

(IV) 5 g 加乙醇 23 ml, 水 23 ml, 搅拌溶解。分别加入硫脲 1.3 g, 醋酸钠 2.3 g。室温搅拌 6 h, 倾入水中析出固体, 过滤, 水洗, 干燥得粗品。再用乙酸乙酯, 乙醚处理得淡黄色粉末(V): mp 188~189 °C (dec); IR(KBr)v 3405, 1725, 1610, 1520, 1340 cm⁻¹; ¹HNMR (DMSO-d₆)δ 5.45 (s, 2H, CO₂CH₂C₆H₄), 6.85 (s, 1H, thiazole-5H), 7.12 (s, 2H, NH₂), 7.70 (d, 2H, J=9 aromatic), 8.25 (d, 2H, J=9 aromatic)。

四、2-(2-氨基-4-噻唑)-(Z)-2-(叔丁氧羰甲氧亚胺)乙酸对硝基苯酯(VI)

(V) 1.5 g(4.7 mmol)混悬于乙腈 30 ml 中, 加入溴乙酸叔丁酯 1.0 g(5.1 mmol)、水 0.15 ml 及无水碳酸钾 2.6 g, 在 40~41 °C 搅拌 2 h, 冷后倒入水中, 用乙酸乙酯抽提, 酯层用食盐水洗涤, 干燥, 减压蒸干。残渣以乙醚洗涤, 乙酸乙酯重结晶得黄色结晶(VI), 收率 69%(文献收率 66.5%); mp 191~192 °C (dec); Anal C₁₈H₂₀N₄O₇S, C 49.97, H 4.70, N 13.03(Req C 49.54, H 4.62, N 12.84); IR(KBr)v 3470, 1735, 1610, 1520, 1365 cm⁻¹; ¹HNMR (DMSO-d₆)δ 1.41 (s, 9H, CH₃ × 3), 4.65 (s, 2H, NOCH₂CO₂), 5.52 (s, 2H, CO₂CH₂C₆H₄), 6.97 (s, 1H, thiazole-5H), 7.25 (br, 2H, NH₂), 7.73 (d, 2H, J=8.5 aromatic), 8.27 (d, 2H, J=8.5 aromatic)。

五、2-(2-氨基-4-噻唑)-(Z)-2-(叔丁氧羰甲氧亚胺)乙酸(I)

(VI) 0.6 g(1.4 mmol), THF 36 ml, 10%Pd/C 0.6 g, 常压通氢 6 h, 过滤, 加水 9 ml, 用 5%NaHCO₃ 溶液调到 pH 8, 用乙酸乙酯洗涤, 水层用 10% 盐酸调到 pH 2~3, 冷至 5 °C 以下, 析出固体, 过滤, 洗涤, 干燥。粗品以丙酮溶解, 过滤, 蒸去部分溶剂得白色结晶(I): mp 171~172 °C (dec); Anal C₁₁H₁₅N₃O₅S, C 43.36, H 5.17, N 13.78(Req C 43.84, H 5.02, N 13.95); IR(KBr)v 3360, 1750, 1640, 1590 cm⁻¹; ¹HNMR(DMSO-d₆)δ 1.38 (s, 9H, CH₃ × 3), 4.50 (s, 2H, OCH₂CO₂), 6.82 (s, 1H, thiazole-5H), 7.15 (br, 2H, NH₂), 与文献^[4]报道一致。

参 考 文 献

- 1 陈岱宗. 1983~1985年国外抗生素及有关药物新品种动态和展望(上). 抗生素 1986; 11(6): 514~36
- 2 O'Callaghan CH, Livermore DGH, Newall CE. *Ger Offen. DE 2 921 316*, 1979; (*Chem Abstr* 1980; 92: 198413c)
- 3 Hcymcs R, Lutz A. U.S. US 4 283 396, 1981; (*Chem Abstr* 1981; 95: 203976g)
- 4 Kishimoto S, Matsuo T, Ochiai M. *Eur Pat Appl EP93376*, 1983; (*Chem Abstr* 1984; 100: 209515z)
- 5 Ueda Y, Roberge G, Vinet V. A Simple method of preparing trimethylsilyl- and tertbutyldimethylsilyl-enol ethers of α -diazoacetates and their use in the synthesis of a chiral precursor to thienamycin analogs. *Can J Chem* 1984; 62: 2936~40
- 6 Glaxo Group Ltd. *Jpn Kokai Tokkyo Koho* JP 79 39090, 1979 (*Chem Abstr* 1979; 91: 157730q)

□ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □ □

联合国人口活动基金援助项目 85-P28 顺利完成

联合国人口活动基金会援助我校的项目 85-P28(避孕药质量保证和生产培训中心)从 1989 年实行起共拨款约 98.8 万美元, 经过一年的努力, 引进了全部分析仪器和制剂生产设备。其中分析仪器已按装调试完毕, 并拟定了一项符合实际的第一期培训计划, 将于六月份开始执行。

在最近举行的联合国人口基金会(UNFPA)、项目执行机构(PIACT)和经贸部国际局三方评审会上, 代表们一致认为该项目完成速度之快、质量之高都是令人满意的, 建议该项目扩大培训内容和范围, 不仅要为国内服务, 还要为东南亚有关国家的受援项目服务。同时还将相应地增加一些必要的仪器设备。该机构对上述第二周期项目执行的情况表示满意, 决定为第二周期的项目再拨款 50~60 万美元, 援助校药厂扩大壬苯醇醚的生产规模, 购置有关的生产设备。

(漫 绿)