



药品



# 杂环化合物和生物碱



人民卫生出版社

PEOPLE'S MEDICAL PUBLISHING HOUSE

# 目录



**第一节 杂环化合物的分类和命名**



**第二节 五元杂环化合物**



**第三节 六元杂环化合物**



**第四节 稠杂环化合物**



**第五节 生物碱**

# 学习目标

- ☑ **掌握** 杂环化合物的定义、分类及其命名；  
生物碱的概念。
- ☑ **熟悉** 杂环化合物的结构与理化性质的关系。
- ☑ **了解** 杂环化合物及衍生物在医药卫生中的用途；  
生物碱的通性及常见生物碱的用途。



# 第一节

# 杂环化合物的分类和命名

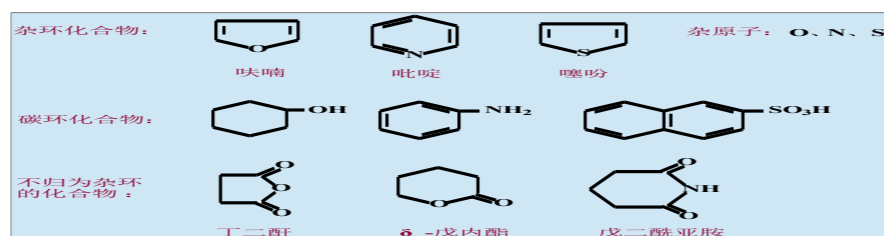


# 第一节 杂环化合物的分类和命名

**杂环化合物**：由碳原子和其他原子共同组成环状骨架结构的一类有机化合物。

**杂原子**：杂环中的非碳原子。

**杂环化合物**：



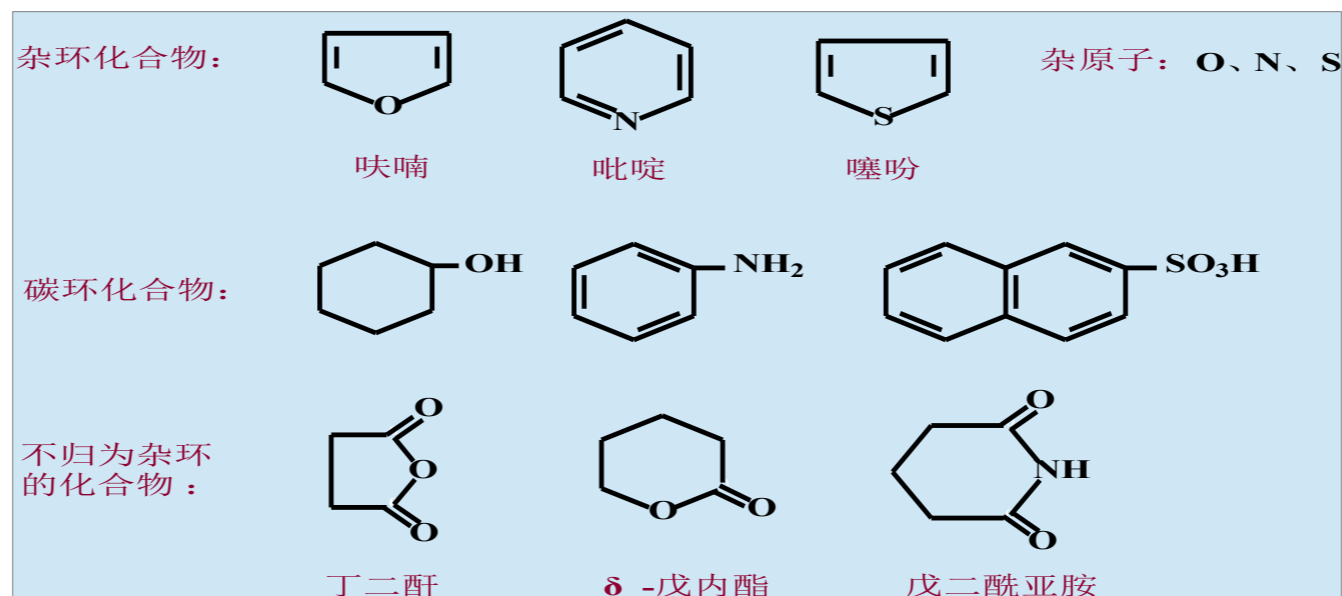
杂原子：O、S、N

呋喃

吡啶

噻吩

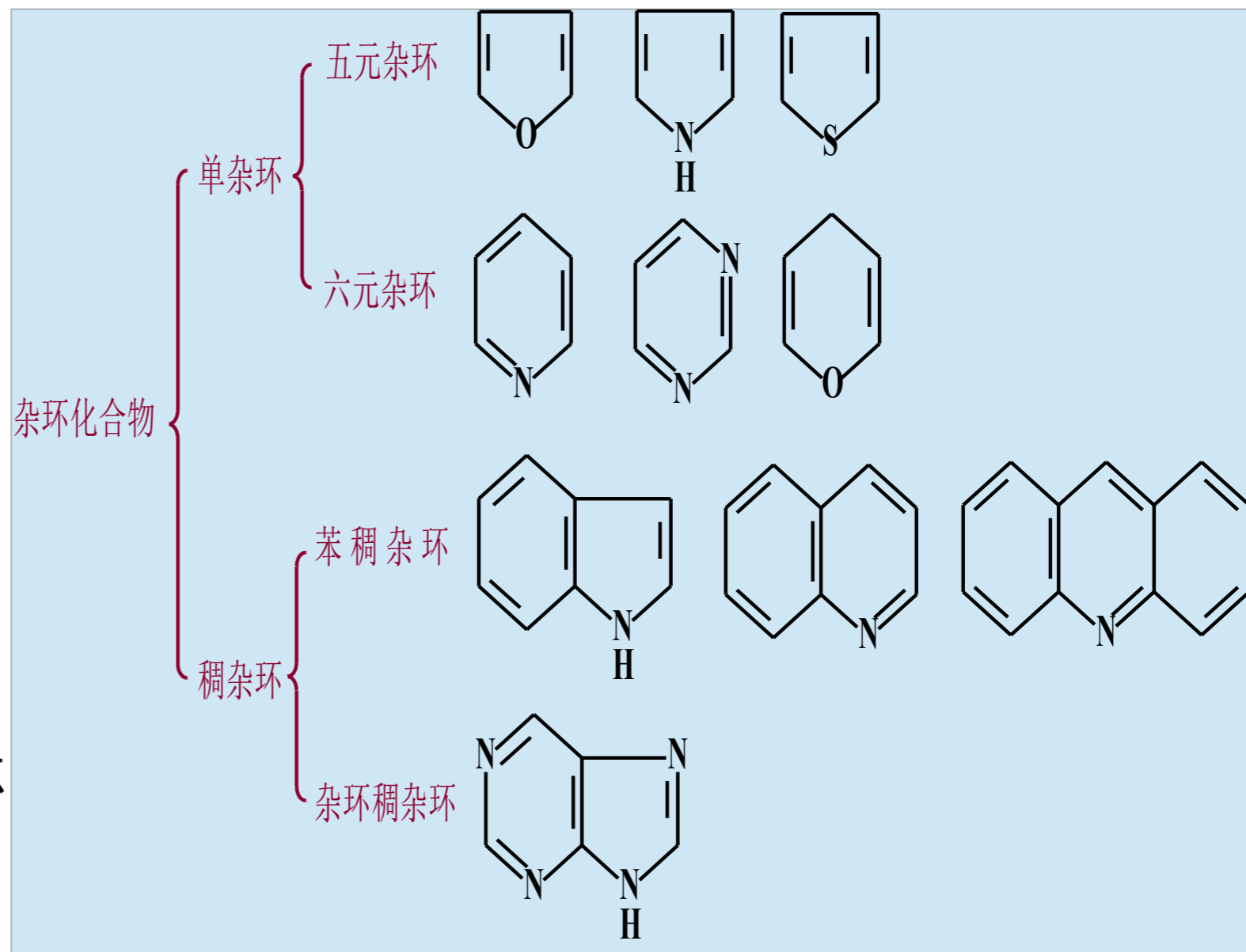
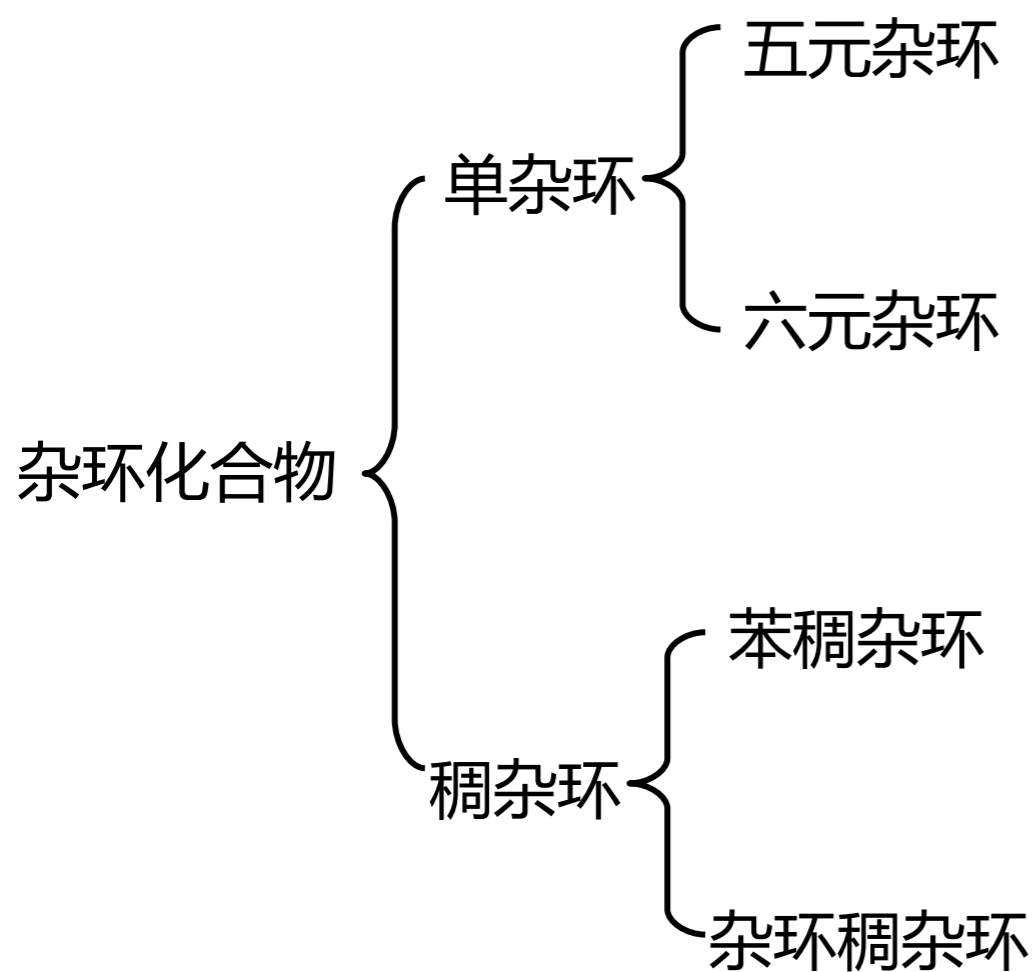
**碳环化合物**：



