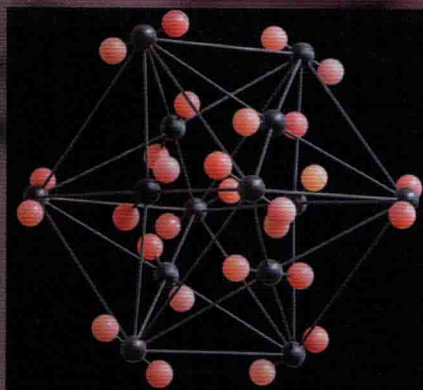
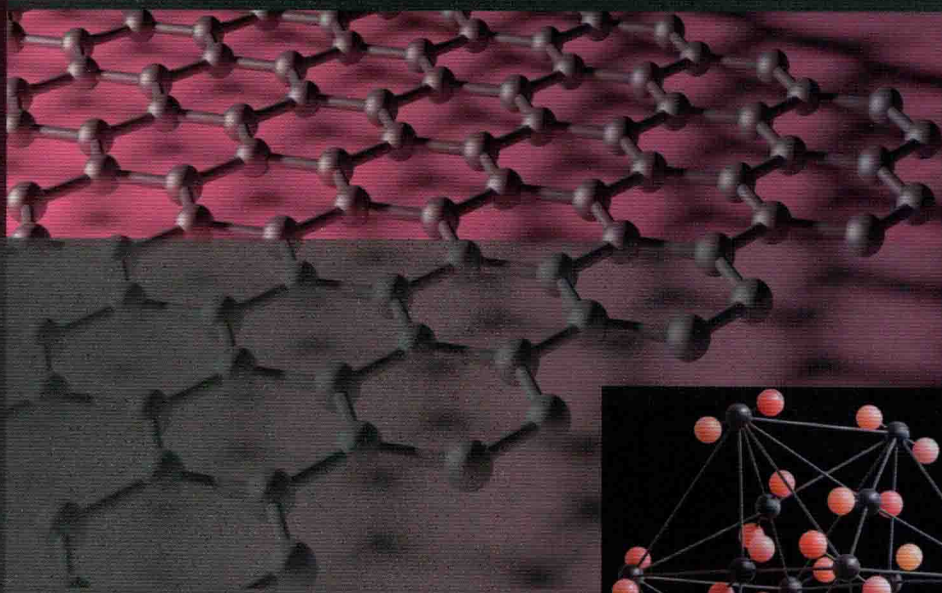


基础杂环化学

李兴海 张杨 秦培文 主编



JICHU ZAHUAN
HUAXUE



化学工业出版社

基础杂环化学

李兴海 张杨 秦培文 主编

JICHU ZAHUAN
HUAXUE



化学工业出版社

· 北京 ·

本书在概述杂环化合物的应用、分类、命名法等内容的基础上,按照环的大小和类型特点,分别详细介绍了三员、四员、五员、六员、七员五类单杂环以及苯并杂环和杂环并杂环两类稠杂环等典型杂环化合物的结构、化学性质、合成方法、衍生物与合成应用实例等内容。

全书条理清晰、基础理论与应用实例有机结合,适合作为应用化学、制药工程、有机化学相关专业学生的教材,也可以作为有机合成、药物合成等领域的研究人员使用。

图书在版编目(CIP)数据

基础杂环化学/李兴海,张杨,秦培文主编. —北京:
化学工业出版社, 2018. 11
ISBN 978-7-122-33073-4

I. ①基… II. ①李… ②张… ③秦… III. ①杂环化
合物 IV. ①O626

中国版本图书馆CIP数据核字(2018)第216736号

责任编辑:刘军
责任校对:杜杏然

文字编辑:向东
装帧设计:王晓宇

出版发行:化学工业出版社(北京市东城区青年湖南街13号 邮政编码100011)

