

《有机化学 II》(药物化学专业) 教学大纲

一、课程基本信息

课程名称(中、英文): 有机化学 II -1[Organic Chemistry II -1]

有机化学 II -2[Organic Chemistry II -2]

课程号(代码): 20321040, 20321130

课程类别: 类级平台课程, 必修课

学时: 6 4 + 4 8

学分: 4 + 3

先修课程:《无机化学》、《分析化学》

基本面向: 药物化学专业

二、教学目的及要求

有机化学与药学渊源深厚。该课程要求药物化学专业的学生系统地、扎实地掌握有机化学的基本理论和基本规律, 为后续课程的学习以及继续深造, 为将来利用有机化学, 服务药学奠定坚实的基础。通过有机化学的教学, 把有机化学与药学紧密结合起来, 进一步加强对解决学生问题、分析问题和提出问题的能力培养。

在学习该课程时学生要着重掌握各类有机化合物的结构、命名、物理性质、光谱性质、常用制备方法和用途。紧紧抓住结构与性能的关系, 深入理解各类有机化合物的典型反应的规律, 机理, 立体化学。

三、教学内容

1 前言 (4 学时)

基本要求: 一、了解有机化学的发展史、主要任务和学习方法; 二、了解有机化合物的基本特点、分类和反应类型; 三、了解共价键的本质, 掌握共价键的属性, 熟悉利用键能数据推算反应的焓变; 四、掌握下述名词术语: 有机化学; 同分异构现象; 分子间作用力; Van der Waals 力; 官能团

1-1 有机化学的由来和发展

1-2 有机化合物的特点: 分子结构和组成 (同分异构现象, 结构的表示方法); 理化性质

1-3 共价键的键参数: 键能、键长、键角; 键的极性与诱导效应; 键的可极化性

1-4 共价键的断裂方式与有机反应的类型

1-5 有机化合物的分类

1-6 学习有机化学的目的和学习方法

2 烷烃和环烷烃 (6 学时)

基本要求: 一、了解烷烃的物理性质, 掌握烷烃的命名规则。二、掌握构象的表示方法和典型的构象 ap , sp , sc , ac 的稳定性分析; 三、了解饱和碳原子的 sp^3 杂化轨道与烷基自由基的 sp^2 杂化轨道的形成与构型; 四、着重掌握烷烃的自由基取代反应 (卤代反应) 的基本规律 (区域选择性) 和反应机理 (自由基反应); 五、弄清下列概念: 同系列与同分异构; 构造异构与链异构; T.S 与活泼中间体; 扭转张力与 Van der Waals 张力; Newman 投影式与透视式; 活性与选择性; Baeyer 张力; 船式与椅式构象

- 2-1 烷烃的同系列与同分异构现象（键异构）
- 2-2 烷烃和命名：习惯命名；系统命名（采用 1980 年中国化学会有机化学命名原则）衍生物命名与俗名
- 2-3 烷烃的结构： CH_4 的正四面体结构与 sp^3 杂化轨道；烷烃的构象
- 2-4 烷烃的物理性质
- 2-5 烷烃的反应：烷烃的卤代反应（ CH_4 的氯代反应及自由基反应历程）；卤代反应中卤素的活性与选择性；氧化反应（燃烧与部分氧化）；热裂反应
- 2-6 烷烃自由基的立体化学（ sp^2 杂化）
- 2-7 环烷烃的分类、异构与命名
- 2-8 环烷烃的物理性质
- 2-9 环烷烃的化学反应
- 2-10 拜尔张力学说与近代观点
- 2-11 环烷烃的构象（环丙烷、环己烷及其衍生物、十氢萘）

3 立体化学-对映异构（6 学时）

基本要求：一、掌握对称因素与手性的关系；二、掌握 Fischer 投影式的书写规则，并能熟练地掌握 R/S 的命名法，正确地判断手性中心的构型；三、弄清下列概念：对映异构体和非对映异构体；手性和旋光性；旋光度与比旋光度；内消旋体和外消旋体；手性与对称因素，手性中心与手性分子；赤式与苏式；外消旋化与内消旋化

- 3-1 手性现象
- 3-2 平面偏振光与物质的光活性：平面偏振光；物质的光活性；旋光度与比旋光度
- 3-3 手性与对称因素（对称面、心、轴，更迭对称轴）
- 3-4 手性分子构型表示方法与命名
结构表示法（透视式与投影式）命名（R、S，赤式与苏式，次序规则）
- 3-5 含两个手性碳原子的化合物
- 3-6 含三个手性碳原子的化合物
- 3-7 其它手性分子