**不属于杂环的化合物**：



# 一、杂环化合物的分类





## 二、杂环化合物的命名

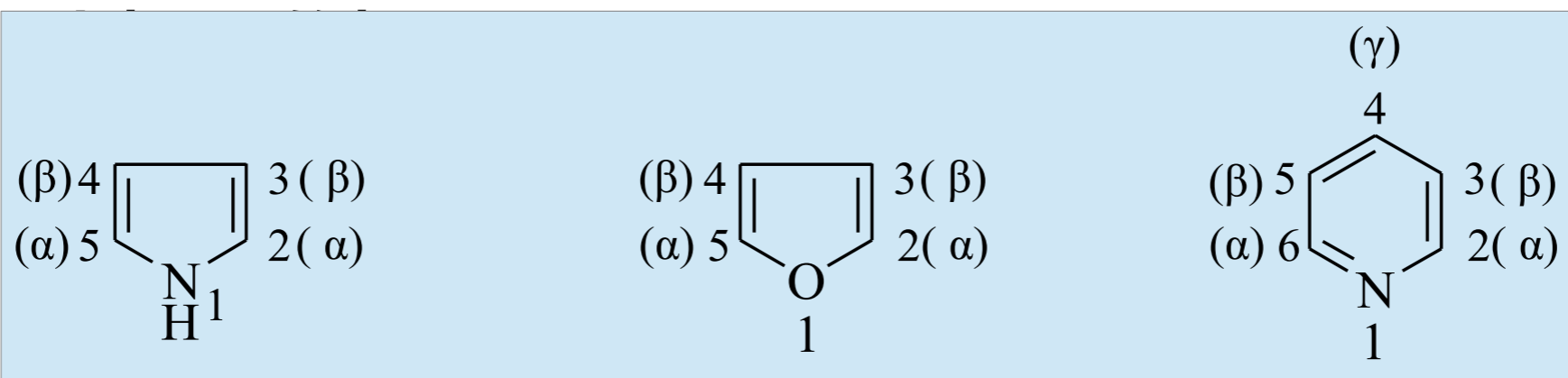
### (一) 杂环母核的命名

音译法是外文谐音汉字加“口”偏旁表示杂环母核的名称。

例如呋喃 (furan)、噻吩 (thiophene)、嘌呤 (purine)。

### (二) 杂环母核的编号规则

#### 1. 含



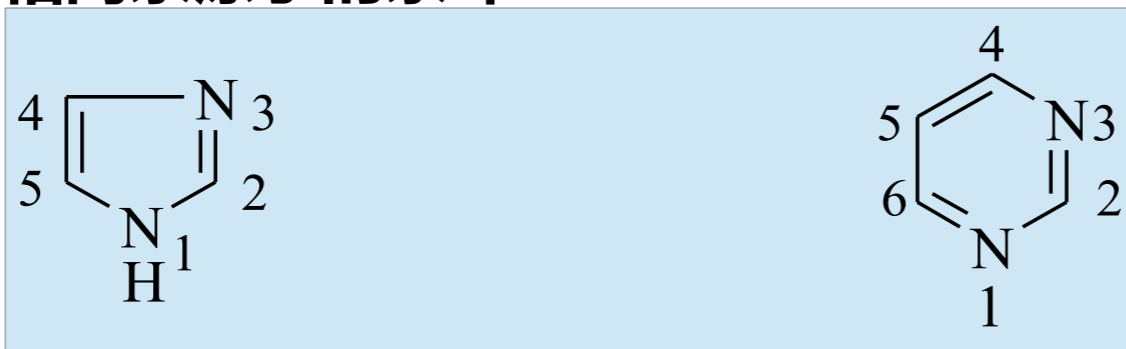
以杂原子为起点开始用阿拉伯数字或从与杂原子相邻的碳原子开始用希腊

字母  $\alpha$ 、 $\beta$ 、 $\gamma$  等编号。

## 二、杂环化合物的命名

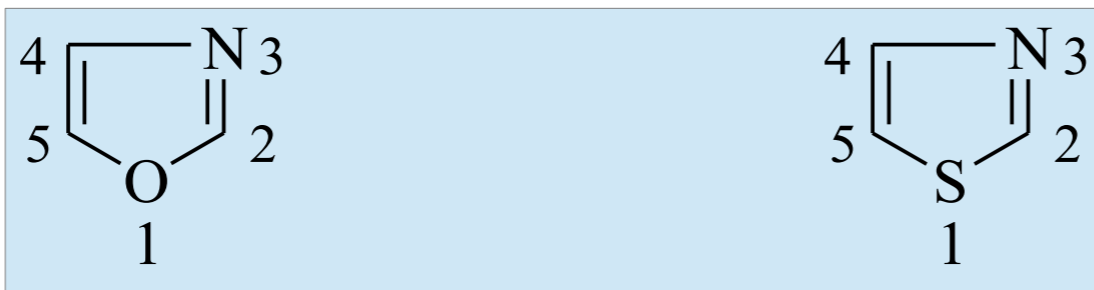
### (二) 杂环母核的编号规则

#### 2. 含 2 个相同杂原子的杂环



应尽可能使杂原子的编号最小，如果其中 1 个杂原子上连有氢，应从连有氢的杂原子开始编号。

#### 3. 含 2 个不同杂原子的杂环



在杂原子编号最小的前提下，按 O、S、NH、N 的先后顺序编号。

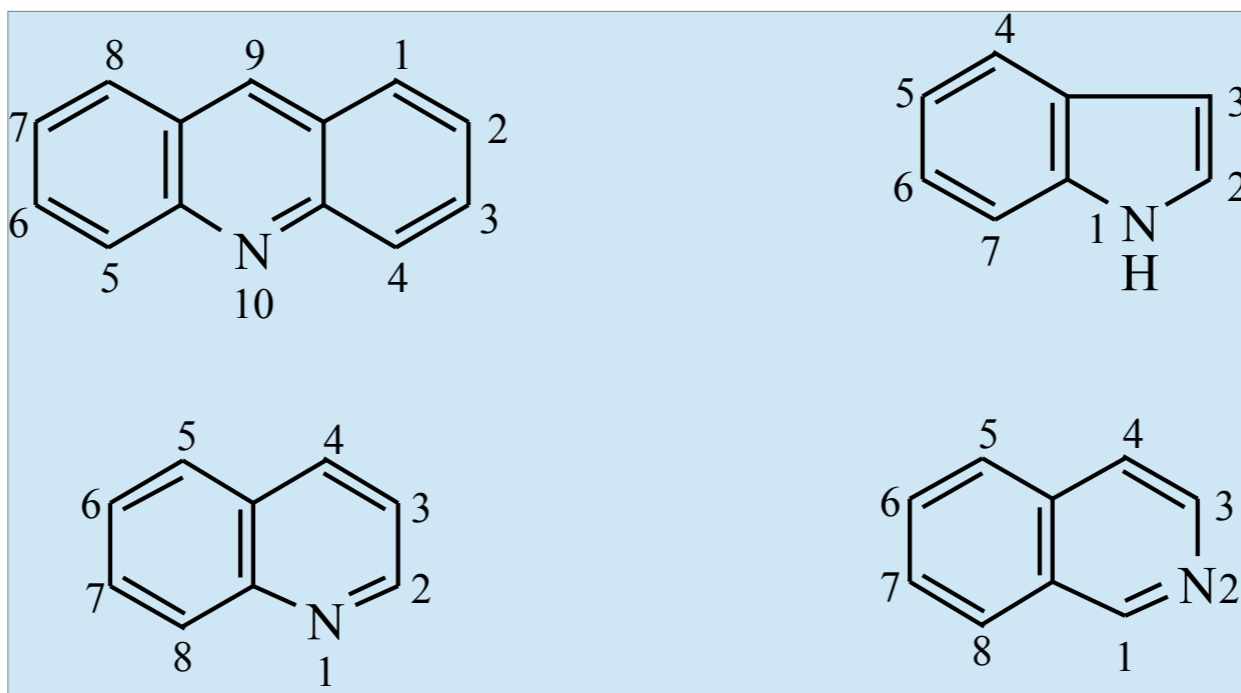




## 二、杂环化合物的命名

### (二) 杂环母核的编号规则

4. 对于稠杂环，其中苯稠杂环大多与相应的稠环芳烃的编号相同，从一边开始，共用碳原子不编号，遵循杂原子优先原则。杂环稠杂环往往有特定的编号。

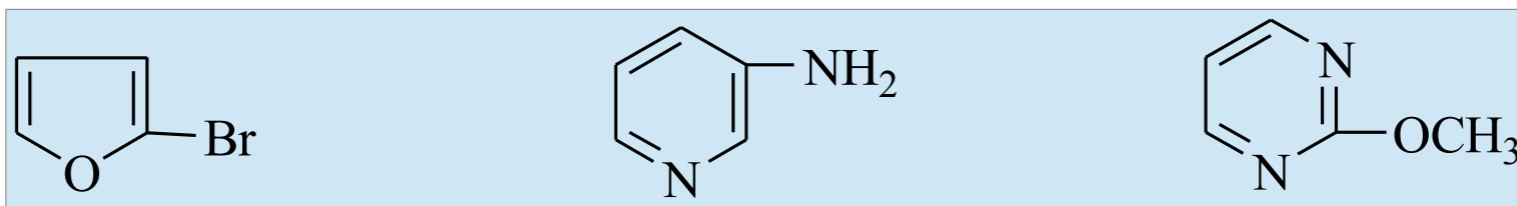




## 二、杂环化合物的命名

### (三) 取代杂环化合物的命名

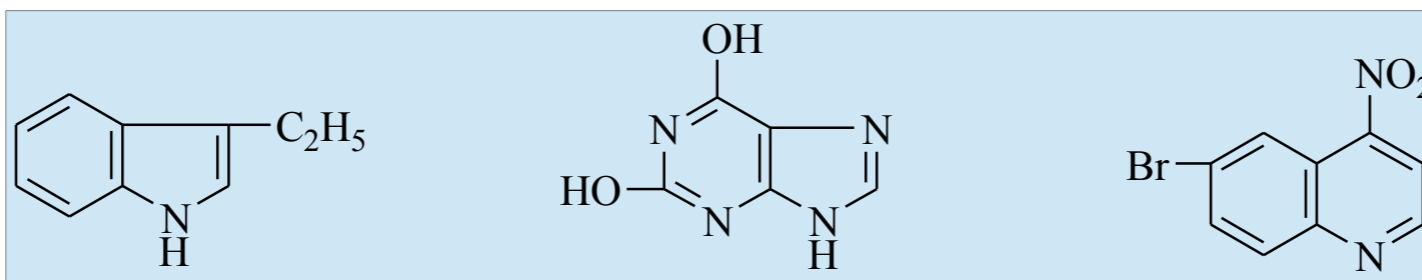
连有取代基的杂环化合物的命名，可以选杂环为母体，将取代基的位次、数目及名称写在杂环母环名称前。



