

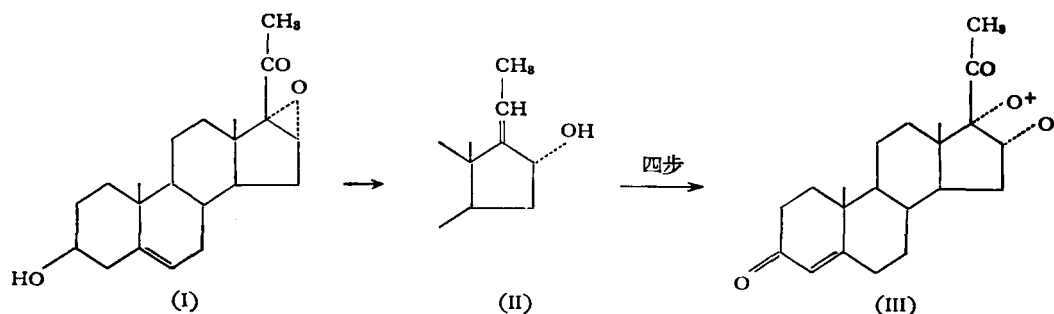
## 新法合成 $16\alpha$ 羟基化合物

黄鸣龙 仲同生 庞卿辉 陈毓羣

(中国科学院有机化学研究所, 上海)

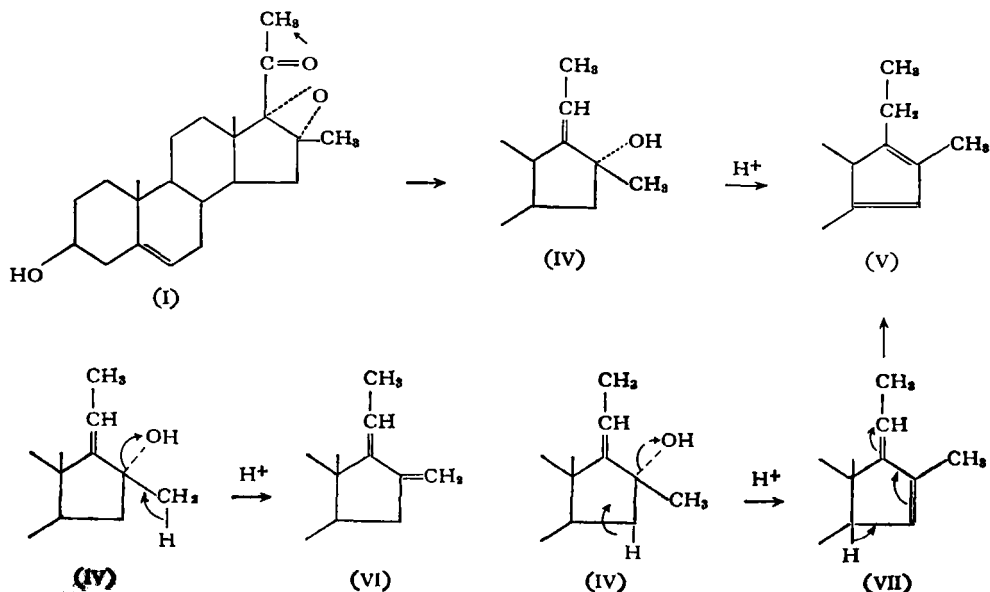
一般甾体激素化合物加入  $16\alpha$  羟基不仅疗效增强, 并且副作用减少。

(1) 本文报告应用很简便的改良 Wolff-Kishner 还原法还原  $16\alpha, 17\alpha$  环氧化合物 I 得到产量甚佳的  $16\alpha$  羟基化合物 II, 其结构及构型都可证明:



将此物经四步做成化合物 III, 此物的避孕效力正在测验中。

(2) 鉴于甾体化合物中加入  $16\beta$  甲基也同样地增强生理作用, 故将化合物 I 制成在  $C_{16}$  既含甲基又含羟基化合物 IV (顺式及反式异构体)。这两种立体异构体遇酸各按酸的种类及浓度直接形成 V, 或先形成 VI 及 VII 再变为 V。



上式是表示其转变经过及可能的机理, 化合物 IV, V, VI 及 VII 的结构都经若干物理化学实验证明无疑。