印装:中煤(北京)印务有限公司

710mm×1000mm 1/16 印张21 字数388千字 2018年2月北京第1版第1次印刷

购书咨询:010-64518888 售后服务:010-64518899

网 址: <http://www.cip.com.cn>

凡购买本书,如有缺损质量问题,本社销售中心负责调换。

定 价: 88.00 元

版权所有 违者必究



本书编写人员名单

主编：李兴海 张 杨 秦培文

编写人员名单（按姓名汉语排序）

郭龙玉 李兴海 秦培文

王闽龙 张 坤 张 杨

前 言

PREFACE

有机化学发展迅速，随着有机合成技术的进步，每天都有大量的新化合物被发现、合成，其中杂环化合物越来越受到关注。杂环化合物的数量巨大、种类丰富、性能多样、应用广泛，特别是在药物化学中有重要的地位。国内的高校多在研究生阶段开设杂环化学相关的课程，而本科阶段是学习基础知识的最佳时期，杂环化学的知识内容对于学生的未来工作和深造学习很有帮助。为此，我们在10年前就为应用化学专业开设了杂环化学课程，经过多年的教学实践，学生反映良好。目前，还没有一本完全适合本科教学的杂环化学教材，为此，我们在多年教学经验的基础上，编写了《基础杂环化学》这本教材，希望能起到抛砖引玉的作用。本书在对杂环化合物的分类、命名基础知识介绍的同时，重点对典型杂环化合物的结构、性质、合成、衍生物、应用方面的知识进行了详细的介绍。通过这些内容的学习，学生可以对杂环化合物的知识体系有一个全面的了解，使得他们的有机化学知识体系更加完备。本书第1章、第2章、第5章、第8章、第9章由李兴海完成，第3章、第4章、第7章由张杨、李兴海完成，第6章由秦培文、李兴海完成。王闽龙、张坤和郭龙玉完成了画图、文字编辑以及部分编写工作。全书由李兴海统稿完成。

在本书的编写和出版过程中得到了化学工业出版社编辑的大力支持，在此表示感谢。

由于时间和水平所限，书中存在遗漏和不足在所难免，请广大读者多提宝贵意见。

编者

2018年10月

目 录 CONTENTS

1 绪论 / 001

- 1.1 杂环化合物的应用简介 / 001
 - 1.2 杂环化合物的概念 / 002
 - 1.3 杂环化合物的分类 / 003
 - 1.3.1 按照构成杂环的原子数目分类 / 003
 - 1.3.2 按照分子结构中环的数目、性质和连接方式分类 / 003
 - 1.3.3 按照杂环结构的不饱和度分类 / 004
 - 1.3.4 按照芳香性分类 / 005
 - 1.4 芳香共振能 / 006
 - 1.5 常见的芳香族杂环体系 / 006
- 思考题 / 007

2 杂环化合物的命名 / 008

- 2.1 Hantzsch-Widman 命名法 / 008
 - 2.1.1 杂原子的种类与排序(词头) / 008
 - 2.1.2 环的大小表示方法(词尾) / 009
 - 2.1.3 单环体系的命名 / 009
 - 2.1.4 含一个杂原子单环体系的编号规则 / 010
 - 2.1.5 含两个或多个相同杂原子的单环体系编号规则 / 010
 - 2.1.6 含两个或多个不同杂原子的单环体系的命名 / 010
 - 2.1.7 相同杂环由单键连接的环系的命名 / 011
 - 2.1.8 含一个苯环的双环体系(苯并稠杂环体系)的命名 / 011
 - 2.1.9 含两个或多个杂原子的双环和多环体系的命名 / 012
 - 2.1.10 标记氢原子的表示 / 013

