

第五章 药物合成的重要原料
——卤代烃、胺、酰胺

第三节 有机合成设计

课时1 有机合成设计

授课人：



学习目标

- 1.认识同一分子中官能团之间存在相互影响。
- 2.能基于官能团、化学键的特点与反应规律分析和推断含有典型官能团的有机化合物的化学性质。根据有关信息书写相应的反应式。
- 3.认识加成、取代、消去反应及氧化还原反应的特点和规律。了解有机反应类型和有机化合物组成结构特点的关系。
- 4.认识有机合成的关键是碳骨架的构建和官能团的转化。
- 5.了解设计有机合成路线的一般方法。



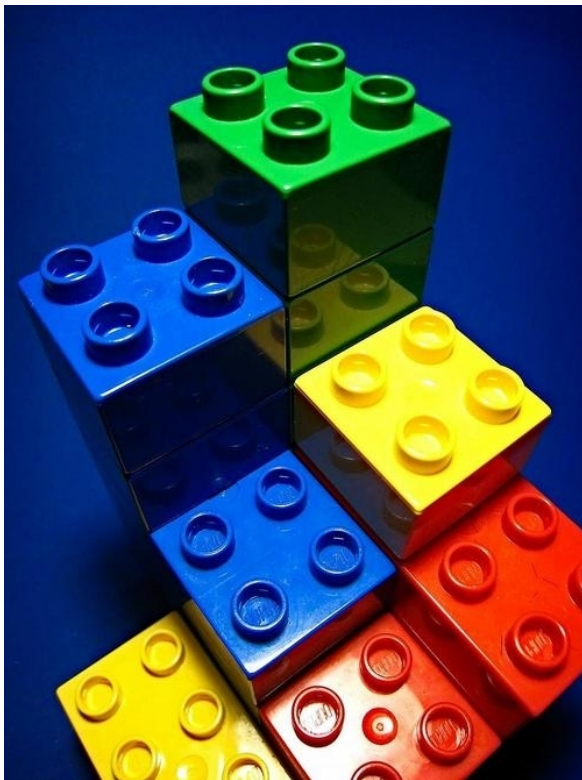
有机合成化学工业的发展



**制备天然有机物，以弥补自然资源的不足；
对天然有机物进行局部的结构改造和修饰，
使其性能更加完美。**

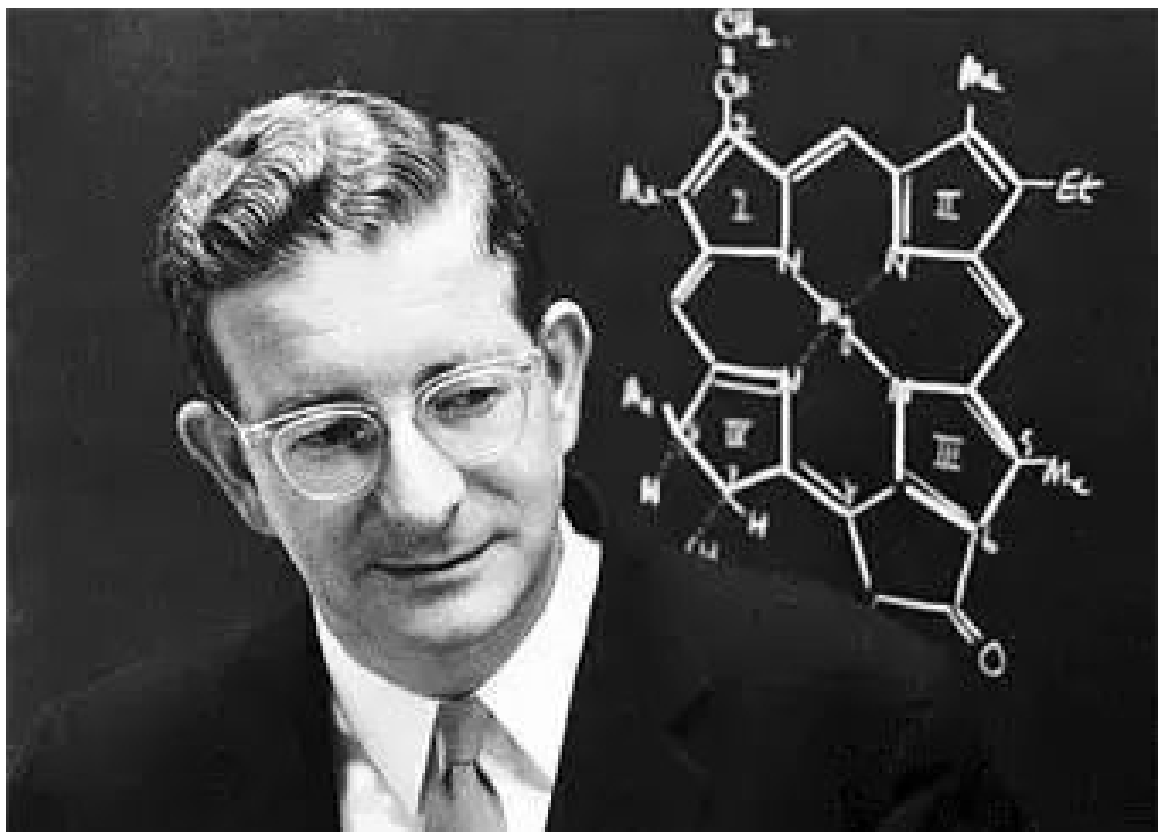


有机合成化学工业的发展



有特定性质的、自然界并不存在的有机物，以满足人类的特殊需要。