4 卤代烃（8 学时）

基本要求：一、重点掌握卤代烃的三类反应：亲核取代、消去反应与活泼金属的反应以及前两类反应的极端历程的描述和特征（动力学特征、立体化学特征等）；二、掌握影响 $\text{S}_{\text{N}}1$ ， $\text{S}_{\text{N}}2$ ， $\text{E}1$ ， $\text{E}2$ 历程的影响因素及其规律（判断反应的历程）；三、熟练掌握消去反应的规律——Saytzev 烯和 Hofman 烯；四、熟练掌握 Grignard 试剂的制备和应用，了解 RLi ， R_2CuLi ， RNa 等的形成与应用；五、掌握下述概念：亲核剂；溶剂解；氢解；Walden 转化；两可离子；邻基参与与邻位促进

- 4-1 卤代烃的分类、异构与命名
- 4-2 卤代烃的化学反应
 - 一．亲核取代反应：碳亲核剂的反应；氧亲核剂的反应；氮亲核剂的反应硫亲核剂的反应；卤亲核剂的反应
 - 二．卤代烷 S_{N} 反应的历程和立体化学（ $\text{S}_{\text{N}}1$ 、 $\text{S}_{\text{N}}2$ ）

- 三. 影响 SN 反应的因素: R 的结构; L 离去基团; Nu 的亲核性; 溶剂
- 四. 芳卤的 SN 反应 (Meisenheimer 络合物, 苯炔历程)
- 五. 卤代烃的消去反应: β -消去的历程 (E1, E2, E1cb) 影响因素; 定向规律
- 六. 卤代烷与金属的反应: 格氏试剂及其反应; 类格氏试剂及其反应
- 七. 卤代烃的还原
- 八. 多卤代烃与 α -消去反应
- 九. 分子内的 SN 反应与邻基参与

5 烯烃 (10 学时)

基本要求: 一、掌握烯烃和环烷烃的顺反异构现象和 E/Z 命名法; 二、掌握烯烃的各类反应, 重点掌握其反应规律及离子型亲电加成反应的历程; 三、了解环烷烃的性质和构象, 掌握环丙烷和环己烷的构象及其理论解释; 四、掌握下述概念: Markovnikov 规则与过氧化物效应; 立体选择性反应与立体与一性反应; 亲电剂; 亲电反应; 氢化热与燃烧热;

5-1 烯的结构

5-2 烯烃的异构与命名: 烯烃的异构 (位置、顺反异构); 命名 (Z、E 命名法)

5-3 烯烃的物理性质

5-4 烯烃的化学反应: 烯烃与卤素的加成反应与亲电加成反应的历程[立体选择性]与立体专一性; 烯烃与无机酸的亲电加成反应 (Markovnikov 规则); 烯烃与 H_2O 的反应; 烯烃与 HOX 的反应; 烯烃的聚合反应; 硼氢化-氧化反应; 溶剂汞化-去汞化反应; 烯烃的还原与氧化反应; 烯烃的自由基加成反应; 烯烃的 α -H 反应

5-5 烯烃的制备: 醇脱水 (Saytzev 规律) 和卤代烃脱 HX (Hofmann 规律)

6 炔烃与二烯烃 (6 学时)

基本要求: 一、掌握炔烃的亲电加成反应、氧化还原和炔氢的反应, 了解亲核加成、聚合反应等; 二、掌握共轭二烯的亲电加成反应规律和共轭二烯的 Diels-Alder 反应; 三、掌握下述概念: 共轭效应与诱导效应; 双烯组分与亲双烯组分; 乙烯基化反应与乙炔基化反应; 速度控制与平衡控制; 1, 2-加成与共轭加成

6-1 炔烃的结构、异构和命名

6-2 炔烃的化学反应: 加成反应 (亲电加成); 炔烃与含活泼氢化物反应 (亲核加成、乙烯基化); 氧化与还原反应 (Lindlar 催化剂); 炔氢的反应 (酸性、亲核取代、乙炔基化反应); 乙炔的聚合反应

6-3 炔烃的制备

6-4 二烯烃的分类与多烯烃的命名

6-5 共轭二烯烃的结构与 π 、 π 共轭效应

6-6 其它类型的共轭效应 (P- π 、P-P、 σ - π 、 σ -P)

6-7 共轭二烯烃的反应: 与 H_2 和 HX 的反应 (动力学和热力学控制反应) 加 H_2 ; 游离基加成反应; Diels-Alder 反应; 聚合反应

6-8 共轭二烯烃的制备

7 芳烃 (8 学时)