2- 溴呋喃  
(  $\alpha$ - 溴呋喃 )

3- 氨基吡啶  
(  $\beta$ - 氨基吡啶 )

2- 甲氧基咪唑  
(  $\alpha$ - 甲氧基咪唑 )



3- 乙基吲哚  
溴喹啉

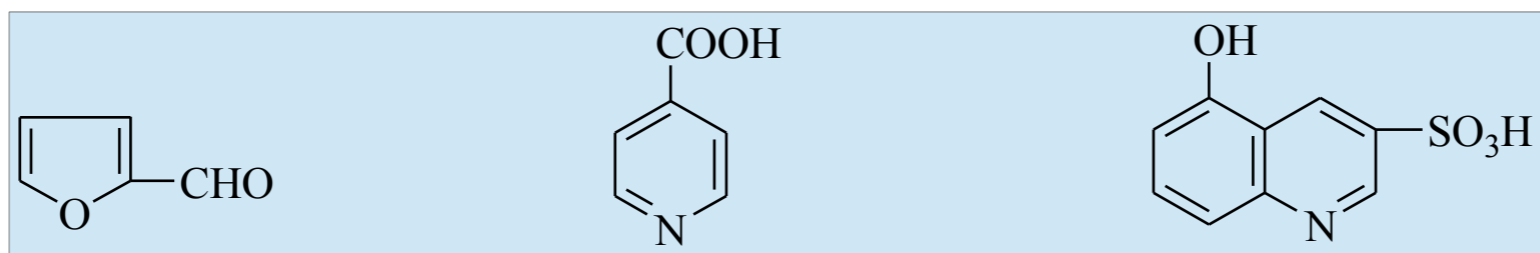
2,6- 二羟基咪唑

4- 硝基 -6-



### (三) 取代杂环化合物的命名

当环上有一  $\text{COOH}$ 、 $\text{—SO}_3\text{H}$ 、 $\text{—CONH}_2$ 、 $\text{—CHO}$  等基团时，则以羧酸、磺酸、酰胺、醛作为母体，将杂环作为取代基命名。例如：

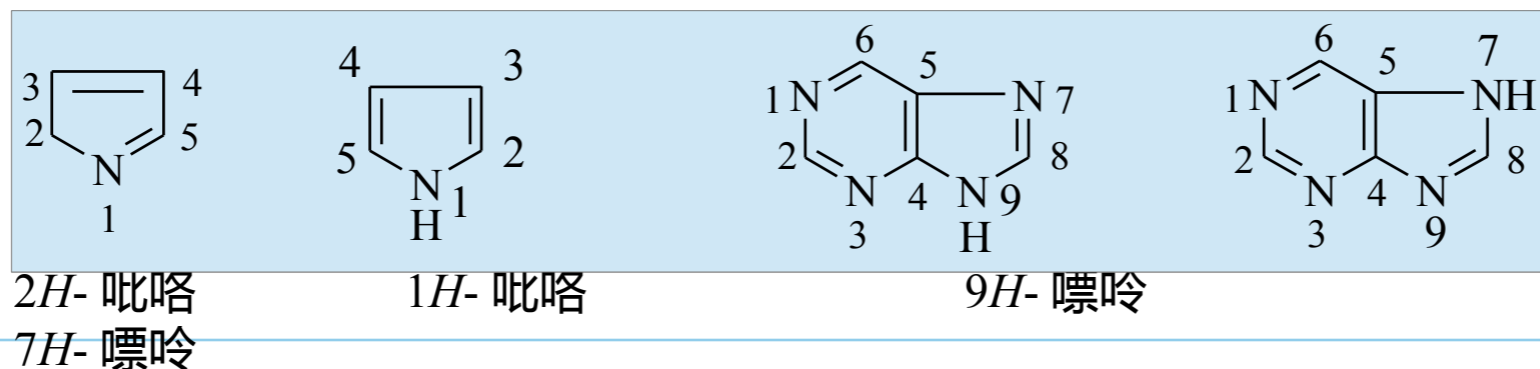


2-呋喃甲醛  
( $\alpha$ -呋喃甲醛)

4-吡啶甲酸  
( $\gamma$ -吡啶甲酸)

5-羟基-3-喹啉磺酸

此外，为了区别杂环化合物的几种互变异构体，需标明环上一个或多个氢原子所在的位置，可在名称前面加上标位的阿拉伯数字和  $H$ （斜体大写）。例如：





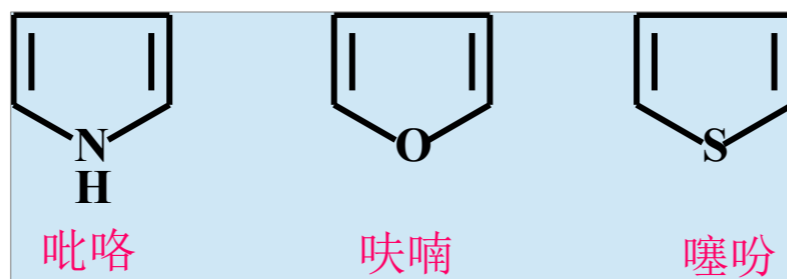
## 第二节

# 五元杂环化合物

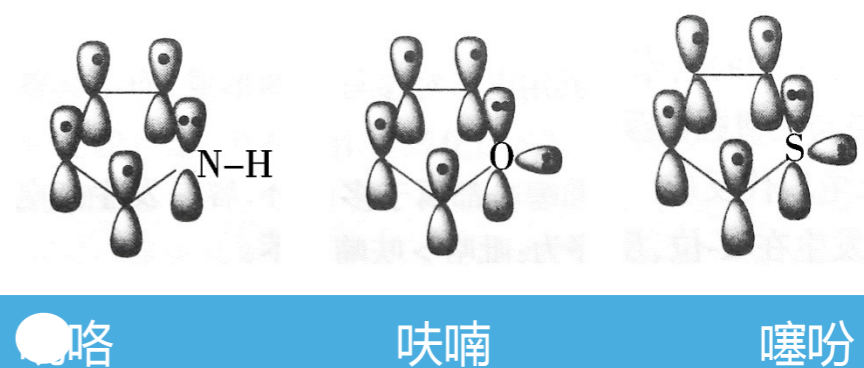


## 一、含有 1 个杂原子的五元杂环化合物

### (一) 吡咯、呋喃和噻吩的分子结构



吡咯、呋喃和噻吩都是平面五元环结构，碳原子与杂原子均以  $sp^2$  杂化，在碳原子的  $p$  轨道中各有 1 个电子，在杂原子的  $p$  轨道中有 2 个电子， $p$  轨道从侧面重叠形成环状闭合  $\pi$  电子共轭体系，因此吡咯、呋喃和噻吩都具有一定程度的芳香性。



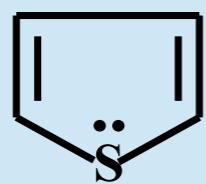


## 一、含有 1 个杂原子的五元杂环化合物

### (一) 吡咯、呋喃和噻吩的分子结构

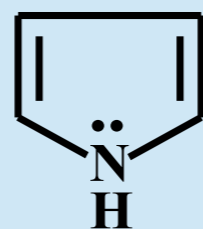
杂原子的孤电子对参加  $p-\pi$  共轭，对环系供电子，因此杂环碳电子云密度：环碳的电子云密度