有机合成化学工业的发展



有机化学家伍德沃德

有机合成的威力是在“老的自然界旁边”建立起一个“新的自然界”。

有机合成化学工业的发展

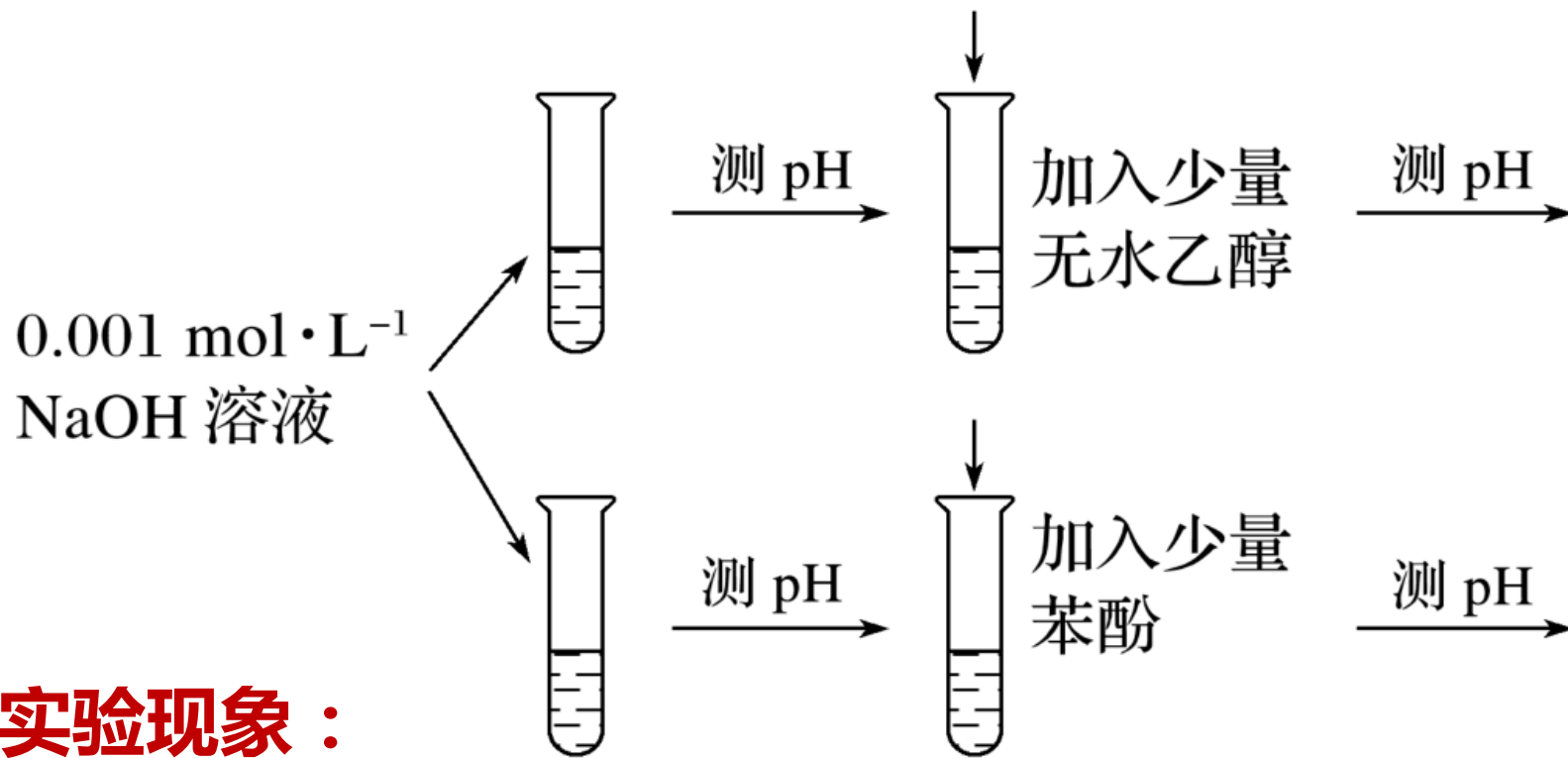
概念

有机合成就是利用**简单、易得的原料**，通过一系列有机化学反应，生成**具有特定结构和功能的有机化合物**的过程。

任务

目标化合物分子骨架的构建和官能团的转化。

一、有机物基团间的相互影响



实验现象：

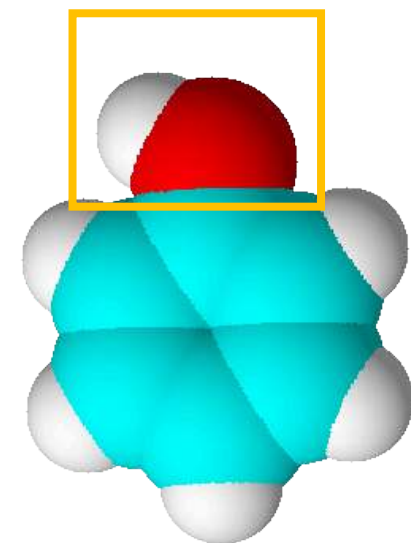
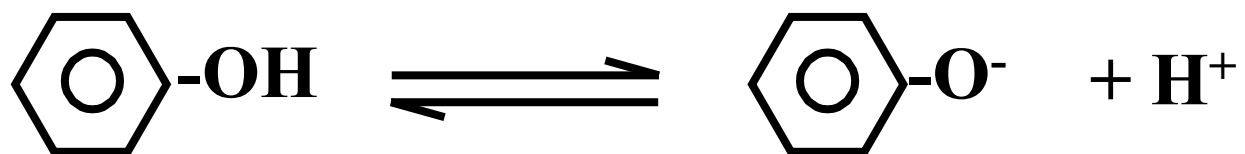
开始时两试管中NaOH溶液的pH相同；

加入乙醇的试管中pH不变，而加入苯酚的试管中pH减小。

一、有机物基团间的相互影响

微观解释：

苯酚分子中的苯基影响了与其相连的羟基上的氢原子，促使它比乙醇分子中羟基上的氢原子更易电离。



苯酚空间填充模型

一、有机物基团间的相互影响

比较苯和苯酚的溴代反应

	苯	苯酚
反应物	<u>苯、液溴</u>	<u>苯酚、溴水</u>
反应条件	<u>Fe、常温</u>	<u>常温</u>
被取代的H数	<u>1</u>	<u>3</u>
反应速率	<u>慢</u>	<u>快</u>
微观解释	羟基影响了与其相连的苯基上的氢原子，使邻、对位的氢原子更活泼，更容易被其他原子或原子团取代。	

有机化合物分子中基团之间是相互影响和相互制约的。

一、有机物基团间的相互影响



反应条件对有机反应的影响

(1) 烷烃、烯烃、苯与溴的反应

烷烃与液溴在光照条件下发生取代反应，与溴水不反应；

烯烃与溴水、溴的四氯化碳溶液发生加成反应，使溴水褪色；

苯与液溴在 FeBr_3 作催化剂条件下发生取代反应。

一、有机物基团间的相互影响



反应条件对有机反应的影响

(2)乙醇失水的反应

乙醇在浓 H_2SO_4 作用下， $140\text{ }^\circ\text{C}$ 发生分子间脱水生成乙醚，在 $170\text{ }^\circ\text{C}$ 发生分子内脱水生成乙烯。