基本要求：一、掌握苯系芳烃的亲电取代反应类型（卤代；硝化；磺化；付一克烷化与酰化）、历程和定位规则，能充分利用电子效应和共振论来解释其规律；二、掌握侧链上的氧化与卤代反应规律，了解芳环被催化氢化，催化氧化，Birch 还原的规律；三、掌握萘及一取代萘的亲电取代反应和蒽、菲的特性；四、掌握 Huckel 规律与芳香性判断；五、掌握下述概念和人名反应：共振论和 Kekule 结构；活化基与钝化基；邻对位定位基与间位定位基；同位素效应；空间效应；Friedel-Crafts 烷化和酰化；Clemensen 还原；Haworth 合成法

7-1 芳烃的分类和命名

7-2 苯的结构：苯的特性与 Kekule 结构；苯结构的描述（MO 和共振论）

7-3 苯系芳烃的亲电取代反应的反应历程：卤代；硝化；磺化；付一克烷化与酰化

7-4 芳环上的亲电取代反应的定位规则及其应用：定位规律及理论解释；苯二元取代物再取代的定位规律；定位规律的应用

7-5 氧化（苯环上氧化，侧链氧化）

7-6 游离基反应（环的加成，侧链卤代）

7-7 萘的结构与衍生物的命名

7-8 萘的化学反应：亲电取代（定位规则）；氧化与还原

7-9 蒽、菲的特性

7-10 致癌烃

7-11 非苯芳烃：芳香性的条件（Huckel 规则）；几个典型碳环非苯芳香族化合物（环丙烯正离子，环戊二烯负离子，环庚三烯正离子，篮烃，杯烯、轮烯）

8 醇、醚（6 学时）

基本要求：一、了解醇、醚的结构中共性、命名与物理性质及一些主要合成法；二、掌握醇的亲核取代反应和消去反应的规律，了解醇氧化和掌握邻二醇的特性；三、掌握不对称醚的醚键断裂规律和酸碱作用下的环醚开环规律；四、弄清下述试剂与反应的性质：Lucas 试剂；Sarett 试剂；Oppenmer 氧化法；Williamson 醚合成；Pinacol 重排；Wagner-meerwein 重排；Fries 重排

8-1 醇的分类和命名

8-2 醇的结构与物理性质

8-3 醇的化学性质：酸性、碱性、亲核性（与 R-X 反应，与 ROH 反应，与 RCOOH 反应，与 TsCl 和无机酰卤反应，与 CS₂ 反应）与无机酸反应；消去反应；醇的氧化

8-4 邻二醇的特性（氧化与重排）

8-5 醇的制备

8-7 醚（分类，命名，反应，制备）

8-8 硫醇和硫醚：命名；物理性质；化学性质

9 醛、酮（8 学时）

基本要求：一、重点掌握羰基上的各种亲核加成反应的规律及历程，注意 Cram 规则的立体化学问题；二、掌握醛、酮的 α -H 的反应历程；三、了解插烯原理，掌握 α 、 β -不饱和醛酮的共轭加成规律及意义；四、搞清下列名称反应：Aldol 反应；Claisen-Schmidt 缩合；Mamich 反应；Wittig 反应；Baeyer-Villiger 反应；Wolff-Kishner-黄鸣龙反应；Michael 反应；

Robinson 反应; Cannizzaro 反应

9-1 醛酮的分类与命名

9-2 醛酮羰基上的亲核加成反应——加 HCN、NaHSO₃, 有机金属化合物, H₂O, LiAlH₄, NaBH₄, PCl₅ 等和立体化学; 与氨及氨衍生物的反应 (肟、腙、缩氨脲), 与醇的加成缩合反应——半缩醛 (酮)、缩醛 (酮) 的生成, 醛 (酮) 的 Wittig 反应、Mannich 反应、安息香缩合;

9-3 醛酮 α -H 的反应: 酮-烯醇互变, 卤代与卤仿反应, aldol 反应;

9-4 醛酮的氧化与还原: 醛酮的一般氧化, Baeyer-Villiger 氧化和 Riley 氧化; Cannizzaro 反应; 还原成醇 (催化氢化和金属氢化物和金属还原); 还原成烃基 (Clemensen 还原, Wolff-Kishner-黄鸣龙还原)

9-5 醛、酮、的制备

9-6 不饱和醛、酮 (插烯原理与共轭加成)

10 酚、醌 (4 学时)

基本要求: 一、掌握酚的结构、反应和制备方法; 二、掌握醌的结构特征和对体醌的基本反应; 三、弄清 Reimer-Tiemann 反应; Kolbe 反应;

10-1 酚的结构和命名

10-2 酚的化学反应 (酸性, 氧上的烷化与酰化, 显色反应, 芳环上的反氧化与还原,

10-3 酚的制备 (磺化法、氯苯水解法、异丙苯法等)

