

Full Paper

NMDA受体2A选择性抑制剂NVP-AAM077的高效合成

李纲琴^{1,2}, 苏为科², 姚祝军^{1*}

¹中国科学院上海有机化学研究所生命有机化学国家重点实验室, 上海市 200032

²浙江工业大学药学院, 浙江 杭州市310014

收稿日期 2006-5-9 修回日期 2006-8-7 网络版发布日期 2006-12-22 接受日期

摘要 本文报道一条以2,3-二氨基甲苯为原料, 经过8步反应合成NMDA受体2A选择性抑制剂NVP-AAM077的高效率路线, 其总收率为

54%。合成中使用的关键反应包括NaIO₄/DMF介导的氧化芳苄溴到芳醛的反应以及亚磷酸酯对亚胺的加成反应等。

关键词 [NMDA受体2A](#), [抑制剂](#), [NVP-AAM077](#), [合成](#), [氨基膦酸](#)

分类号

An Efficient Synthesis of Selective Human NR2A Antagonist NVP-AAM077

LI Gang-Qin^{1,2}, SU Wei-Ke², YAO Zhu-Jun^{*,1}

¹ State Key Laboratory of Bioorganic and Natural Products Chemistry, Shanghai Institute of Organic Chemistry, Chinese Academy of Sciences, Shanghai 200032, China

² College of Pharmaceutical Sciences, Zhejiang University of Technology, Hangzhou, Zhejiang 310014, China

Abstract A short and efficient synthesis of the selective human *N*-methyl-D-aspartate (NMDA) receptor 2A (NR2A) antagonist NVP-AAM077 is described. The target was achieved in 8 steps and in 54% overall yield from the commercially available chemical 3-methylbenzene-1,2-diamine. A NaIO₄/DMF-based oxidation of the bromide to corresponding aldehyde and an addition of phosphinic acid ester to the aldimine successfully served as the key steps.

Key words [NMDA receptor 2A](#), [antagonist](#), [NVP-AAM077](#), [synthesis](#), [amino phosphonic acid](#)

DOI:

通讯作者 姚祝军 yaoz@mail.sioc.ac.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“NMDA受体2A, 抑制剂, NVP-AAM077, 合成, 氨基膦酸”的相关文章](#)

▶ 本文作者相关文章

· [李纲琴](#)

·

· [苏为科](#)

·

· [姚祝军](#)