2. 1. 11 Hantzsch-Widman 命名实例 / 014

2.2 置换命名法 / 015

2.2.1 单环体系 / 015

2.2.2 稠杂环体系 / 015

2.2.3 桥杂环体系 / 016

2.2.4 置换命名法举例 / 016

思考题 / 017

3 三员杂环 / 018

3.1 氧杂环丙烷 / 018

3.1.1 氧杂环丙烷的结构 / 018

3.1.2 氧杂环丙烷的化学性质 / 018

3.1.3 氧杂环丙烷的合成 / 021

3.1.4 氧杂环丙烷的衍生物 / 023

3.1.5 氧杂环丙烷的合成应用实例 / 025

3.2 硫杂环丙烷 / 025

3.2.1 硫杂环丙烷的结构 / 025

3.2.2 硫杂环丙烷的化学性质 / 026

3.2.3 硫杂环丙烷的合成 / 027

3.2.4 硫杂环丙烷的衍生物 / 027

3.2.5 硫杂环丙烷的合成应用实例 / 027

3.3 氮杂环丙烷 / 028

3.3.1 氮杂环丙烷的结构 / 028

3.3.2 氮杂环丙烷的化学性质 / 028

3.3.3 氮杂环丙烷的合成 / 029

3.3.4 氮杂环丙烷的衍生物 / 031

3.4 其他三员杂环 / 032

3.4.1 二氧杂环丙烷 / 032

3.4.2 氧氮杂环丙烷 / 032

3.4.3 二氮杂环丙烷 / 034

3.4.4 3H-二氮杂环丙烯 / 034

思考题 / 035

4 四员杂环 / 036

4.1 氧杂环丁烷 / 036

- 4.1.1 氧杂环丁烷的结构 / 036
- 4.1.2 氧杂环丁烷的化学性质 / 036
- 4.1.3 氧杂环丁烷的合成 / 037
- 4.1.4 氧杂环丁烷的衍生物 / 038
- 4.2 硫杂环丁烷 / 039
 - 4.2.1 硫杂环丁烷的结构 / 039
 - 4.2.2 硫杂环丁烷的化学性质 / 039
 - 4.2.3 硫杂环丁烷的合成 / 040
- 4.3 氮杂环丁烷 / 041
 - 4.3.1 氮杂环丁烷的结构 / 041
 - 4.3.2 氮杂环丁烷的化学性质 / 041
 - 4.3.3 氮杂环丁烷的合成 / 041
 - 4.3.4 氮杂环丁烷的衍生物与合成应用实例 / 042
- 4.4 其他的四员杂环 / 043
 - 4.4.1 1,2-二氧环丁烷 / 043
 - 4.4.2 1,2-二氮杂环丁烷 / 044
- 思考题 / 045

5 五员杂环 / 046

- 5.1 呋喃 / 046
 - 5.1.1 呋喃的结构 / 046
 - 5.1.2 呋喃的化学性质 / 048
 - 5.1.3 呋喃的合成 / 053
 - 5.1.4 呋喃的衍生物 / 055
 - 5.1.5 呋喃的合成应用实例 / 058
- 5.2 噻吩 / 058
 - 5.2.1 噻吩的结构 / 058
 - 5.2.2 噻吩的化学性质 / 059
 - 5.2.3 噻吩的合成 / 062
 - 5.2.4 噻吩的衍生物 / 064
 - 5.2.5 噻吩的合成应用实例 / 066
- 5.3 吡咯 / 066
 - 5.3.1 吡咯的结构 / 066
 - 5.3.2 吡咯的化学性质 / 068

