# 药物合成反应（732011）实验教学大纲”

**01．教学单位名称：**药学院药物化学教研室

**02．实验中心名称：**吉林大学药学院药学实验中心

**03．课程名称：**药物合成反应

**04．课程代码：**732011

**05．课程类别：**专业课

**06．课程性质：**必修

**07．课程学时：**64学时，其中含实验32学时

**08．课程学分：**3

**09．面向专业：**药学专业（化学药物方向）

**10．实验课程的教学任务、要求和教学目的**

药物合成反应实验是药物化学专业方向的一门必修的专业基础课，是与药物合成反应理论课同时开设的。其主要目的在于培养学生进行合成药物的基本技能，综合训练学生理解和掌握各种典型的单元反应的基本操作技能；培养独立进行研究和实际应用能力，为开展合成药物研究奠定基础。

**11．学生应掌握的实验技术及实验能力**

掌握药物合成实验中常见的反应装置，达到熟练安装、正确使用。

**12．开设实验项目**

实验1：对-氯苯甲酸的制备，以对氯甲苯为原料，经氧化反应制备对氯苯甲酸，了解并掌握氧化反应的类型及特点。

实验2：2，4-二氯乙酰苯胺的制备，以乙酰苯胺为原料，经氯化反应制备2，4－二氯乙酰苯胺，了解并掌握卤化剂的分类及卤化反应的特点和反应条件。

实验3：对-硝基乙酰苯胺的制备，以乙酰苯胺为原料，经硝化反应制备对硝基乙酰苯胺，了解不同硝化试剂的用途和其硝化产物异构体比例及其分离方法。

实验4：对-硝基苯甲酰-β-丙氨酸的制备，以对硝基苯甲酰氯和β-丙氨酸为原料，经酰化反应制备对-硝基苯甲酰-β-丙氨酸，了解酰化反应原理及酰化剂的种类和相转移反应的原理及相转移催化剂的种类。

**开设实验项目一览表**

|  |  |  |  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- | --- | --- | --- |
| **实验项目编号** | **实验项目名称** | **实验类型** | **实验性质** | **实验学时** | **每组人数** | **首次开出年月** |
| 73201101 | 对-氯苯甲酸的制备 | 验证性 | 必做 | 8 | 2 | 200809 |
| 73201102 | 2，4-二氯乙酰苯胺的制备 | 验证性 | 必做 | 8 | 2 | 200809 |
| 73201103 | 对-硝基乙酰苯胺的制备 | 验证性 | 必做 | 8 | 2 | 200809 |
| 73201104 | 对-硝基苯甲酰-β-丙氨酸的制备 | 综合性 | 必做 | 8 | 2 | 200809 |

**13．实验教材或指导书或主要参考资料**

**实验教材**

（1）杨晓虹，药物合成反应实验指导，自编，2008年

**主要参考资料**

（1）姚其正，王亚楼，药物合成基本技能与实验，北京：化学工业出版社. 2008。

（2）郭春，药物合成反应实验，北京：中国医药科技出版社.2004。

（3）闻韧，药物合成反应（第三版），北京：化学工业出版社. 2010。

**14．考核要求、考核方式及成绩评定标准**

学生的实验态度、实验操作、实验结果和实验报告四项为实验成绩评分的考核标准，考核成绩占《药物合成反应》总成绩的30％。

实验课成绩共30分，学时为32学时，平均每学时0.9375分。即8学时实验的考核分数为7.5分。

实验态度：认真参加实验教学，遵守课堂纪律，不迟到不早退。遵守实验室规章制度。实验态度占该实验课成绩的比例为10%。

实验操作：认真做好课前预习。严格遵守仪器操作规程，如实记录实验数据，认真观察和分析实验现象。实验结束后将实验用品、仪器设备等整理复位。实验操作占该实验课成绩的比例为50%。

实验结果：独立分析实验结果，严禁抄袭和伪造实验数据。实验结果占实验课成绩的比例为10%。

实验报告：认真撰写实验报告，并按规定的时间和要求提交。实验报告中图表清晰、字迹工整、原始数据齐全、数据处理准确、讨论和分析问题简明扼要、表达清楚。实验报告占该实验课成绩的比例为30%。

