

中等专业学校教材

药物合成反应

何敬文 主编 姚庆祥 主审

中国医药科技出版社

15

中等专业学校教材

药物合成反应

主 编 何敬文 (山东省医药工业学校)
主 审 姚庆祥 (沈阳药科大学)
参编人员 张淑蓉 (山西省中药材学校)
陈 力 (湖北省制药工业学校)

中国医药科技出版社

10078 70
登记证号：(京) 075 号

内 容 提 要

本书是国家医药管理局组织编写的医药中等专业学校教材。除绪论外，其余12章介绍了卤化、硝化、磺化、重氮化、氧化、还原、消除、烃化、酰化、缩合、环合和重排反应。为突出实用性，各章以试剂或原料为主线，阐明药物合成反应的机理、条件、影响因素、应用与限制等。章末有习题。书后的12个实验覆盖面广，实用可靠。书末附常用符号、缩语和略语表、人名反应对照、主要参考书目等。

本书内容翔实，富有中专特色，适用于中等医药学校化学制药专业及相关专业。还可作职工中专、技工学校或药厂岗位培训教材。

图书在版编目 (CIP) 数据

药物合成反应/何敬文主编. - 北京: 中国医药科技出版社, 1995

中等专业学校教材

ISBN 7-5067-1476-0

I. 药… II. 何… III. 药物-化学合成-专业学校-教材
IV. TQ460.31

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (95) 第 16452 号

中国医药科技出版社 出版
(北京西直门外北礼士路甲 38 号)
(邮政编码: 100810)

北京中煤新大印刷厂 排版
河北省昌黎县印刷厂 印刷
全国各地新华书店 经销

*

开本 787×1092mm¹/₁₆ 印张 30¹/₂

字数 741 千字 印数 1—15000

1995 年 12 月第 1 版 1995 年 12 月第 1 次印刷

定价: 24.00 元



编写说明

本书是国家医药管理局组织编写的医药中等专业学校教材，供化学制药专业及相关专业使用，也可作为职工中专、技工学校和药厂岗位培训教材。

全书正文部分共计13章。第一章为绪论；第二至第八章讨论了以原子或官能团的引入和转化为主的卤化、硝化、磺化、重氮化、氧化、还原和消除反应；第九至第十三章讨论了以有机分子骨架改变为主的烃化、酰化、缩合、环合和重排反应。为突出实用性，各章以试剂或原料为主线，深入浅出地阐明药物合成反应的概念、机理、反应条件、主要影响因素、应用与限制等。章末有习题。实验部分共收载12个实验，既涉及重要的药物合成反应类型，又注重实验操作技能基本训练和综合训练，实用可靠。书末附有常用符号、缩语和略语表、人名反应对照及主要参考书目。

本书整体构思新颖，内容简明实用，注重理论联系实际。在保证基础知识教学的同时，适当介绍了新反应、新试剂在药物合成中的应用以及发展动向。

山东省医药工业学校何敬文担任本书主编，并编写了第一、二、七、十一、十三章和部分实验。山西省中药材学校张淑蓉编写了第三、六、八、九章和部分实验。湖北省制药工业学校陈力编写了第四、五、十和十二章。初稿完成后，由沈阳药科大学姚庆祥教授主审，并在武汉召开了定稿会议。本书的编写工作自始至终得到有关领导及编者所在学校的大力支持和帮助。许多生产、科研和教学单位提供了宝贵的资料，并对编写大纲和初稿提出了中肯的修改意见。国家医药管理局张象麟同志对编写工作作了具体指导。特在此一并表示感谢。