(3)催化剂对反应的影响

有机反应中常用到催化剂，选择合适的催化剂，加快反应速率，如乙醇氧化时选用 Cu 、 Ag 作催化剂，乙烯与 H_2 加成时选择 Ni 作催化剂，酯化反应选择浓 H_2SO_4 作催化剂。

一、有机物基团间的相互影响



有机溶剂对反应的影响

卤代烃的水解选择NaOH水溶液加热反应，
而消去反应选择NaOH醇溶液加热反应，其中醇作溶剂。

典例解析

例1 下列说法不符合事实的是(**C**)

A . 苯酚的水溶液呈酸性，说明苯环对羟基有影响，使羟基变得活泼

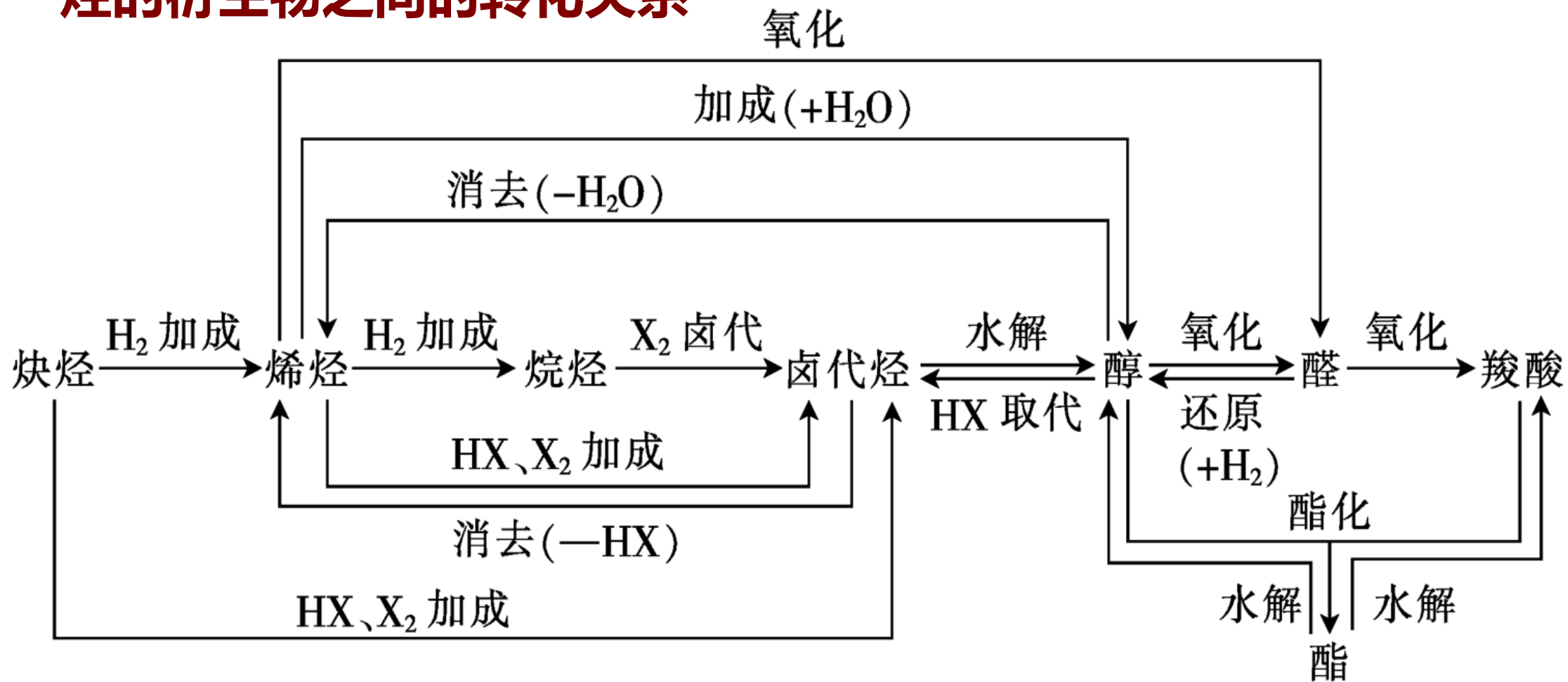
B . 甲苯能使酸性 KMnO_4 溶液褪色，说明苯环活化了甲基

C . 苯酚和溴水发生反应产生沉淀，说明苯环对酚羟基产生影响