- 5.3.3 吡咯的合成 / 071
- 5.3.4 吡咯的衍生物 / 073
- 5.3.5 吡咯的合成应用实例 / 075
- 5.4 噁唑 / 075
 - 5.4.1 噁唑的结构 / 075
 - 5.4.2 噁唑的化学性质 / 076
 - 5.4.3 噁唑的合成 / 079
 - 5.4.4 噁唑的衍生物 / 081
 - 5.4.5 噁唑的合成应用实例 / 083
- 5.5 异噁唑 / 083
 - 5.5.1 异噁唑的结构 / 083
 - 5.5.2 异噁唑的化学性质 / 084
 - 5.5.3 异噁唑的合成 / 085
 - 5.5.4 异噁唑的衍生物 / 086
 - 5.5.5 异噁唑的合成应用实例 / 087
- 5.6 噻唑 / 088
 - 5.6.1 噻唑的结构 / 088
 - 5.6.2 噻唑的化学性质 / 089
 - 5.6.3 噻唑的合成 / 092
 - 5.6.4 噻唑的衍生物 / 093
 - 5.6.5 噻唑的合成应用实例 / 094
- 5.7 异噻唑 / 095
 - 5.7.1 异噻唑的结构 / 095
 - 5.7.2 异噻唑的化学性质 / 095
 - 5.7.3 异噻唑的合成 / 098
 - 5.7.4 异噻唑的衍生物 / 099
- 5.8 咪唑 / 099
 - 5.8.1 咪唑的结构 / 099
 - 5.8.2 咪唑的化学性质 / 100
 - 5.8.3 咪唑的合成 / 104
 - 5.8.4 咪唑的衍生物 / 106
 - 5.8.5 咪唑的合成应用实例 / 108
- 5.9 吡唑 / 108
 - 5.9.1 吡唑的结构 / 108

- 5. 9. 2 吡啶的化学性质 / 109
- 5. 9. 3 吡啶的合成 / 112
- 5. 9. 4 吡啶的衍生物 / 114
- 5. 10 噁二唑 / 117
 - 5. 10. 1 噁二唑的结构 / 117
 - 5. 10. 2 噁二唑的化学性质 / 117
 - 5. 10. 3 噁二唑的合成 / 118
 - 5. 10. 4 噁二唑的衍生物 / 120
- 5. 11 噻二唑 / 121
 - 5. 11. 1 噻二唑的结构 / 121
 - 5. 11. 2 噻二唑的化学性质 / 121
 - 5. 11. 3 噻二唑的合成 / 123
 - 5. 11. 4 噻二唑的衍生物 / 125
 - 5. 11. 5 噻二唑的合成应用实例 / 126
- 5. 12 三唑 / 126
 - 5. 12. 1 三唑的结构 / 126
 - 5. 12. 2 三唑的化学性质 / 127
 - 5. 12. 3 三唑的合成 / 130
 - 5. 12. 4 三唑的衍生物 / 131
 - 5. 12. 5 三唑的合成应用实例 / 132
- 5. 13 四唑 / 133
 - 5. 13. 1 四唑的结构 / 133
 - 5. 13. 2 四唑的化学性质 / 134
 - 5. 13. 3 四唑的合成 / 136
 - 5. 13. 4 四唑的衍生物 / 137
 - 5. 13. 5 四唑的合成应用实例 / 139
- 思考题 / 139

6 六员杂环 / 141

- 6. 1 吡喃鎓离子 / 141
 - 6. 1. 1 吡喃鎓离子的结构 / 141
 - 6. 1. 2 吡喃鎓离子的化学性质 / 142
 - 6. 1. 3 吡喃鎓离子的合成 / 146
 - 6. 1. 4 吡喃鎓离子的衍生物 / 147