由于编者水平及编写时间所限，错漏之处在所难免，恳请读者批评指正。

编者
1995年12月

目 录

第一章 绪论	(1)
一、药物合成反应学科的研究对象、内容、任务和作用.....	(1)
二、药物合成反应的分类方法及所用原料.....	(2)
(一) 药物合成反应的分类方法.....	(2)
(二) 药物合成中的原料.....	(2)
(三) 试剂的分类.....	(3)
三、化学制药工业的特点.....	(4)
四、理论联系实际, 学好药物合成反应.....	(5)
习题.....	(5)
第二章 卤化反应	(6)
第一节 概述	(6)
一、卤化反应的概念.....	(6)
二、卤化反应在药物合成中的应用.....	(7)
第二节 卤素卤化剂	(8)
一、卤素与烯烃的反应.....	(8)
二、卤素与炔烃的反应.....	(10)
三、卤素与芳烃的反应.....	(11)
(一) 芳环上的卤化.....	(11)
(二) 芳烃侧链的卤化.....	(14)
四、卤素与羰基化合物的反应.....	(17)
(一) 卤素与酮的反应.....	(17)
(二) 卤素与醛的反应.....	(20)
(三) 卤素与羧酸或其衍生物的反应.....	(20)
第三节 卤化氢卤化剂	(21)
一、卤化氢与烯烃的反应.....	(22)
二、卤化氢与炔烃的反应.....	(23)
三、卤化氢或氢卤酸与醇的反应.....	(23)
四、氢卤酸与醚的反应.....	(25)
五、氯化氧化反应.....	(27)
第四节 含硫卤化剂和含磷卤化剂	(28)
一、硫酰氯.....	(28)
二、亚硫酰氯.....	(29)
(一) 亚硫酰氯与醇的反应.....	(29)

(二) 亚硫酸氯与羧酸的反应	(31)
(三) 亚硫酸氯与二甲基甲酰胺组成的试剂	(32)
三、亚硫酸溴	(35)
四、三卤化磷	(35)
五、三氯化磷	(36)
六、五氯化磷	(37)
第五节 其它卤化剂	(38)
一、卤化物	(38)
(一) 卤素交换反应	(38)
(二) 磷酸酯的卤置换反应	(40)
二、次卤酸盐	(41)
三、一氯化碘	(42)
四、N-溴代琥珀酰亚胺	(42)
五、N-氯代琥珀酰亚胺	(43)
习题	(44)
第三章 硝化反应	(48)
第一节 概述	(48)
一、硝化反应的概念	(48)
二、硝化反应在药物合成中的应用	(49)
第二节 常用硝化剂及应用	(49)
一、硝酸硝化剂	(50)
二、硝酸-硫酸(混酸)硝化剂	(52)
三、硝酸盐-硫酸硝化剂	(54)
四、硝酸-醋酐硝化剂	(54)
第三节 硝化反应的主要影响因素	(56)
一、被硝化物的结构	(56)
二、硝化剂	(67)
三、温度	(68)
四、催化剂	(69)
五、搅拌	(69)
六、硝化反应的副反应	(69)
七、乙苯的硝化过程	(71)
第四节 亚硝化反应	(72)
一、概述	(72)
二、碳原子上的亚硝化反应	(73)
三、氮原子上的亚硝化反应	(74)
习题	(75)
第四章 磺化反应	(77)
第一节 概述	(77)

一、磺化反应的概念	(77)
二、磺化反应在药物合成中的应用	(77)
第二节 磺化剂及磺化理论	(78)
一、硫酸和发烟硫酸	(78)
(一) 反应机理	(79)
(二) 反应条件与反应方向	(79)
二、三氧化硫	(81)
(一) 反应机理与特点	(81)
(二) 三氧化硫磺化方法	(82)
三、氯磺酸	(83)
(一) 氯磺化反应机理	(84)
(二) 反应条件与反应方向	(84)
第三节 影响磺化反应的因素	(85)
一、磺化反应的主要影响因素	(85)
(一) 磺化剂的浓度及磺化 π 值	(85)
(二) 被磺化物的结构	(86)
(三) 反应温度	(88)
(四) 催化剂和辅助剂	(90)
二、氯磺化反应的主要影响因素	(91)
(一) 原料配比	(92)
(二) 反应温度	(92)
第四节 磺酸和磺酰氯化合物的性质及应用	(92)
一、酸性与成盐	(92)
二、磺酸基的水解	(93)
三、磺酸基的置换反应	(93)
四、磺酰氯的水解、醇解、氨解及应用	(94)
习题	(95)
第五章 重氮化反应	(97)
第一节 概述	(97)
一、重氮化反应的概念	(97)
二、常用重氮化剂	(97)
三、重氮化反应在药物合成中的应用	(97)
第二节 重氮化反应机理和主要影响因素	(99)
一、重氮化反应机理	(99)
二、主要影响因素	(101)
第三节 重氮盐的性质	(102)
一、水溶性	(102)
二、不稳定性	(103)
三、重氮盐的置换反应	(103)

