

色固体 10.0 g, mp 113-115℃, 苯重结晶, 得白色针状结晶 9.4 g, mp 114~116℃ (文献^[6] 117~118℃), 收率 91.8%。

吗氯贝胺(1)

取 5.0 g (0.019 mol), 吗啉 3.5 g (0.040 mol), 乙酸乙酯 30 ml, 搅拌 1 h, 加水 20 ml, 10% 盐酸调至 pH 1~2, 分去酯层, 用乙酸乙酯 (30 ml × 2) 提取, 水层用 10% 氢氧化钠中和至 pH 8~9, 析出固体, 抽滤, 异丙醇重结晶, 得白色针状结晶 4.1 g, 收率 80.2%, mp 136~137℃ (文献^[2] 137℃). Anal C₁₃H₁₇ClN₂O₂: C 58.05, H 6.44, N 10.42. Req C 58.10, H 6.38, N 10.43; IR (KBr) ν 3312 (N-H); 1638 (C=O); 1542 (N-H) cm⁻¹. ¹H NMR (DMSO) δ ppm 7.68 (m, 4H, C₆H₄); 6.8 (br, 1H, -CON-H); 3.6 (t, 4H, -C-CH₂-O-CH₂-C-); 3.5 (t, 2H, -CON-CH₂-); 2.5 (m, 6H, $\text{---CH}_2\text{---N} \begin{matrix} \text{CH}_2 \\ \text{CH}_2 \end{matrix}$).

参考文献

- 1 潘雁. 抗抑郁药吗氯贝胺. 国外医药——合成药、生化药、制剂分册 1994, 15(5):302
- 2 CA, 1981, 94, 65702
- 3 CA, 1979, 91, 123739
- 4 Cornet F, Fortani F, Liso C, Heteroalkylamides of monoethyl phenylethyl malonate. *Boll Chim Farm* 1964, 103(4):268
- 5 Cortese F. β -bromoethylamine hydrobromide. *Org Syn* 1943, Coll Vol 1:91
- 6 Heine HW. Intramolecular substitution reactions. VII. The formation of 2-benzoxolines from *N*-2-bromoethylbenzamides. *J Am Chem Soc* 1956, 78:3708

【文摘 040】 薄层层析和反相高效液相色谱检测木瓜蛋白酶催化合成的 Aspartame 及其中间产物

姚文兵, 吴梧桐, 许激扬, 严悦日等. 药物生物技术, 1994; 1(2):9

本文报道以 TLC 和 HPLC 法检测以木瓜蛋白酶在水-乙酸乙酯两相反应体系中合成的 Aspartame 及其中间产物(I)、(II)。TLC 条件为: 展开剂(正丁醇: 冰醋酸: 水 = 3:1:1), 展开时间(4~5h), 检测(荧光检测 253.7nm, 1% 茚三酮丙酮溶液显色)。HPLC 条件为: 流动相(乙腈: 水 = 45:55), 流速 1ml/min, 检测(紫外检测 260nm), 进样量 20 μ l, 灵敏度 6, 纸速 1~4mm/min, 分析周期 10min。该方法简便、准确、灵敏度高。用该方法也证实以木瓜蛋白酶催化合成的 Aspartame 及其中间产物(I)与以嗜热蛋白酶(Thermolysin)催化合成的 Aspartame 及其中间产物(Cbz-Asp-PheOMe)完全一致。

【文摘 041】 新大环内酯类抗生素 M-90 的研究 IV 诺亚霉素的提取精制及若干理化生物学性质

张和平, 顾觉奋. 药物生物技术, 1994; 1(2):13

用有机溶剂从小单孢菌 M-90 的发酵液中提取, 并进一步通过柱层析方法精制得到一种新的大环内酯类抗生素—诺亚霉素。诺亚霉素的一系列理化性质表明其不同于其它已知的大环内酯类抗生素, 它具有广谱抗菌活性, 对 G⁺, G⁻ 菌及某些实验真菌有

效。

【文摘 042】 宁夏枸杞新品种“宁杞 1 号”干果中总糖及多糖类物质的系统分析

高向东, 姚文兵, 李隽等. 药物生物技术, 1994; 1(2):40

本文对宁夏农林科学院枸杞研究所栽培的宁夏枸杞新品种“宁杞 1 号”枸杞干果中各种糖类物质, 包括还原糖、中性多糖、酸提多糖和碱提多糖及糖醛酸的含量进行了系统的分析研究, 并与原品种“大麻叶”枸杞干果的糖类成分含量进行了比较。实验结果表明, “宁杞 1 号”及“大麻叶”枸杞含量为 59.65% 和 55.22%; 还原糖含量为 10.26% 和 12.01%; 中性多糖含量为 24.08% 和 18.97%; 酸提多糖含量分别为 0.56% 和 0.38%; 碱提多糖含量分别为 0.44% 和 0.42%; 糖醛酸含量分别为 23.64% 和 22.91%。“宁杞 1 号”枸杞干果的多糖含量比原“大麻叶”品种高 26.9%, 而还原糖含量低 14.6%。

【文摘 043】 酶法合成 Aspartame 的研究 许激扬, 吴梧桐, 姚文兵, 金生浩. 药物生物技术, 1994; 1(2):44

本文分别采用嗜热菌蛋白酶和木瓜蛋白酶为催化剂^[3,4], 以苯氧羰酰-L-天冬氨酸和 L-苯丙氨酸甲酯为底物, 酶促合成 Aspartame; 并以富马酰-L-苯丙氨酸甲酯为底物, 在氨供体存在下利用大肠杆菌 *E. Coli* cpu 890^[5] 直接转化合成 Aspartame。