- 6.1.5 吡喃鎓离子的合成应用实例 / 149
- 6.2 2H-吡喃-2-酮 / 149
 - 6.2.1 2H-吡喃-2-酮的结构 / 149
 - 6.2.2 2H-吡喃-2-酮的化学性质 / 150
 - 6.2.3 2H-吡喃-2-酮的合成方法 / 151
 - 6.2.4 2H-吡喃-2-酮的衍生物与应用实例 / 152
- 6.3 4H-吡喃-4-酮 / 152
 - 6.3.1 4H-吡喃-4-酮的结构 / 152
 - 6.3.2 4H-吡喃-4-酮的化学性质 / 153
 - 6.3.3 4H-吡喃-4-酮的合成方法 / 154
 - 6.3.4 4H-吡喃-4-酮的衍生物 / 154
 - 6.3.5 4H-吡喃-4-酮的合成应用实例 / 155
- 6.4 吡啶 / 155
 - 6.4.1 吡啶的结构 / 155
 - 6.4.2 吡啶的化学性质 / 156
 - 6.4.3 吡啶的合成方法 / 163
 - 6.4.4 吡啶的衍生物 / 166
 - 6.4.5 吡啶的合成应用实例 / 168
- 6.5 哒嗪 / 169
 - 6.5.1 哒嗪的结构 / 169
 - 6.5.2 哒嗪的化学性质 / 169
 - 6.5.3 哒嗪的合成方法 / 172
 - 6.5.4 哒嗪的衍生物 / 173
 - 6.5.5 哒嗪的合成应用实例 / 174
- 6.6 嘧啶 / 175
 - 6.6.1 嘧啶的结构 / 175
 - 6.6.2 嘧啶的化学性质 / 175
 - 6.6.3 嘧啶的合成方法 / 179
 - 6.6.4 嘧啶的衍生物 / 181
 - 6.6.5 嘧啶的合成应用实例 / 184
- 6.7 吡嗪 / 184
 - 6.7.1 吡嗪的结构 / 184
 - 6.7.2 吡嗪的化学性质 / 185
 - 6.7.3 吡嗪的合成方法 / 187

- 6.7.4 吡嗪的衍生物 / 188
- 6.8 1,2,3-三嗪 / 190
 - 6.8.1 1,2,3-三嗪的结构 / 190
 - 6.8.2 1,2,3-三嗪的化学性质 / 190
 - 6.8.3 1,2,3-三嗪的合成方法 / 191
 - 6.8.4 1,2,3-三嗪的衍生物 / 192
- 6.9 1,2,4-三嗪 / 192
 - 6.9.1 1,2,4-三嗪的结构 / 192
 - 6.9.2 1,2,4-三嗪的化学性质 / 192
 - 6.9.3 1,2,4-三嗪的合成方法 / 193
 - 6.9.4 1,2,4-三嗪的衍生物 / 194
- 6.10 1,3,5-三嗪 / 195
 - 6.10.1 1,3,5-三嗪的结构 / 195
 - 6.10.2 1,3,5-三嗪的化学性质 / 195
 - 6.10.3 1,3,5-三嗪的合成方法 / 197
 - 6.10.4 1,3,5-三嗪的衍生物 / 197
- 思考题 / 199

7 七员杂环 / 200

- 7.1 氧杂环庚三烯 / 200
 - 7.1.1 氧杂环庚三烯的结构 / 200
 - 7.1.2 氧杂环庚三烯的化学性质 / 201
 - 7.1.3 氧杂环庚三烯的合成方法 / 202
 - 7.1.4 氧杂环庚三烯的衍生物 / 202
- 7.2 硫杂环庚三烯 / 203
 - 7.2.1 硫杂环庚三烯的结构 / 203
 - 7.2.2 硫杂环庚三烯的合成方法 / 203
- 7.3 氮杂环庚三烯 / 204
 - 7.3.1 氮杂环庚三烯的结构 / 204
 - 7.3.2 氮杂环庚三烯的化学性质 / 204
 - 7.3.3 氮杂环庚三烯的合成方法 / 205
 - 7.3.4 氮杂环庚三烯的衍生物 / 205
- 7.4 二氮杂环庚三烯 / 207
 - 7.4.1 二氮杂环庚三烯的结构 / 207