缺交实验报告达五分之一，或缺做实验时数达五分之一，为实验成绩不及格。

**15．执笔人**

周小平副教授，参与编写人员有杨晓虹教授、刘银燕副教授、孙薇讲师和梁迪讲师。

**16．制定日期**

20131023

**17．审核人**

杨晓虹教授

**18．审核日期**

20131126

**19．学院审定程序说明**

大纲制定完毕后首先由学院教学指导委员对实验内容进行审定，然后由负责该实验的实验中心对耗材及价格进行审定。

**20．学院审定日期**

20131120

**药物合成反应(732011)实验项目卡1**

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| No | 字段名 | **填写内容** |
| 1 | 课程名称 | 药物合成反应 |
| 2 | 课程编号 | 732011 |
| 3 | 实验项目名称 | 对-氯苯甲酸的制备 |
| 4 | 实验项目编号 | 73201101 |
| 5 | 网络实验 | 0 |
| 6 | 每组人数 | 1 |
| 7 | 计划学时数 | 8 |
| 8 | 实验性质 | 必做 |
| 9 | 实验目的 | 掌握氧化反应的类型及特点。 |
| 10 | 实验内容 | 将对氯甲苯与水搅拌均匀，75℃滴加KMnO4及水的混合液。温度不超过90℃，搅拌回流4小时，盐酸酸化至pH=2。过滤得粗品，乙醇重结晶。产品测定熔点。 |
| 11 | 实验原理 | 以KMnO4为原氧化剂，将对氯甲苯氧化为对氯苯甲酸 |
| 12 | 实验类型 | 1.演示性□；2.验证性；3.综合性□；4.设计性□；5.研究性□。 |
| 13 | 实验者层次 | 本科生 |
| 14 | 实验仪器设备 | 电动搅拌器，显微熔点测定仪，远红外干燥箱，电子天平，恒温水浴锅，气流烘干器，低温循环泵，循环水真空泵，通风橱，气流烘干器 |
| 15 | 实验套数 | 20 |
| 16 | 开出时间 | 200809 |
| 17 | 教学单位名称 | 药学院 |
| 18 | 教学单位编号 | 73 |
| 19 | 实验单位名称 | 药学院药学实验中心 |
| 20 | 实验中心编号 | 133101 |
| 21 | 实验地名称 | 药物化学室 |
| 22 | 实验地编号 | 药学院308室 |
| 23 | 一次性材料品名 | 对氯甲苯（12.6g），高锰酸钾(17g)，浓盐酸(40mL)，95%乙醇(150mL)，脱脂棉，滤纸 |
| 24 | 一次性材料 | 25.0元 |
| 25 | 面向专业 | 药学专业（化学药物方向） |
| 26 | 实验项目卡制定人 | 周小平副教授 |
| 27 | 实验项目卡审核人 | 杨晓虹教授 |

**药物合成反应(732011)实验项目卡2**

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| No | 字段名 | **填写内容** |
| 1 | 课程名称 | 药物合成反应 |
| 2 | 课程编号 | 732011 |
| 3 | 实验项目名称 | 2，4-二氯乙酰苯胺的制备 |
| 4 | 实验项目编号 | 73201102 |
| 5 | 网络实验 | 0 |
| 6 | 每组人数 | 1 |
| 7 | 计划学时数 | 8 |
| 8 | 实验性质 | 必做 |
| 9 | 实验目的 | 了解并掌握卤化剂的分类及卤化反应的特点和反应条件。 |
| 10 | 实验内容 | 将乙酰苯胺、冰乙酸加入的三颈瓶中，搅拌，加浓盐酸，冰水冷却下，滴加氯酸钠溶液，滴加完毕，室温搅拌1小时，抽滤得粗品。以80%甲醇重结晶。产品测定熔点。 |
| 11 | 实验原理 | 酰化反应 |
| 12 | 实验类型 | 1.演示性□；2.验证性；3.综合性□；4.设计性□；5.研究性□。 |
| 13 | 实验者层次 | 本科生 |
| 14 | 实验仪器设备 | 电动搅拌器，显微熔点测定仪，远红外干燥箱，电子天平，恒温水浴锅，气流烘干器，低温循环泵，循环水真空泵，通风橱，气流烘干器 |
| 15 | 实验套数 | 20 |
| 16 | 开出时间 | 200809 |
| 17 | 教学单位名称 | 药学院 |
| 18 | 教学单位编号 | 73 |
| 19 | 实验单位名称 | 药学院药学实验中心 |
| 20 | 实验中心编号 | 133101 |
| 21 | 实验地名称 | 药物化学室 |
| 22 | 实验地编号 | 药学院308室 |
| 23 | 一次性材料品名 | 乙酰苯胺(10g)，浓盐酸(35mL)，冰醋酸(20mL)，甲醇(200mL)，活性炭(10g)，氯酸钠(5.5g)，pH试纸1本，胶布，胶手套，滤纸 |
| 24 | 一次性材料 | 29.0元 |
| 25 | 面向专业 | 药学专业（化学药物方向） |
| 26 | 实验项目卡制定人 | 周小平副教授 |
| 27 | 实验项目卡审核人 | 杨晓虹教授 |