(一) 被卤素置换·····	(104)
(二) 被氰基置换·····	(106)
(三) 被羟基置换 (重氮盐的水解反应) ·····	(107)
(四) 被氢原子置换 (去氨基反应) ·····	(108)
四、重氮盐的偶合反应·····	(109)
(一) 反应机理·····	(109)
(二) 主要影响因素·····	(110)
五、重氮盐的还原反应·····	(111)
第四节 重氮化操作方法·····	(112)
一、直接法·····	(112)
二、连续操作法·····	(113)
三、倒加料法·····	(114)
四、浓酸法·····	(114)
五、亚硝酸酯法·····	(115)
习题·····	(116)
第六章 氧化反应 ·····	(118)
第一节 概述·····	(118)
一、氧化反应的概念·····	(118)
二、氧化反应的类型·····	(119)
三、氧化反应在药物合成中的应用·····	(120)
第二节 常用无机氧化剂·····	(121)
一、锰化合物·····	(121)
(一) 高锰酸盐·····	(121)
(二) 二氧化锰·····	(126)
二、铬化合物·····	(128)
(一) 铬酸·····	(129)
(二) 三氧化铬-吡啶络合物·····	(134)
(三) 铬酐醋酸酯·····	(136)
(四) 叔丁基铬酸酯·····	(137)
(五) 二氯铬酐·····	(137)
三、硝酸氧化剂·····	(138)
四、含卤氧化剂·····	(139)
(一) 卤素·····	(139)
(二) 次卤酸盐·····	(141)
五、过氧化氢·····	(142)
六、其它氧化剂·····	(146)
(一) 高铁氧化钾·····	(146)
(二) 含银氧化剂·····	(147)
(三) 二氧化硒·····	(148)

第三节 有机氧化剂	(151)
一、欧芬脑尔氧化反应	(151)
二、有机过氧酸	(153)
三、四醋酸铅	(158)
四、N-卤代酰胺类	(160)
五、二甲基亚砷及有关化合物	(162)
第四节 催化氧化	(165)
一、液相催化氧化	(166)
二、气相催化氧化	(168)
第五节 生物氧化	(169)
一、生物氧化的概念和特点	(169)
二、生物氧化的关键	(170)
三、生物氧化在药物合成中的应用	(170)
习题	(171)
第七章 还原反应	(174)
第一节 概述	(174)
一、还原反应的概念	(174)
二、还原反应的类型	(175)
三、还原反应在药物合成中的应用	(175)
第二节 化学还原反应	(176)
一、活泼金属还原剂	(176)
(一) 金属铁还原剂	(176)
(二) 金属锌和锌-汞齐还原剂	(179)
(三) 碱金属还原剂	(184)
二、硫化物及含氧硫化物还原剂	(188)
(一) 硫化物还原剂	(188)
(二) 含氧硫化物还原剂	(191)
三、复氢化合物还原剂	(192)
(一) 氢化铝锂	(194)
(二) 硼氢化钠和硼氢化钾	(198)
四、硼烷	(201)
五、M-P-V 还原	(203)
六、乌尔夫-凯惜纳-黄鸣龙还原	(205)
第三节 催化氢化的概念与分类	(207)
一、催化氢化的概念	(207)
二、催化氢化的分类	(207)
第四节 多相催化氢化	(208)
一、反应机理	(208)
二、催化剂	(208)

(一) 氢化催化剂	(208)
(二) 载体	(209)
(三) 助催化剂	(210)
(四) 毒剂和抑制剂	(210)
(五) 常用氢化催化剂的使用条件、作用范围及制备方法	(211)
三、主要影响因素	(214)
(一) 作用物的结构	(214)
(二) 作用物的纯度	(216)
(三) 催化剂的种类和用量	(216)
(四) 溶剂和介质的酸碱度	(216)
(五) 温度	(217)
(六) 压力	(217)
(七) 接触时间	(218)
(八) 搅拌	(218)
四、安全技术	(218)
五、催化氢化在药物合成中的应用	(219)
(一) 炔烃的氢化	(219)
(二) 烯烃的氢化	(219)
(三) 醛和酮的氢化	(220)
(四) 硝基、亚硝基、亚氨基化合物的氢化	(221)
(五) 腈的氢化	(222)
(六) 氢化烃化反应与还原胺化	(222)
(七) 氢解	(223)
第四节 转移催化氢化和均相催化氢化	(226)
一、转移催化氢化	(226)
(一) 主要影响因素	(226)
(二) 应用	(227)
二、均相催化氢化	(229)
习题	(230)
第八章 消除反应	(235)
第一节 概述	(235)
一、消除反应的概念	(235)
二、消除反应在药物合成中的应用	(235)
第二节 β -消除反应	(237)
一、反应机理	(237)
二、双键的定位法则	(241)
三、主要影响因素	(243)
第三节 不同物质的消除反应	(245)
一、醇的消除反应	(245)

