

研究论文

(S)-和(R)-盐酸氟西汀的不对称合成

程青芳^{1,2}, 许兴友^{*1,2}, 刘玮炜¹, 杨绪杰², 姚泳³

(¹淮海工学院化工系 连云港 222005)

(²南京理工大学材料化学实验室 南京 210094)

(³江苏正大天晴药业股份有限公司 连云港 222006)

收稿日期 2005-3-24 修回日期 2005-7-18 网络版发布日期 接受日期

摘要 盐酸氟西汀是一种临床广泛使用的非三环类抗抑郁药, 本工作介绍了一种不对称合成(S)-和(R)-盐酸氟西汀的方法. 以自制的手性噁唑硼烷为催化剂, 将起始原料 β -氯苯丙酮不对称催化氢化还原成(S)-或(R)-手性醇, 这一步的化学收率和光学收率都较高. 然后再经两步, (S)-和(R)-手性醇转化为(S)-和(R)-盐酸氟西汀. 整个工艺只需三步, 总收率为66.5%, 盐酸氟西汀对映体的 ee 值可达98.6%. 还考察了反应温度、溶剂、催化剂的量等因素对 β -氯苯丙酮的不对称氢化还原的化学产率和光学收率的影响.

关键词 [盐酸氟西汀](#) [制剂](#) [手性噁唑硼烷](#) [不对称还原](#)

分类号

Enantioselective Synthesis of S- and R-Fluoxetine Hydrochloride

CHENG Qing-Fang^{1,2}, XU Xing-You^{*1,2}, LIU Wei-Wei¹

YANG Xu-Jie², YAO Yong³

(¹ Department of Chemical Technology, Huaihai Institute of Technology, Lianyungang 222005)

(² Materials Chemistry Laboratory, Nanjing University of Science and Technology, Nanjing 210094)

(³ Jiangsu Zhengda Tianqing Pharmaceutical Co., Ltd., Lianyungang 222006)

Abstract The enantioselective synthesis of fluoxetine hydrochloride, a potent serotonin-uptake inhibitor, was described. The asymmetric reduction of 3-chloropropiophenone catalyzed by chiral oxazaborolidines enantioselectively gave S- or R-3-chloro-1-phenylpropanol (**2**) in good yield. In following two steps, alcohol **2** was converted into S- or R-fluoxetine hydrochloride in 66.5% overall yield and 98.6% ee . Some factor effecting the yield and the enantioselectivity of asymmetric reduction of 3-chloropropiophenone was investigated.

Key words [fluoxetine hydrochloride](#) [inhibitor](#) [chiral oxazaborolidine](#) [asymmetric reduction](#)

DOI:

通讯作者 xuxy@hhit.edu.cn

扩展功能

本文信息

▶ [Supporting info](#)

▶ [PDF\(0KB\)](#)

▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)

▶ [参考文献](#)

服务与反馈

▶ [把本文推荐给朋友](#)

▶ [加入我的书架](#)

▶ [加入引用管理器](#)

▶ [复制索引](#)

▶ [Email Alert](#)

▶ [文章反馈](#)

▶ [浏览反馈信息](#)

相关信息

▶ [本刊中 包含“盐酸氟西汀”的
相关文章](#)

▶ 本文作者相关文章

· [程青芳](#)

·

· [许兴友](#)

·

· [刘玮炜](#)

· [杨绪杰](#)

· [姚泳](#)