**药物合成反应(732011)实验项目卡3**

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| No | 字段名 | **填写内容** |
| 1 | 课程名称 | 药物合成反应 |
| 2 | 课程编号 | 732011 |
| 3 | 实验项目名称 | 对-硝基乙酰苯胺的制备 |
| 4 | 实验项目编号 | 73201103 |
| 5 | 网络实验 | 0 |
| 6 | 每组人数 | 1 |
| 7 | 计划学时数 | 8 |
| 8 | 实验性质 | 必做 |
| 9 | 实验目的 | 了解不同硝化试剂的用途和其硝化产物异构体比例及其分离方法。 |
| 10 | 实验内容 | 将冰醋酸、乙酰苯胺和27mL浓硫酸加入三颈瓶中，水冷却下滴加混酸，加完后，室温下搅拌反应，然后将反应液倒入碎冰水，得乙酰苯胺的硝化产物析出，抽滤得粗品，乙醇重结晶。产品测定熔点。 |
| 11 | 实验原理 | 硝化反应 |
| 12 | 实验类型 | 1.演示性□；2.验证性；3.综合性□；4.设计性□；5.研究性□。 |
| 13 | 实验者层次 | 本科生 |
| 14 | 实验仪器设备 | 电动搅拌器，显微熔点测定仪，远红外干燥箱，电子天平（0.01g），恒温水浴锅，气流烘干器，低温循环泵，循环水真空泵，通风橱，气流烘干器 |
| 15 | 实验套数 | 20 |
| 16 | 开出时间 | 200809 |
| 17 | 教学单位名称 | 药学院 |
| 18 | 教学单位编号 | 73 |
| 19 | 实验单位名称 | 药学院药学实验中心 |
| 20 | 实验中心编号 | 133101 |
| 21 | 实验地名称 | 药物化学室 |
| 22 | 实验地编号 | 药学院308室 |
| 23 | 一次性材料品名 | 乙酰苯胺(13.5g)，冰醋酸(13ml)，浓硫酸(27mL)，95%乙醇，浓硝酸(6.9mL)，滤纸，pH试纸1本，脱脂棉，线手套 |
| 24 | 一次性材料 | 31.0元 |
| 25 | 面向专业 | 药学专业（化学药物方向） |
| 26 | 实验项目卡制定人 | 周小平副教授 |
| 27 | 实验项目卡审核人 | 杨晓虹教授 |

**药物合成反应(732011)实验项目卡4**

|  |  |  |
| --- | --- | --- |
| No | 字段名 | **填写内容** |
| 1 | 课程名称 | 药物合成反应 |
| 2 | 课程编号 | 732011 |
| 3 | 实验项目名称 | 对-硝基苯甲酰-β-丙氨酸的制备 |
| 4 | 实验项目编号 | 73201104 |
| 5 | 网络实验 | 0 |
| 6 | 每组人数 | 1 |
| 7 | 计划学时数 | 8 |
| 8 | 实验性质 | 必做 |
| 9 | 实验目的 | 1.了解酰化反应反应原理及酰化剂的种类。  2.了解相转移反应的原理及相转移催化剂的种类。 |
| 10 | 实验内容 | 在三颈瓶中加入β-丙氨酸、碳酸钠、水和三乙基苯甲基氯化铵，滴加对硝基苯甲酰氯，反应3小时，水层用盐酸酸化的固体，抽滤，水洗得黄色固体粉末，丙酮重结晶。产品测定熔点。 |
| 11 | 实验原理 | 相转移催化的酰化反应 |
| 12 | 实验类型 | 1.演示性□；2.验证性□；3.综合性；4.设计性□；5.研究性□。 |
| 13 | 实验者层次 | 本科生 |
| 14 | 实验仪器设备 | 电动搅拌器，显微熔点测定仪，远红外干燥箱，电子天平（0.01g），恒温水浴锅，气流烘干器，低温循环泵，循环水真空泵，通风橱，气流烘干器 |
| 15 | 实验套数 | 20 |
| 16 | 开出时间 | 200809 |
| 17 | 教学单位名称 | 药学院 |
| 18 | 教学单位编号 | 73 |
| 19 | 实验单位名称 | 药学院药学实验中心 |
| 20 | 实验中心编号 | 133101 |
| 21 | 实验地名称 | 药物化学室 |
| 22 | 实验地编号 | 药学院308室 |
| 23 | 一次性材料品名 | 对硝基苯甲酰氯(15g)，β-丙氨酸(7g)，三乙基苯甲基氯化铵(0.4g)，活性炭(10g)，碳酸钠(11g)，二氯甲烷(40mL)，盐酸(30mL)，滤纸，pH试纸1本 |
| 24 | 一次性材料 | 55.0元 |
| 25 | 面向专业 | 药学专业（化学药物方向） |
| 26 | 实验项目卡制定人 | 周小平副教授 |
| 27 | 实验项目卡审核人 | 杨晓虹教授 |