度：



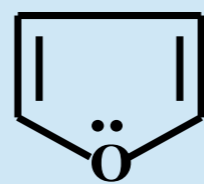
噻吩

>



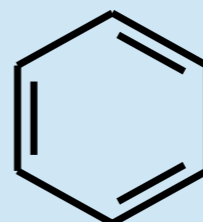
吡咯

>



呋喃

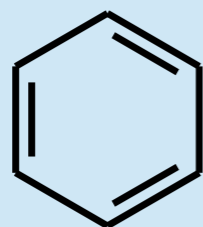
>



苯

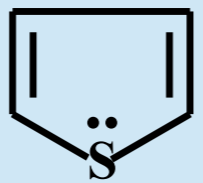
杂原子的电负性  $O > N > S$ ，杂原子的孤电子对参与共轭的程度不同。

芳香性：



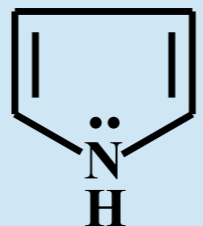
苯

>



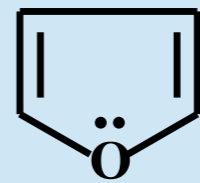
噻吩

>



吡咯

>



呋喃





## 一、含有 1 个杂原子的五元杂环化合物

### (二) 吡咯、呋喃和噻吩的性质

无色液体；难溶于水。

凡能增大与水形成氢键的可能性的因素，就有可能增大杂环化合物的水溶性。如噻吩、呋喃环上连有羟基时，由于羟基的影响，其溶解度增大。



噻吩

2-羟基噻吩

呋喃

4-甲基-2-

羟基呋喃

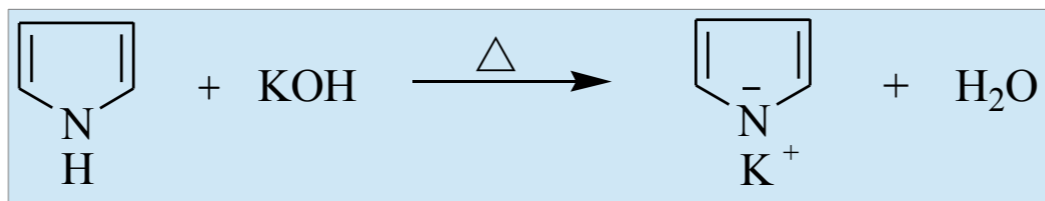
松木片<sup>(1:700)</sup>反应：<sup>(1:20)</sup>吡咯蒸气 + <sup>(1:16)</sup>盐酸浸泡过的松木片 → <sup>(1:35)</sup>显红色