D . 甲苯和浓硝酸、浓硫酸发生反应生成2, 4, 6-三硝基甲苯，说明甲基活化了苯环的邻、对位的氢原子

二、重要有机物之间的相互转化

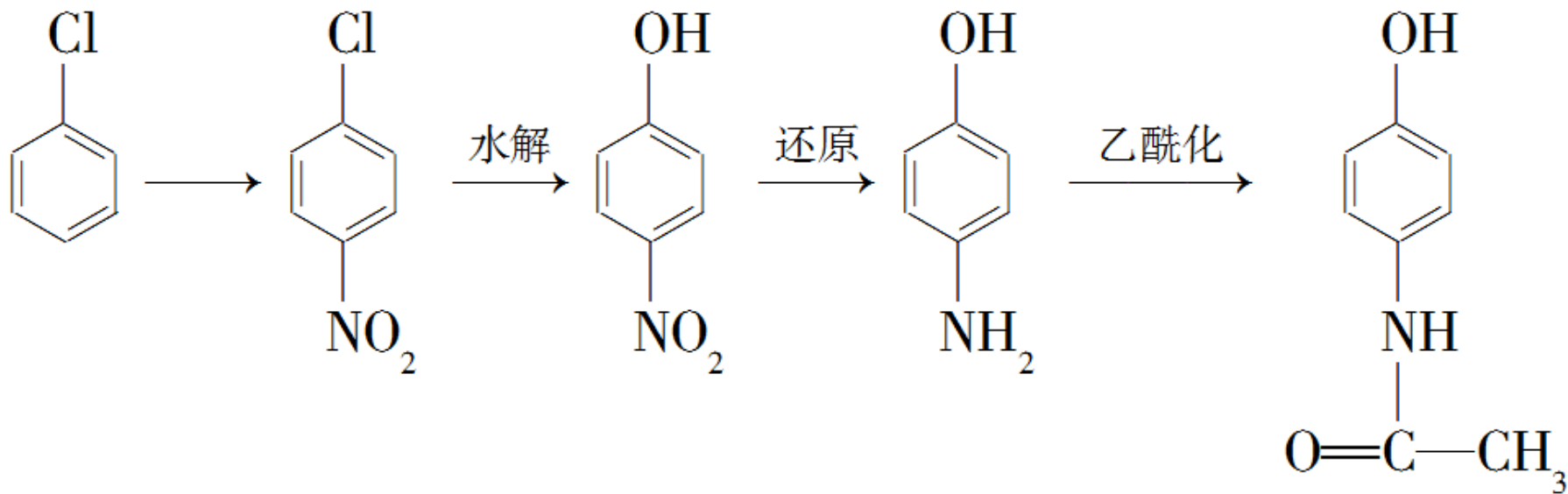
烃的衍生物之间的转化关系



二、重要有机物之间的相互转化

实质

在一定条件下官能团发生的变化。

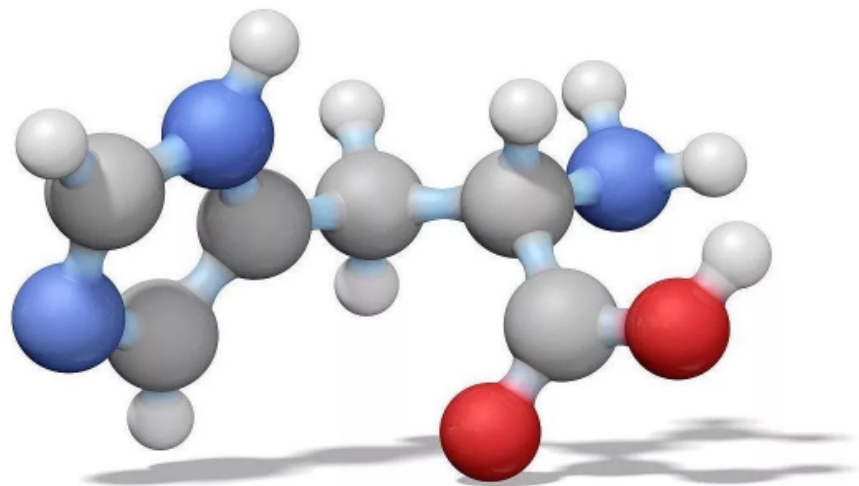


氯苯 对硝基氯苯 对硝基苯酚 对氨基苯酚 对乙酰氨基酚

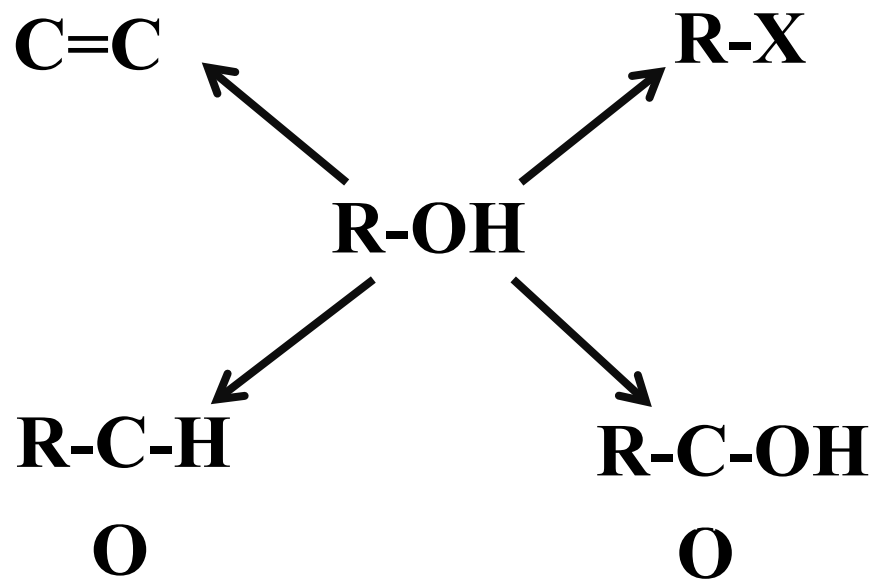
备解热镇痛药“扑热息痛”（对乙酰氨基酚）合成过程

三、有机合成的一般过程

有机合成的任务



目标化合物分子碳骨架的构建



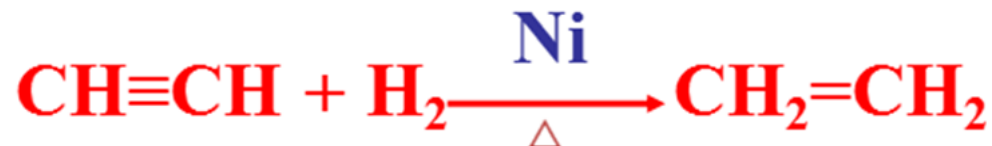
官能团的引入和转化

