

本文报告了睾丸素庚酸酯的合成,并得到了结晶性样品。经紫外吸收光谱,红外吸收光谱、旋光和含量测定,证明了本品为睾丸素庚酸酯,且含量为98~103%。

本品与雌激素或孕激素合并,经动物实验证明具有长效抗生育作用。

抗肿瘤药—盐酸9-去甲黄连素乙酸酯的合成

药理学系药物化学教研室 李光华 胡永洲

黄连素是著名的抗菌消炎药,一般认为并无明显的抗肿瘤作用。但当9位甲基脱去后,生成的9-去甲黄连素就具有抗肿瘤的活性,酯化后抗肿瘤的活性更强。

本文除文献的二步法合成9-去甲黄连素乙酸酯盐酸盐的同时,发现可用吡啶-醋酐法一步合成上述化合物。经混合熔点 and 薄层层析证明为同一化合物。一步法的收率可达61~72%。

本品经W₂₅₆肉瘤筛选结果有明显的抗肿瘤活性。

〔浙江医科大学学报 11(2):55, 1982〕

青光 安 的 合 成

药理学系药物化学教研室 李光华

青光安又名吡喃铵,化学名碘化三甲基糠胺(Trimethylfurfurylammonium Iodide)。本品为胆碱能神经药,主要作为毛果芸香碱的代用品,用于治疗青光眼,疗效肯定。它对于急性发作的患者,可及时控制眼压,防止失明。本品也可口服用以治疗手术后膀胱及肠的松弛无力症。

本文采用以糠醛为原料,经Leuckart反应、再经甲基化反应即得。发现在行Leuckart反应时用氯化镁作催化剂时,二甲基糠胺的收率可由文献的60%提高到75~78%。在甲基化反应时,用无水乙醇作溶媒,反应迅速而平稳。将所得的粗品用无水乙醇和乙酸乙酯混合溶剂重结晶后,成品色泽和纯度均较好,收率91%。

〔医药工业 (10):9, 1981〕