二、卤代烃的消除反应·····	(248)
三、二卤化物和卤乙烯的消除反应·····	(249)
四、酯的消除反应·····	(250)
五、季铵碱的消除反应·····	(253)
六、曼尼希碱的消除反应·····	(253)
习题·····	(257)

第九章 烃化反应····· (259)

第一节 概述····· (259)

- 一、烃化反应的概念和分类····· (259)
- 二、烃化反应在药物合成中的应用····· (259)

第二节 卤代烃类烃化剂····· (261)

- 一、氧原子上的烃化反应····· (262)
 - (一) 醇与卤代烃的反应····· (262)
 - (二) 酚与卤代烃的反应····· (264)
 - (三) 水与卤代烃的反应····· (265)
- 二、氮原子上的烃化反应····· (266)
 - (一) 氨与卤代烃的反应····· (266)
 - (二) 伯胺、仲胺与卤代烃的反应····· (270)
- 三、碳原子上的烃化反应····· (272)
 - (一) 芳环碳原子的烃化····· (272)
 - (二) 活性亚甲基碳原子的烃化····· (276)
 - (三) 卤代烃与氰化物的反应····· (279)
- 四、相转移烃化反应····· (280)
 - (一) 反应原理····· (280)
 - (二) 相转移催化反应在烃化中的应用····· (281)

第三节 硫酸酯和芳磺酸酯类烃化剂····· (283)

- 一、硫酸酯类烃化剂····· (284)
 - (一) 氧原子上的烃化反应····· (284)
 - (二) 氮原子上的烃化反应····· (285)
- 二、芳磺酸酯及其它酯类烃化剂····· (286)
- 三、醇羟基、酚羟基和氨基的保护····· (288)

第四节 环氧烷类烃化剂····· (290)

- 一、氧原子上的羟烃化反应····· (291)
- 二、氮原子上的羟烃化反应····· (292)
- 三、碳原子上的羟乙基化反应····· (293)

第五节 其它烃化剂····· (294)

- 一、甲醛—还原剂····· (294)
- 二、有机金属烃化剂····· (295)
 - (一) 有机镁试剂····· (295)

(二) 有机锂试剂·····	(298)
三、醇类烃化剂·····	(299)
四、丙烯腈烃化剂·····	(300)
五、重氮甲烷·····	(302)
习题·····	(302)
第十章 酰化反应 ·····	(306)
第一节 概述 ·····	(306)
一、酰化反应的概念·····	(306)
二、酰化反应的类型·····	(306)
三、常用酰化剂简介·····	(306)
四、酰化反应在药物合成中的应用·····	(308)
第二节 羧酸酰化剂 ·····	(310)
一、氧原子上的酰化反应·····	(310)
(一) 反应机理·····	(310)
(二) 主要影响因素·····	(310)
二、氮原子上的酰化反应·····	(315)
(一) 反应机理·····	(315)
(二) 主要影响因素·····	(315)
三、碳原子上的酰化反应·····	(317)
四、选择性酰化反应·····	(318)
第三节 羧酸酯酰化剂 ·····	(319)
一、氧原子上的酰化反应·····	(319)
(一) 反应机理·····	(319)
(二) 主要影响因素·····	(319)
(三) 应用·····	(320)
二、氮原子上的酰化反应·····	(321)
(一) 反应机理·····	(321)
(二) 主要影响因素·····	(322)
三、选择性酰化反应·····	(323)
第四节 酸酐酰化剂 ·····	(324)
一、氧原子上的酰化反应·····	(325)
(一) 主要影响因素·····	(325)
(二) 应用·····	(328)
二、氮原子上的酰化反应·····	(329)
三、碳原子上的酰化反应·····	(330)
(一) 反应机理·····	(330)
(二) 主要影响因素·····	(331)
四、选择性酰化反应·····	(334)
第五节 酰氯酰化剂 ·····	(335)