7.4.2 二氮杂环庚三烯的合成方法 / 207

7.4.3 二氮杂环庚三烯的衍生物 / 208

思考题 / 209

8 苯并杂环 / 210

8.1 苯并呋喃杂环 / 210

8.1.1 苯并呋喃的结构 / 210

8.1.2 苯并呋喃的化学性质 / 210

8.1.3 苯并呋喃的合成方法 / 212

8.1.4 苯并呋喃的衍生物 / 214

8.2 苯并噻吩杂环 / 214

8.2.1 苯并噻吩的结构 / 214

8.2.2 苯并噻吩的化学性质 / 215

8.2.3 苯并噻吩的合成方法 / 215

8.3 吲哚 / 216

8.3.1 吲哚的结构 / 216

8.3.2 吲哚的化学性质 / 216

8.3.3 吲哚的合成 / 223

8.3.4 吲哚的衍生物 / 227

8.3.5 吲哚的合成应用实例 / 229

8.4 苯并噻唑 / 230

8.4.1 苯并噻唑的结构 / 230

8.4.2 苯并噻唑的化学性质 / 230

8.4.3 苯并噻唑的合成 / 231

8.4.4 苯并噻唑的衍生物 / 231

8.5 苯并咪唑 / 232

8.5.1 苯并咪唑的结构 / 232

8.5.2 苯并咪唑的化学性质 / 232

8.5.3 苯并咪唑的合成 / 233

8.5.4 苯并咪唑的衍生物 / 234

8.6 苯并吡唑 / 234

8.6.1 苯并吡唑的结构 / 234

8.6.2 苯并吡唑的化学性质 / 234

8.6.3 苯并吡唑的合成 / 236

- 8.6.4 苯并吡唑的衍生物 / 236
- 8.7 苯并三唑 / 237
 - 8.7.1 苯并三唑的结构 / 237
 - 8.7.2 苯并三唑的化学性质 / 237
 - 8.7.3 苯并三唑的合成 / 238
 - 8.7.4 苯并三唑的衍生物 / 238
- 8.8 2H-色原烯-2-酮 / 239
 - 8.8.1 2H-色原烯-2-酮的结构 / 239
 - 8.8.2 2H-色原烯-2-酮的化学性质 / 239
 - 8.8.3 2H-色原烯-2-酮的合成 / 241
 - 8.8.4 2H-色原烯-2-酮的衍生物 / 242
 - 8.8.5 2H-色原烯-2-酮的合成应用实例 / 242
- 8.9 4H-色原烯-4-酮 / 243
 - 8.9.1 4H-色原烯-4-酮的结构 / 243
 - 8.9.2 4H-色原烯-4-酮的化学性质 / 243
 - 8.9.3 4H-色原烯-4-酮的合成 / 245
 - 8.9.4 4H-色原烯-4-酮的衍生物 / 246
 - 8.9.5 4H-色原烯-4-酮的合成应用实例 / 247
- 8.10 喹啉 / 248
 - 8.10.1 喹啉的结构 / 248
 - 8.10.2 喹啉的化学性质 / 248
 - 8.10.3 喹啉的合成方法 / 255
 - 8.10.4 喹啉的衍生物 / 258
 - 8.10.5 喹啉的衍生物与合成应用实例 / 260
- 8.11 异喹啉 / 261
 - 8.11.1 异喹啉的结构 / 261
 - 8.11.2 异喹啉的化学性质 / 261
 - 8.11.3 异喹啉的合成方法 / 265
 - 8.11.4 异喹啉的衍生物 / 268
- 8.12 1,5-苯并二氮杂环庚三烯 / 269
 - 8.12.1 1,5-苯并二氮杂环庚三烯的结构 / 269
 - 8.12.2 1,5-苯并二氮杂环庚三烯的化学性质 / 269
 - 8.12.3 1,5-苯并二氮杂环庚三烯的合成 / 270
 - 8.12.4 1,5-苯并二氮杂环庚三烯的衍生物 / 270

- 8. 13 1,4-苯并二氮杂环庚三烯 / 270
 - 8. 13. 1 1,4-苯并二氮杂环庚三烯的结构 / 270
 - 8. 13. 2 1,4-苯并二氮杂环庚三烯的化学性质 / 271
 - 8. 13. 3 1,4-苯并二氮杂环庚三烯的合成 / 271
 - 8. 13. 4 1,4-苯并二氮杂环庚三烯的衍生物与合成应用实例 / 272
- 思考题 / 272