10-4 醌的分类与命名

10-5 对苯醌的反应

10-6 醌的制备

11 羧酸及取代羧酸 (6 学时)

基本要求: 一、重点掌握羧酸羰基碳上的亲核取代反应, 熟悉取代羧酸的特性; 二、了解羧酸的结构对酸性的影响, 羧酸的脱羧与还原反应, 羧酸的 α -H 的反应; 三、适当的掌握卤代酸、酚酸、醇酸的特有反应。

11-1 羧酸的分类与命名; 羧酸的结构与性能

11-2 羧酸的反应: 羧基中氢的反应 (酸性、影响酸性的结构因素); 羰基碳上的反应 (酯化反应、酰卤的形成、酰胺的形成, 贝克曼重排、酸酐的生成); 脱羧反应; 羧酸的还原反应 (有机金属化合物反应); 羧酸的 α -H 的反应 (Hell-Volhard-Zelinsky 反应)

11-3 羧酸的制备

11-4 取代酸: 卤代酸和卤代酸酯的特性 (Darzen 反应, Reformatsky 反应); 醇酸特性; 酚酸的性质与制备方法; 羧基酸的特性

12 羧酸衍生物 (6 学时)

基本要求: 掌握酯和羧酸的 α -H 的反应, 了解酯的热消去反应和酰胺的一些特殊反应; 熟悉 β -丁酮酸酯与丙二酸二乙酯的合成法, 同时掌握 β -酮酸酯及其类似物的互变异构现象及其影响因素; 掌握 Perkin 反应; Claisen 缩合; Hofmann 降解; Darzen 反应; Reformatsky 反应; β -丁酮酸酯和丙二酸二乙酯合成法

12-1 羧酸衍生物的结构与命名

12-2 羧酸衍生物的化学反应：酰基碳上的 SN 反应；与有机金属化合物的反应；还原反应； α -H 的反应（酰卤 α -H 反应；酸酐 α -H 的反应，Perkin 反应；酯的 α -H 的反应，Claisen 缩合）；酯的热消去反应；酰胺的特殊反应，如 Hofmann 降解

12-3 β -丁酮酸酯和丙二酸二乙酯在合成上的应用

13 有机含氮化合物（6 学时）

基本要求：一、掌握硝基化合物的还原反应，尤其是芳香族硝基化合物不同程度还原在有机合成上的意义；二、重点掌握胺类的碱性规律，氮上的取代反应和与 HNO_2 及 $\text{TsCl} / \text{NaOH}$ 的反应（Hinsberg 分胺法），了解叔胺氮上的氧化反应及其氧化产物在合成上的应用（Cope 反应）；三、重点掌握芳香重氮盐的生成及其在合成上的应用，如 Sandmeyer 反应和偶联反应等；四、掌握烯胺和季胺化合物的反应（重点 Hofmann 彻底甲基化反应）；五、掌握胺的各种制备方法，如还原胺化法与 Gabriel 合成法等；六、了解重氮甲烷与氮烯的结构与应用。

13-1 硝基化合物的结构和反应（还原、缩合等）

13-2 胺的分类、命名和物理性质

13-3 胺的结构与反应（碱性、亲核性；与 HNO_2 反应；氧化）；芳胺环上的反应（卤代、硝化、磺化）

13-4 烯胺的合成与反应

13-5 季胺盐与季胺碱

13-6 胺的制备：硝基、腈、酰胺、脒等化合物的还原；羧基还原胺化；氮或胺的羟化；特殊的伯胺合成法（Hofmann 降解、Gabriel 合成法）

13-7 芳香重氮盐的结构与反应：结构；反应（脱氮、Sandmeyer 反应等，不脱氮反应，偶联等）

13-8 重氮甲烷与碳烯的结构和反应：重氮甲烷的结构和反应；碳烯的结构和反应

14 有机化合物的光谱性质（6 学时）

基本要求：一、了解 MS、IR、NMR 波谱的基本原理；二、掌握主要类型有机化合物的波谱特征，能够用于不太复杂的有机化合物的结构测定与鉴定，其中：（1）MS 要求掌握 M^+ 和碎片离子的识别，对各类有机化合物的开裂规律有总体了解；（2）IR 要求掌握一些典型基团的特征吸收峰及影响峰位的因素；（3）NMR 要求掌握化学位移 δ 、偶合常数 J 与分子结构的关系。