一、氧原子上的酰化反应	(336)
(一) 醇的酰化反应	(337)
(二) 酚的酰化反应	(338)
二、氮原子上的酰化反应	(338)
三、碳原子上的酰化反应	(339)
(一) 芳环上的酰化反应	(339)
(二) 活性亚甲基上的酰化反应	(342)
第六节 其它酰化剂	(343)
一、乙烯酮	(343)
二、双乙烯酮	(345)
三、尿素	(346)
四、维尔斯迈尔反应	(346)
习题	(348)
第十一章 缩合反应	(351)
第一节 概述	(351)
一、缩合反应的概念	(351)
二、缩合反应的催化剂	(351)
三、缩合反应在药物合成中的应用	(351)
第二节 醛、酮化合物之间的缩合	(352)
一、自身缩合	(352)
(一) 含 α -活泼氢的醛或酮的自身缩合	(352)
(二) 芳醛的自身缩合	(355)
二、交错缩合	(356)
(一) 含 α -活泼氢的醛、酮交错缩合	(356)
(二) 甲醛与含 α -活泼氢的醛、酮缩合	(357)
(三) 芳醛与含 α -活泼氢的醛、酮缩合	(358)
第三节 醛、酮与羧酸或其衍生物之间的缩合	(360)
一、克脑文格缩合	(360)
(一) 反应机理	(360)
(二) 主要影响因素	(361)
(三) 应用	(362)
二、柏琴反应	(363)
(一) 反应机理	(363)
(二) 主要影响因素	(364)
(三) 应用	(365)
三、达参反应	(366)
(一) 反应机理	(366)
(二) 主要影响因素	(366)
(三) 应用	(367)

四、雷福尔马茨基反应	(368)
(一) 反应机理	(368)
(二) 主要影响因素	(369)
(三) 主要副反应	(370)
(四) 应用	(370)
第四节 酯缩合反应	(371)
一、酯-酯缩合	(371)
(一) 同酯缩合	(371)
(二) 异酯缩合	(373)
(三) 分子内的酯缩合	(374)
二、酯-酮缩合	(375)
三、酯-腈缩合	(376)
第五节 其它类型的缩合反应	(376)
一、曼尼希反应	(376)
(一) 反应机理	(376)
(二) 主要影响因素	(377)
(三) 应用	(379)
二、维蒂希反应	(381)
(一) 维蒂希试剂的制备	(381)
(二) 主要影响因素	(381)
(三) 维蒂希反应的特点	(383)
(四) 应用	(383)
三、迈克尔加成	(384)
(一) 反应机理	(384)
(二) 主要影响因素	(384)
(三) 应用	(385)
四、含活泼氢的非醛、酮类化合物与醛、酮的缩合	(386)
习题	(388)
第十二章 环合反应	(390)
第一节 概述	(390)
一、环合反应的概念	(390)
二、环合反应的特点	(390)
三、结构剖析与环合方式	(390)
(一) 五员杂环及其苯并衍生物	(391)
(二) 六员杂环及其苯并衍生物	(391)
四、环合反应的类型与机理	(393)
(一) 常见的反应类型	(393)
(二) 两种组合形式	(394)
五、环合反应在药物合成中的应用	(396)

第二节 吡唑及咪唑衍生物的合成及应用	(397)
一、吡唑啉酮类	(397)
二、吡唑烷酮类	(398)
三、咪唑、苯并咪唑及其衍生物	(399)
(一) 咪唑及其衍生物	(399)
(二) 苯并咪唑及其衍生物	(401)
第三节 吲哚衍生物的合成及应用	(402)
一、以苯胺为原料	(402)
二、以芳胺和 α - 卤代羰基化合物为原料	(404)
三、以邻硝基苯衍生物和草酸二乙酯为原料	(405)
第四节 吡啶衍生物的合成及应用	(406)
一、以醛、 β - 二羰基化合物和胺为原料	(406)
二、以 β - 二羰基化合物和 β - 烯胺基羰基化合物为原料	(407)
三、以 β - 二羰基化合物和氰乙酰胺为原料	(408)
四、以噁唑环为原料	(409)
第五节 喹啉衍生物的合成及应用	(411)
一、以芳胺和 1, 3- 二羰基化合物为原料	(411)
二、以芳胺和 α , β - 不饱和羰基化合物为原料	(412)
第六节 嘧啶衍生物的合成及应用	(414)
一、以 1, 3- 二羰基化合物或羧酸及其衍生物为原料	(416)
二、以丙二脒或丙二酰胺为原料	(421)
习题	(421)
第十三章 重排反应	(423)
第一节 概述	(423)
一、重排反应的概念和分类	(423)
二、重排反应在药物合成中的应用	(423)
第二节 亲核重排反应	(424)
一、脞- 酰胺重排	(424)
(一) 反应机理	(424)
(二) 主要影响因素	(425)
二、酰胺- 胺重排	(426)
(一) 反应机理	(427)
(二) 主要影响因素	(427)
(三) 应用	(428)
三、苯偶酰- 二苯乙醇酸型重排	(429)
(一) 反应机理	(429)
(二) 主要影响因素	(429)
(三) 应用	(430)
四、片呐醇- 片呐酮重排	(431)

