiral • TCI Dual • TCI ODS

常规反应类型

• 糖链合成 • 卤化反应 • 不对称合成 • 高压反应 • 发酵 • 升华精制

www.TCIchemicals.com/zh/cn/



翔雅仪器



上海翔雅仪器设备有限公司

» 向客户提供四十多种科研设备产品 经销上千种实验室耗材 欢迎索取详细资料!

- 低温冷却液循环泵 (-10 ~ -120) (2L~100L)
- 低温 (恒温) 搅拌反应浴 (-40 ~ -80) (2L ~ 5L)
- 旋转蒸发仪 (2L ~ 50L)
- 各种高真空油泵循环水式多用真空泵、全套合成实验室设备及装修

地址: 上海市浦东新区孙桥路558弄36号 邮编: 201210 电话: 021-58952903
传真: 021-58952903 邮箱: info@nanoelegant.com 网址: www.nanoelegant.com

中国科学院上海有机化学研究所, 中国上海, 2012年6月19-20日