呋喃蒸气 + 盐酸浸泡过的松木片 → 显绿色



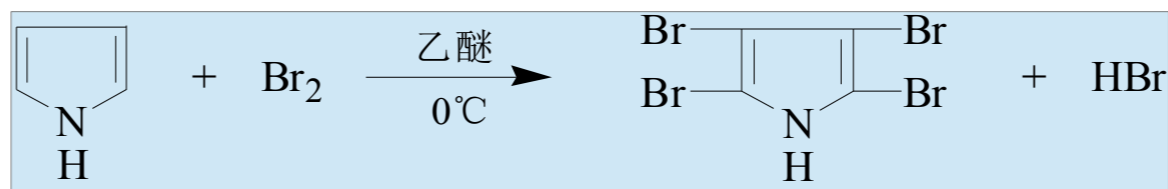
## (二) 吡咯、呋喃和噻吩的性质

1. 酸碱性 吡咯的碱性弱于苯胺，并有弱酸性。



2. 亲电取代反应 反应发生在  $\alpha$ -位，反应的活性顺序为吡咯 > 呋喃 > 噻吩 > 苯。

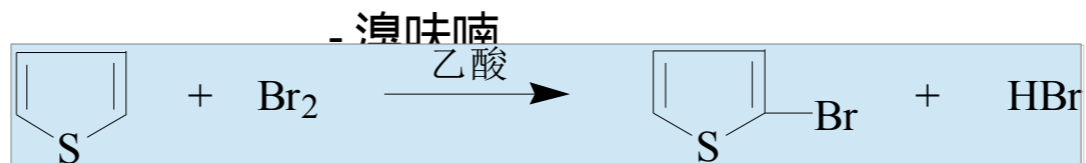
### (1) 卤代反应



2,3,4,5-四溴吡咯



$\alpha$



$\alpha$

- 溴噻吩

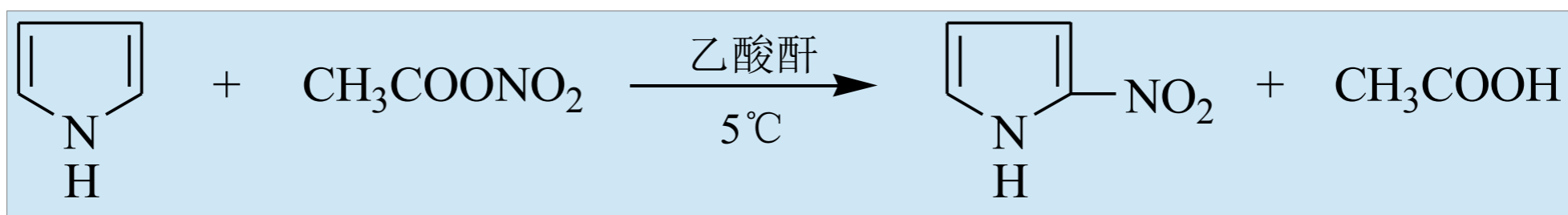




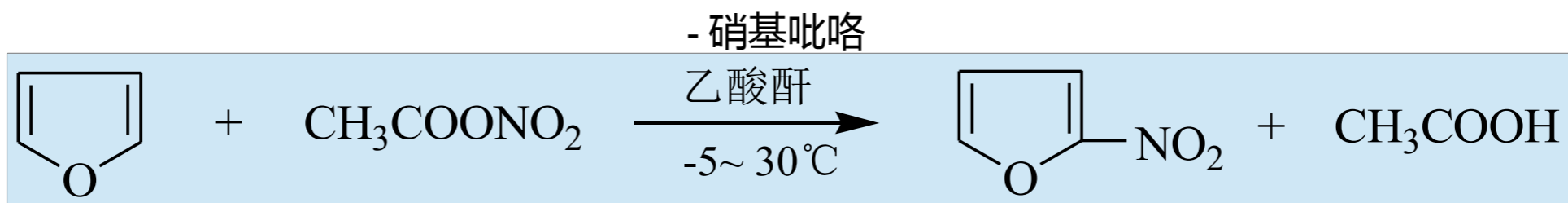
## 一、含有 1 个杂原子的五元杂环化合物

### (二) 吡咯、呋喃和噻吩的性质

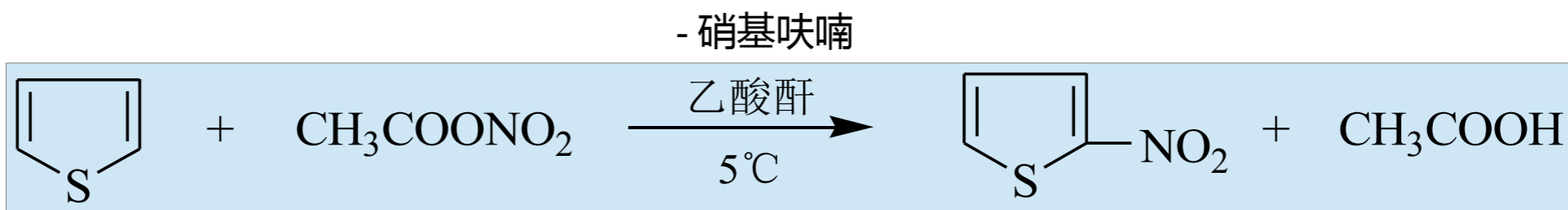
#### (2) 硝化反应



$\alpha$



$\alpha$



$\alpha$

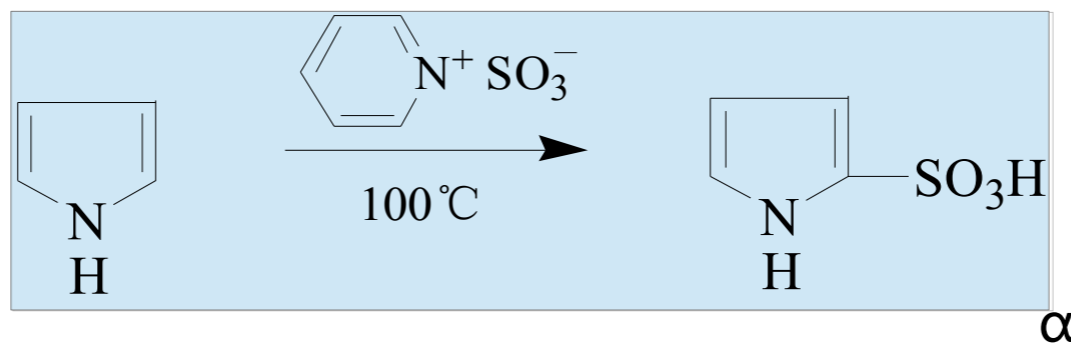
- 硝基噻吩



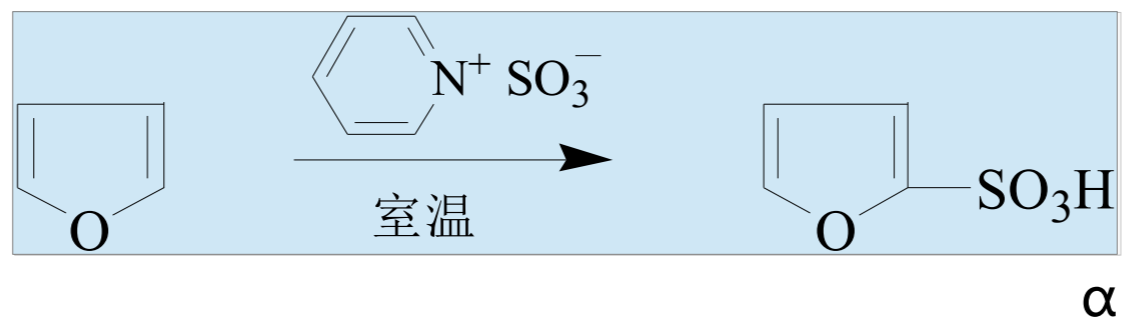
## 一、含有 1 个杂原子的五元杂环化合物

### (二) 吡咯、呋喃和噻吩的性质

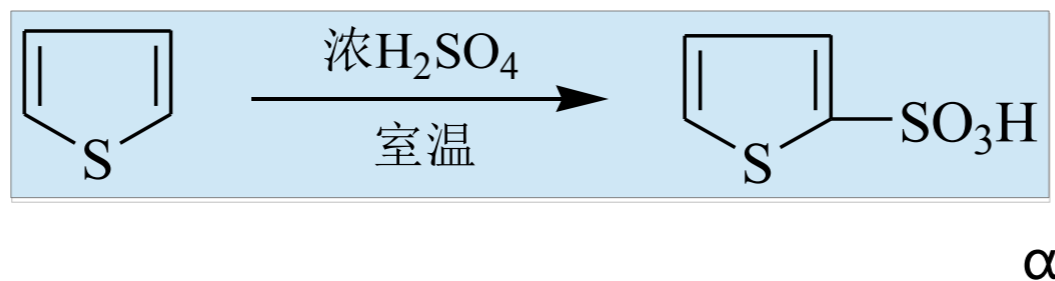
#### (3) 磺化反应



- 吡咯磺酸



- 呋喃磺酸



- 噻吩磺酸

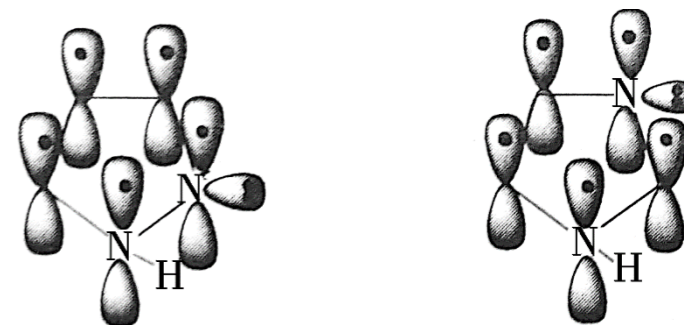
## 二、含有 2 个杂原子的五元杂环化合物

### (一) 吡唑和咪唑的结构

构



吡唑和咪唑的结构与吡咯类似，环上的碳原子和氮原子均以  $sp^2$  杂环轨道互相成键，构成平面五元环。其中 1- 位氮原子的未共用电子对占据没有参加杂化的  $p$  轨道，参与并形成了闭合的  $\pi$  电子共轭体系，而另一个氮原子上所具有的未共用电子对占据  $sp^2$  杂化轨道，未参与共轭体系的形成。



