

论文

消炎镇痛药萘普生不对称合成

胡艾希;范国枝;赵海涛

湖南大学化学化工学院, 长沙 410082

摘要:

目的: 不对称合成非麻醉性消炎镇痛药萘普生 [(S)-(+)-2-(6'-甲氧基-2'-萘基)丙酸]。方法: 以(2R, 3R)-酒石酸二甲酯为手性辅助剂, 6-甲氧基-2-丙酰基萘经缩酮化、不对称溴化、水解、重排和催化氢转移氢解等反应合成了光学活性萘普生。结果: 化学总收率54%。制备的萘普生的光学纯度([α]_D²⁵ +63.5°)符合中华人民共和国药典(1995年版)的要求。结论: 不对称合成萘普生的化学收率和光学收率较高。

关键词: 萘普生 (2R, 3R)-酒石酸二甲酯 不对称溴化 重排 不对称合成

ASYMMETRIC SYNTHESIS OF NAPROXEN, AN ANTI INFLAMMATERY ANALGESIC

Hu Aixi; Fan Guozhi and Zhao Haitao

Abstract:

AIM: To synthesize naproxen by asymmetric method. METHODS: Naproxen was synthesized by acetalization, asymmetric bromination, hydrolysis, rearrangement and catalytic transfer hydrogenolysis from 6-methoxy-2-propionyl naphthalene, using (2R,3R)-dimethyltartrate as chiral auxiliary, Br₂ as brominating agent, KH₂PO₄ as rearrangement agent, 10% Pd-C/HCO₂NH₄ as catalytic transfer hydrogenolytic agent. RESULTS: Total yield was 54%, e.e. value of product was 94%. CONCLUSION: The higher chemical yield and optical yield were obtained.

Keywords: (2R,3R)-dimethyltartrate asymmetric bromination rearrangement asymmetric synthesis naproxen

收稿日期 1998-08-10 修回日期 网络版发布日期

DOI:

基金项目:

通讯作者:

作者简介:

参考文献:

本刊中的类似文章

1. 田青平;李鹏;仇丽霞;谢茵;谢克昌.遗传算法在经皮给药微乳载体处方优化中的应用[J]. 药学报, 2008,43(12): 1228-1232
2. 郭圣荣;方晓玲;黄惠琼;胡翔.新型丙烯酸树脂肠溶包衣材料的合成与应用[J]. 药学报, 1998,33(11): 860-863
3. 黄粤;刘昌胜;邵慧芳;肖艳平.萘普生钠/磷酸钙骨水泥药物缓释体系的研究[J]. 药学报, 2000,35(1): 44-47
4. 胡艾希;董先明;曹声春;程雅平;陈龙.一锅重排法合成萘普生[J]. 药学报, 2000,35(11): 818-820
5. 施庆和;王集金;刘旭东;张建华.光度法测定咖啡因、烟酰胺、水杨酸等配体与萘普生在水溶液中的形成常数[J]. 药学报, 1989,24(4): 280-284

扩展功能

本文信息

- ▶ Supporting info
- ▶ PDF(149KB)
- ▶ [HTML全文]
- ▶ 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
- ▶ 引用本文
- ▶ Email Alert
- ▶ 文章反馈
- ▶ 浏览反馈信息

本文关键词相关文章

- ▶ 萘普生
- ▶ (2R, 3R)-酒石酸二甲酯
- ▶ 不对称溴化
- ▶ 重排
- ▶ 不对称合成

本文作者相关文章

- ▶ 胡艾希
- ▶ 范国枝
- ▶ 赵海涛

PubMed

- ▶ Article by
- ▶ Article by
- ▶ Article by

文章评论 (请注意:本站实行文责自负, 请不要发表与学术无关的内容!评论内容不代表本站观点.)

| | | | |
|------|----------------------|------|---------------------------|
| 反馈人 | <input type="text"/> | 邮箱地址 | <input type="text"/> |
| 反馈标题 | <input type="text"/> | 验证码 | <input type="text"/> 9732 |

Copyright 2008 by 药学报