(一) 反应机理·····	(432)
(二) 主要影响因素·····	(432)
(三) 应用·····	(434)
第三节 亲电重排·····	(434)
一、史蒂文斯重排·····	(435)
二、萨默莱特-豪斯重排·····	(436)
(一) 反应机理·····	(436)
(二) 主要影响因素·····	(437)
(三) 应用·····	(438)
习题·····	(439)
实 验 ·····	(441)
实验一 1-溴丁烷的制备·····	(441)
实验二 邻硝基乙酰苯胺的制备·····	(444)
实验三 对硝基苯甲酸的制备·····	(447)
实验四 环己酮的制备·····	(449)
实验五 对甲苯胺的制备·····	(452)
实验六 兰尼镍的制备·····	(454)
实验七 氢化肉桂酸的制备·····	(455)
实验八 安替比林的制备·····	(457)
实验九 草酸二乙酯的制备·····	(459)
实验十 呋喃丙烯酸酸的制备·····	(463)
实验十一 苄基甲基醚的制备·····	(465)
实验十二 甲基硫氧嘧啶的合成·····	(467)
附 录 ·····	(470)
常用符号、缩语和略语表·····	(470)
人名反应对照·····	(471)
主要参考书目 ·····	(473)

第一章 绪 论

药物是人类生息繁衍的必备物质，在防病治病、康复保健、计划生育和战备救灾等方面发挥着极其重要的作用。凡具有预防、治疗、缓解、诊断疾病以及调节机体功能的化学物质均称为化学药物。化学药物是临床用药的主力军。按照来源，化学药物可以分为无机药物、天然药物和有机合成药物三大类。无机药物主要是由矿物加工得到；天然药物是从动植物体中提取的有效成分或微生物发酵产生的化学物质；有机合成药物是采用化学合成手段，按全合成方法（由结构比较简单的化工原料经一系列化学合成过程制得药物的方法）或半合成方法（由已具有一定基本结构的天然产物经过化学结构改造或微生物转变反应而制得药物的方法）研制和生产的有机药物。有机合成药物是化学药物的主体。

一、药物合成反应学科的研究对象、内容、任务和作用

药物合成反应是以有机合成药物作为研究对象。它是在有机化学的基础上，以现代科学手段，深入细致地研究药物合成的基本反应和方法。讨论药物合成反应的机理，反应物结构、反应条件与反应方向、反应产物之间的关系，反应的主要影响因素，试剂特点，应用范围与限制等。探讨药物合成反应的一般规律和特殊性质以及各基本反应之间的关系。

药物合成反应的基本理论和方法是药物化学家、制药工艺师和工程师进行科学研究和生产工艺活动必备的基本功，是学习药物化学和化学制药工艺学的基本理论知识。它可以帮助人们以科学方法，采用良好的药物合成反应，设计药物的合成路线；根据生产实际和科学试验，筛选决策药物的工艺路线（具有生产价值的合成路线），并将各反应条件控制在最佳状态。从而实现有机合成药物生产过程的最优化。

良好的药物合成反应必须具备以下特点：

（一）反应条件温和，操作简便，收率高

反应条件温和是指在常温、常压、中性介质中就可以完成反应。这样，即节省能源，又能简化设备和操作程序。收率高才具有经济效益和竞争能力。

（二）具有较高的化学、位置和立体选择性

化学选择性是一种区别基团的反应选择性。一般情况下，不同基团对同一试剂所表现的活性相差很大，反应易于控制。但分子中不同位置的相同基团，对同一试剂的化学选择性则较低。通常，只有两个基团的反应速度相差十倍以上时，才能使试剂与一个基团作用，另一个基团影响很小。否则，就需要将不需要反应的基团封闭起来，待反应完成后，再去掉保护基，释放出原来的基团。

位置选择性是指反应中试剂定向进攻作用物的某一位置，从而产生指定结构的产物。

立体选择性是指在给定条件下，产物为唯一的立体异构体或某种占优势的立体异构体。

选择性高，就不必在基团保护、活化等方面消耗精力，从而大大提高反应的效益。