

# By-products from Mannich Reaction of Dihydrobenzopyranones

Hou Xiaoping, Huang Wenlong, Peng Sixun

Division of Medicinal Chemistry, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009

**Abstract** It was reported that 3-aminoalkyl benzopyranones were obtained by Mannich reaction of 2-monosubstituted benzopyranones with paraformaldehyde. However, all attempts to introduce the 3-aminoalkyl group directly to the 2-disubstituted benzopyranones were unsuccessful in present study. First, the pyrrolidine-catalyzed Aldol condensation with paraformaldehyde in acetic acid led to the methylene compounds which were unstable when they were heated, and then Diels-Alder dimers were formed immediately. The reasons why it was difficult to prepare the 3-aminoalkyl-2-disubstituted benzopyranone ones by Mannich reaction remain to be further studied.

**Key words** Mannich reaction; Benzopyranones; Diels-Alder reaction; Aldol condensation

【文摘 016】 徐长卿组织培养技术的研究 高山林, 朱丹妮, 徐德然. 药物生物技术, 1995, 2(4): 33

对徐长卿组织培养快速繁殖技术的试验研究结果表明, NAA 诱导愈伤组织效果优于 IAA。而 IAA 较适于诱导丛生芽, BA 浓度有较明显的协同作用。因此, 在组织培养中激素和生长素的合理配合是达到最佳培养效果的关键。试验结果表明: 诱导愈伤组织的最适培养基为 MS+NA 1.0 g/L+NAA 1.0 mg/L, 诱导丛生芽的最适基为 B<sub>5</sub>+BA 2.0 mg/L+IAA 0.5 mg/L, 而诱导生根的最适培养基为 1/2 MS+NAA 1.0 mg/L。通过三阶段组织培养技术的优化, 可以快速繁殖出大批种苗, 有效地解决徐长卿药材繁殖速度慢的问题, 这一技术可望应用于生产。

【文摘 017】 药物生物技术进展 吴梧桐, 王友同, 吴文俊. 药物生物技术, 1995, 2(3): 40

综述了生物技术医药产品的开发和生产情况, 包括基因工程药物、蛋白质工程药物、单克隆抗体、

动植物细胞工程产品、酶工程产品等进展; 亦综述了国内生物技术产品研究情况及国内一些生化药物现状; 提出以生物技术促进我国生物药物发展, 应用基因工程技术研究开发新药及改造传统制药工业的研究方向及注意的问题。全文综述文献 21 篇。

【文摘 018】 反相 HPLC 分析发酵液、中间体中妥布拉霉素的含量 顾觉奋, 杜春波, 邓晓燕. 药物生物技术, 1995, 2(3): 24

妥布拉霉素 (Tobramycin, TOB) 是 *S. tenebrarius* 发酵的次级代谢物, 属于氨基糖苷类抗生素。本文建立了用反相 HPLC 法分析测定了 TOB 的含量, 考察了发酵液预处理条件和试剂及 pH 对于中间体提取效果的影响, 及时反馈发酵液、吸附废液、解吸液、固体粗品中妥布拉霉素效价情况, 为中间体各环节的质量控制提供了简便快速、重现性好的方法。色谱柱为 C<sub>18</sub>, 150×4.6 mm, 流动相为乙腈-甲醇-水-醋酸, 检测波长 365 nm。