9 杂环并杂环 / 273

- 9. 1 青霉素 / 273
 - 9. 1. 1 青霉素的结构 / 273
 - 9. 1. 2 青霉素的化学性质 / 273
 - 9. 1. 3 青霉素的衍生物 / 274
 - 9. 1. 4 青霉素的合成 / 274
- 9. 2 头孢烯 / 275
 - 9. 2. 1 头孢烯的结构 / 275
 - 9. 2. 2 头孢烯的衍生物 / 275
 - 9. 2. 3 头孢菌素的合成 / 275
- 9. 3 吡唑并吡啶 / 278
 - 9. 3. 1 吡唑并吡啶的结构 / 278
 - 9. 3. 2 吡唑并吡啶的合成 / 279
 - 9. 3. 3 吡唑并吡啶的衍生物与合成应用实例 / 282
- 9. 4 咪唑并吡啶 / 283
 - 9. 4. 1 咪唑并吡啶的结构 / 283
 - 9. 4. 2 咪唑并吡啶的合成 / 283
 - 9. 4. 3 咪唑并吡啶的衍生物与合成应用实例 / 285
- 9. 5 嘌呤类杂环 / 286
 - 9. 5. 1 嘌呤的结构 / 286
 - 9. 5. 2 嘌呤的化学性质 / 287
 - 9. 5. 3 嘌呤的合成方法 / 293
 - 9. 5. 4 嘌呤的衍生物 / 295
- 9. 6 吡啶并嘧啶 / 297
 - 9. 6. 1 吡啶并嘧啶的结构 / 297
 - 9. 6. 2 吡啶并嘧啶的合成 / 297
 - 9. 6. 3 吡啶并嘧啶的衍生物与合成应用实例 / 302

9.7 蝶啶 / 304

9.7.1 蝶啶的结构 / 304

9.7.2 蝶啶的化学性质 / 304

9.7.3 蝶啶的合成 / 304

9.7.4 蝶啶的衍生物 / 305

9.8 嘧啶并嘧啶 / 306

9.8.1 嘧啶并嘧啶的结构 / 306

9.8.2 嘧啶并嘧啶的合成 / 306

9.8.3 嘧啶并嘧啶的衍生物与合成应用实例 / 309

思考题 / 310

杂环化合物列表 / 311

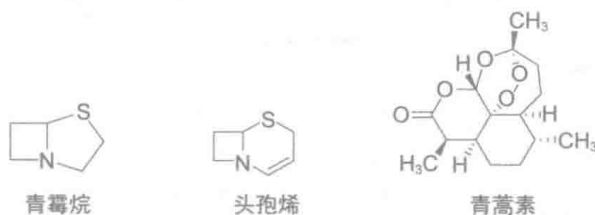
参考文献 / 317

1 绪论

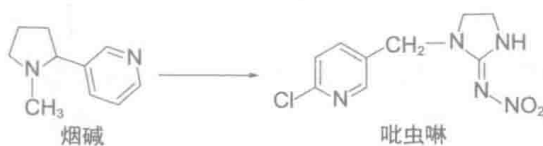
1.1 杂环化合物的应用简介

杂环化合物的种类繁多，数量占到已报道化合物的50%以上，而且许多杂环化合物具有优异的性能，特别是在天然产物、药物当中广泛存在。

青霉素和头孢类药物的核心结构青霉烷和头孢烯即是双杂环结构，用于疟疾防治的青蒿素是含有多个氧原子的多杂环化合物。



烟碱是广泛存在于烟叶当中的生物碱类天然产物，本身具有杀虫活性，以其为先导化合物开发出了第一代新烟碱类杀虫剂吡虫啉。



嘌呤和嘧啶是存在于生物体内的最广泛的杂环化合物，嘌呤与特定的嘧啶碱基在一起时，是DNA和RNA的组成成分，在生命过程中极其重要。