14-1 IR 与有机分子结构：概述（IR 形成、IR 表示方法，化学键振动类型与规律）；影响峰强度的因素；IR 谱应用举例

14-2 ^1H -NMR 与有机分子结构：基本原理；化学位移；化学位移与分子结构；自旋偶合与自旋裂分；NMR 的应用举例

14-3 MS 与有机分子结构：概述（MS 的产生与 IR 表示方法） M^+ 与碎片（ M^+ 的形成与识别， M^+ 强度与结构等）；MS 的应用举例

15 杂环化合物（6 学时）

基本要求：一、二、熟悉简单杂环化合物的类型与命名；三、主要掌握五元和六元杂环中的呋喃、吡咯、噻吩、吡啶化合物的结构与性能；四、了解五元杂环化合物的制备及其衍

生物的反应；六、了解以吡啶、喹啉为代表的稠杂环的结构与性能，并对某些天然含杂环有机化合物有一定的了解。

15-1

15-2 芳香杂环化合物：杂环化合物的分类和命名；

15-3 五元杂环化合物——结构与反应（呋喃、吡啶、噻吩、咪唑的结构、反应，呋喃衍生物的反应；稠杂环（吡啶）

15-4 六元杂环化合物——吡啶及其衍生物（结构与性能，吡啶的化学反应、吡啶及其取代吡啶的合成）；吡喃及其衍生物；稠杂环（喹啉、异喹啉、嘧啶、嘌呤等）

16 周环反应（6 学时）

基本要求：一、了解周环反应的特点及理论；二、掌握前线轨道理论的基本思想，能熟练地描述 HOMO 和 LUMO；三、掌握三类周环反应的选择规律，能预言反应的进程。

16-1 电环化反应： $4n\pi$ 电子体系； $[4n+2]\pi$ 电子体系

16-2 环加成体系： $[2+2]$ 环加成； $[4n+2]\pi$ 电子环加成；1,3-偶极加成；钼合反应

16-3 σ -迁移； $[1,3]\sigma$ -迁移（氢原子参加，碳原子参加）； $[3,3]\sigma$ -迁移（Cope 重排，Claisen 重排）

17 碳水化合物（6 学时）

基本要求：一、了解单糖的结构与性能，熟悉成苷与成脎等反应；二、掌握以葡萄糖为代表的单糖结构的表示法（Fischer 式，Haworth 式和构象式）及 D/L 命名法；三、学习以葡萄糖为代表的单糖结构表征的推论方法和几个典型的双糖的结构以及推导方法；四、掌握下述概念：变旋光作用；正位异构体（ α 、 β ）；差向异构体；转化糖和还原糖

17-1 碳水化合物的定义和分类

17-2 单糖的命名与结构（葡萄糖的构造、构型、构象）；

17-3 单糖的反应（成苷、成脎、氧化、醛糖的递升和递降）

17-4 双糖（麦芽糖；纤维二糖；乳糖；蔗糖）

17-4 多糖：淀粉；纤维素；环糊精等

18 氨基酸、肽、蛋白质和酶（6 学时）

基本要求：一、了解 α -氨基酸的结构与共性（物性和化性）；二、掌握氨基酸的几种典型的合成方法；三、了解肽的命名和结构特征，肽的合成和保护基的应用，肽的结构测定方法（端基分析法）。

18-1 氨基酸：分类与命名；

18-2 氨基酸的结构与物性（PI）；反应与合成

18-3 肽：结构；命名；结构测定；合成

18-4 蛋白质：四级结构（简介）

19 类脂（简介）（3 学时）

19-1 油脂、磷脂和蜡

19-2 萜类（结构、分类、应用实例）

19-3 甾体化合物（结构、命名、实例）

20 核酸和辅酶化学（简介）（3 学时）

20-1 核酸的分类、组成与理化性质

20-2 辅酶 (NAD, 辅酶 A, 乙酰辅酶 A, 乙醛吡哆醛等)

四、教材

倪沛洲主编, 有机化学 (四版), 北京: 人民卫生出版社, 1999。

五、主要参考书:

1、《有机化学基础》(第二版), 蓝仲薇, 李瑛, 陈华, 肖友发主编, 海洋出版社, 2004, 北京。

2、邢其毅、徐瑞秋、周政、裴伟伟,《基础有机化学》第二版, 上、下册, 高等教育出版社, 2003, 北京。

3、L. G. Wade Jr, Organic Chemistry(5 th Ed), Pearson Education Inc, 2003.

4、胡宏纹主编,《有机化学》第二版, 上、下册, 高等教育出版社, 1990, 北京。

5、R. T. 莫里森、R. N. 博伊德,《有机化学》第二版, 上、下册, 科学出版社, 1992, 北京。

六、成绩评定

期末考试占总成绩的 60%

期中考试占总成绩的 20%

平时成绩占总成绩的 20%