三、有机合成的一般过程

有机合成的**关键**是通过有机反应构建目标化合物的分子骨架，并**引入或转化所需要的官能团**。

1、官能团的引入

①引入碳碳双键

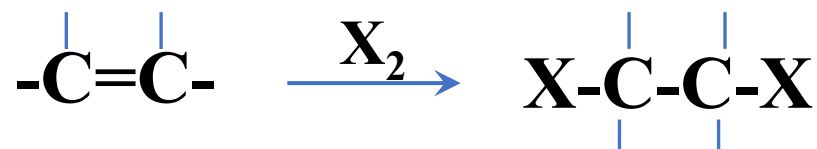


三、有机合成的一般过程

②引入 **卤素原子**：



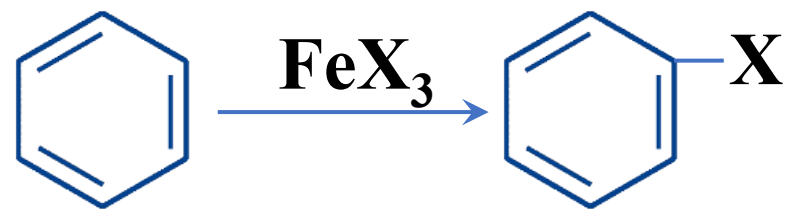
不饱和烃与HX或X₂加成



醇与HX取代



烷烃/苯/苯的同系物卤代



(特定情况下) 产物有多种，不常用

甲苯、丙烯等分子的甲基上引入卤原子

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：
<https://d.book118.com/798033052042006051>