吡唑

咪唑



## 二、含有 2 个杂原子的五元杂环化合物

### (二) 吡唑和咪唑的性

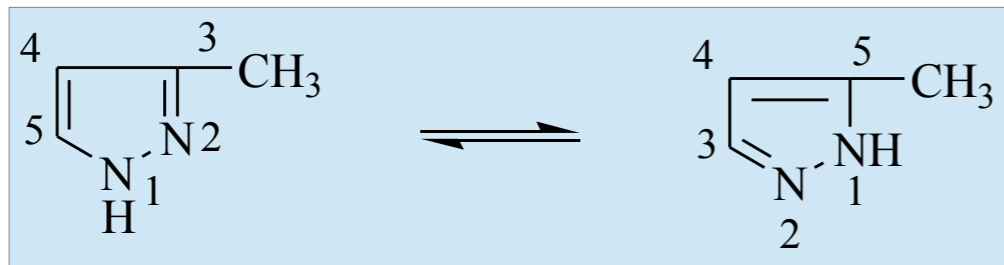
质

吡唑和咪唑都溶于水，在水中的溶解度比吡咯大。

吡唑和咪唑的碱性也都比吡咯强，能与强酸反应生成盐。

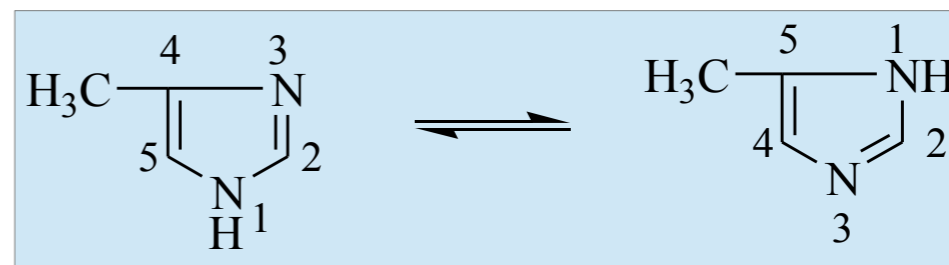
吡唑和咪唑性质稳定，遇酸不聚合。

吡唑和咪唑均有互变异构现象。



3- 甲基吡唑

5- 甲基吡唑



4- 甲基咪唑

5- 甲基咪唑



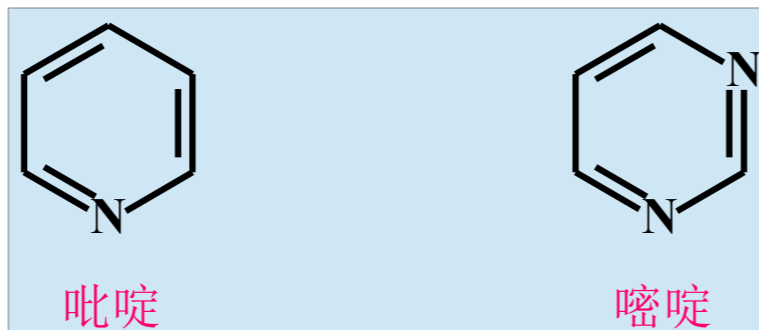
## 第三节

# 六元杂环化合物



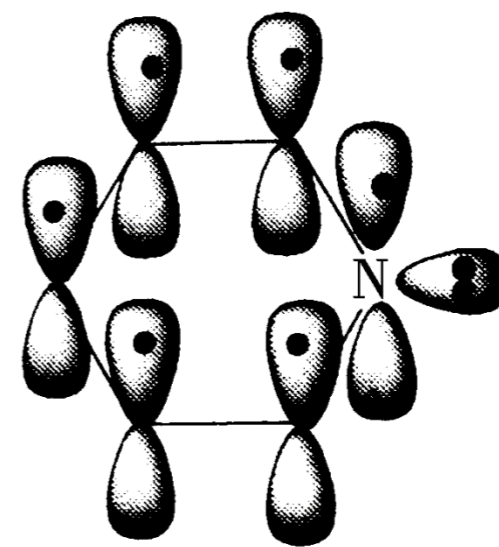


## 一、含有 1 个杂原子的六元杂环化合物



### (一) 吡啶的分子结构

吡啶的结构与苯相似，5 个碳原子和 1 个氮原子都以  $sp^2$  杂化轨道相互重叠，环上的 6 个原子都有 1 个垂直于该平面的未参与杂化的  $p$  轨道（各有 1 个电子）， $p$  轨道相互平行并重叠成闭合的  $\pi$  电子共轭体系，具有芳香性。

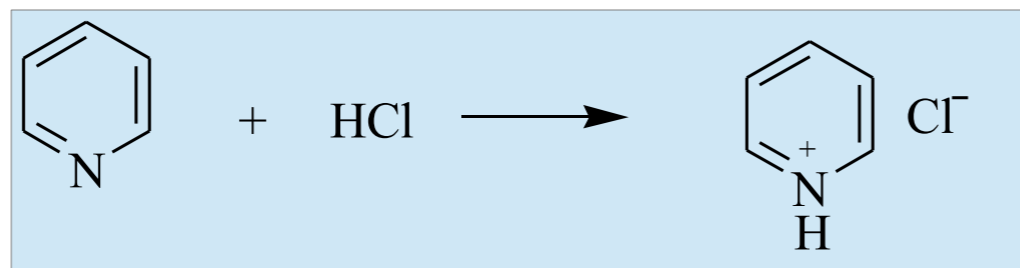


● 吡啶

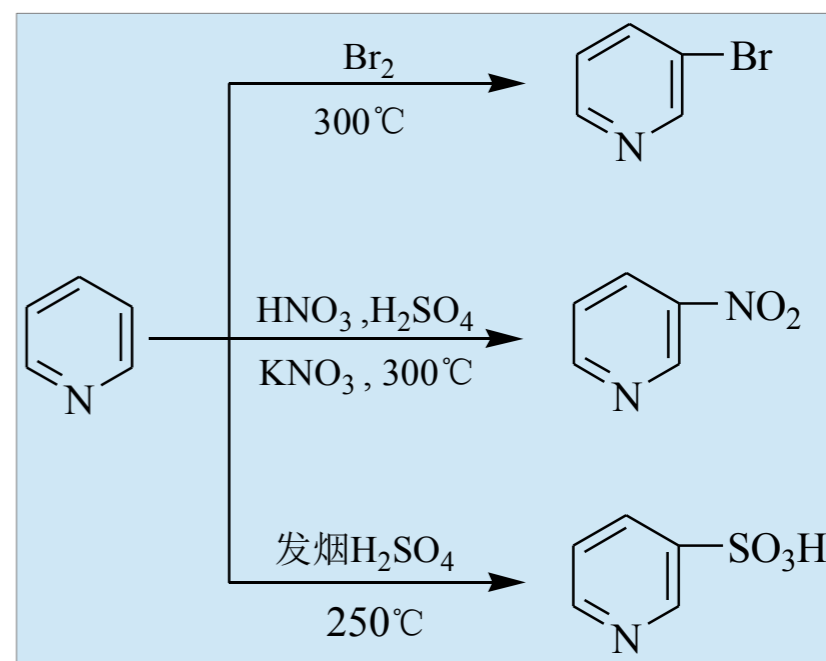
## (二) 吡啶的性质

吡啶是无色而有特殊臭味的液体，沸点为  $115.3^{\circ}\text{C}$ ，能与水混溶。吡啶还是一种良好的有机溶剂，可溶解大多数极性和非极性的有机化合物，甚至可以溶解某些无机盐。

1. **碱性** 显碱性， $\text{p}K_{\text{b}} = 8.8$ ，其碱性比苯胺略强，但比脂肪族胺和氨都弱。



2. **亲电取代反应** 比苯难，主要发生在  $\beta$ -位上，并且产率较低。

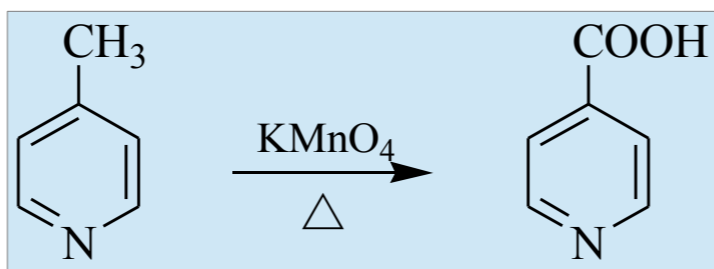




## (二) 吡啶的性质

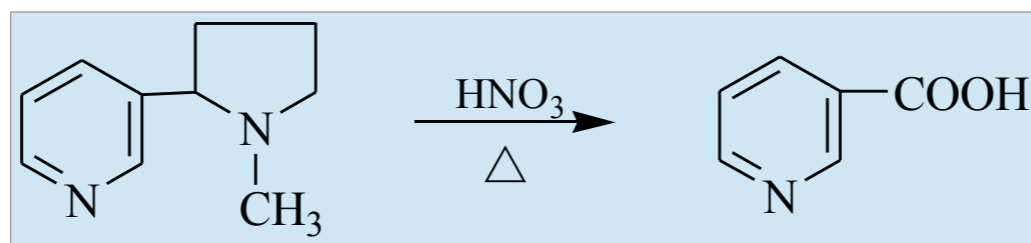
### 3. 氧化还原反应

吡啶环对氧化剂比较稳定，尤其在酸性条件下，吡啶更加稳定，很难被氧化。但当环上有烃基时，烃基吡啶容易被氧化成吡啶羧酸。例如：



$\gamma$ - 甲基吡啶

$\gamma$ - 吡啶甲酸



烟碱

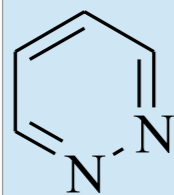
甲酸

$\beta$ - 吡啶

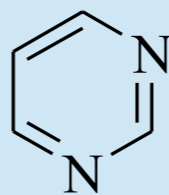




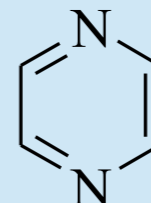
## 二、含有 2 个氮原子的六元杂环化合物



咪嗪

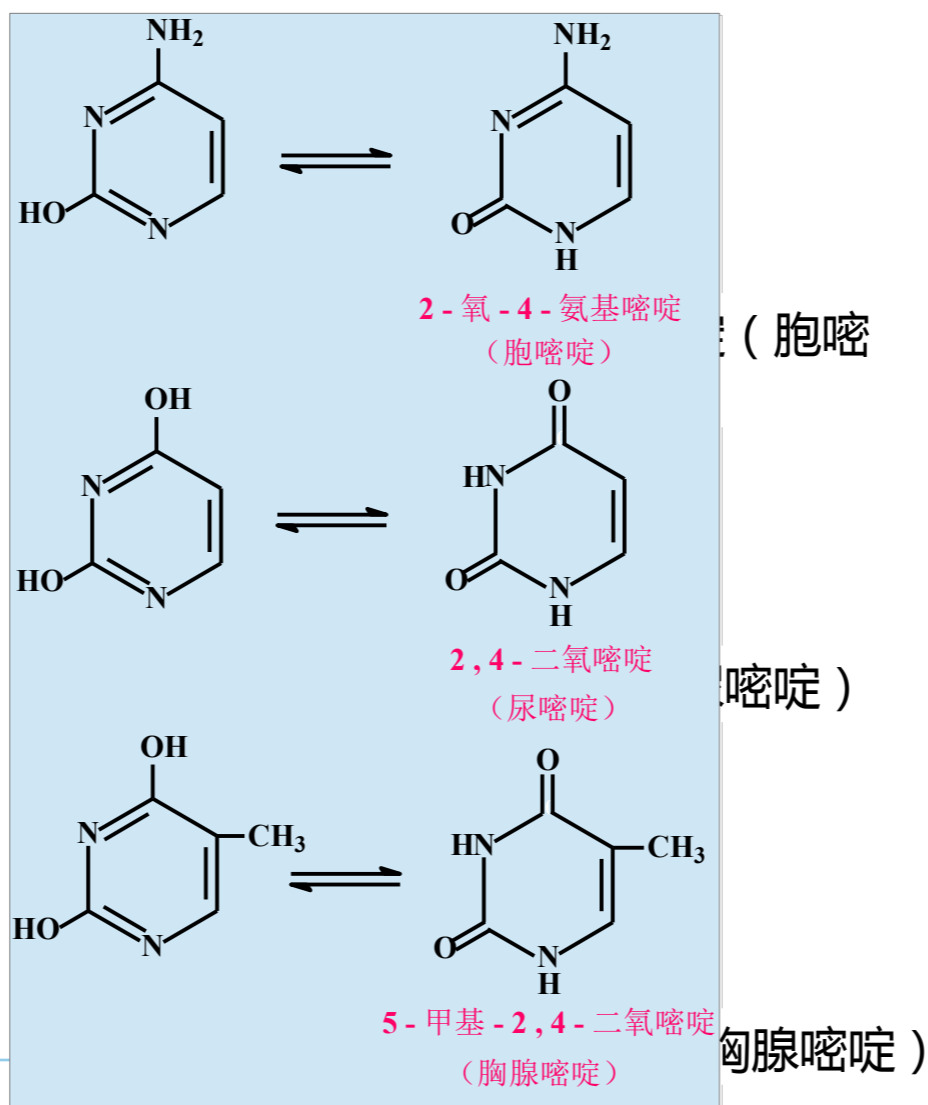


嘧啶



吡嗪

重要的嘧啶衍生物





# 第四节

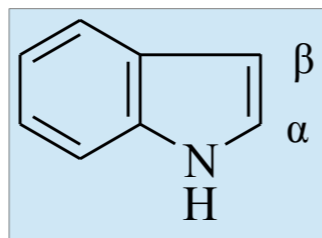
# 稠杂环化合物





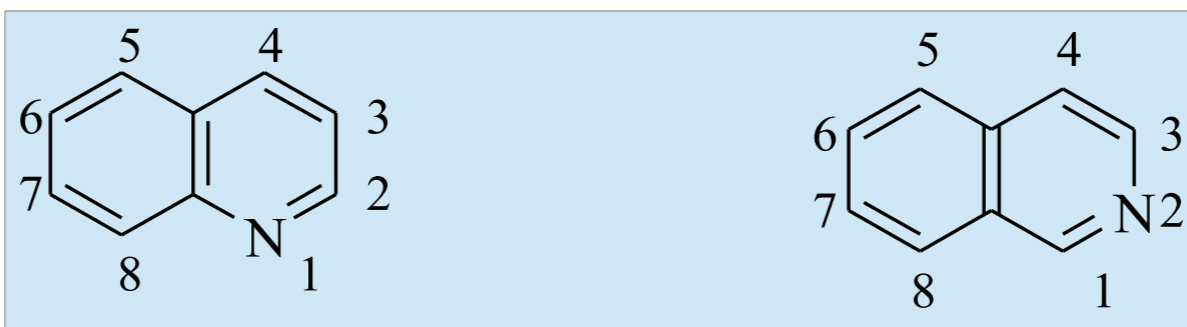
## 一、苯稠杂环化合物

### 1 . 吲哚



吲哚

### 2 . 喹啉和异喹啉

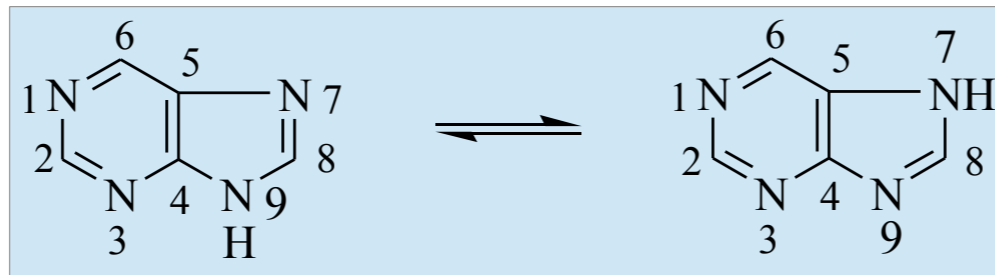


喹啉

异喹啉



## 二、杂环稠杂环化合物



9H- 嘌呤

7H- 嘌呤

