

## 16 $\alpha$ -甲基的甾体化合物

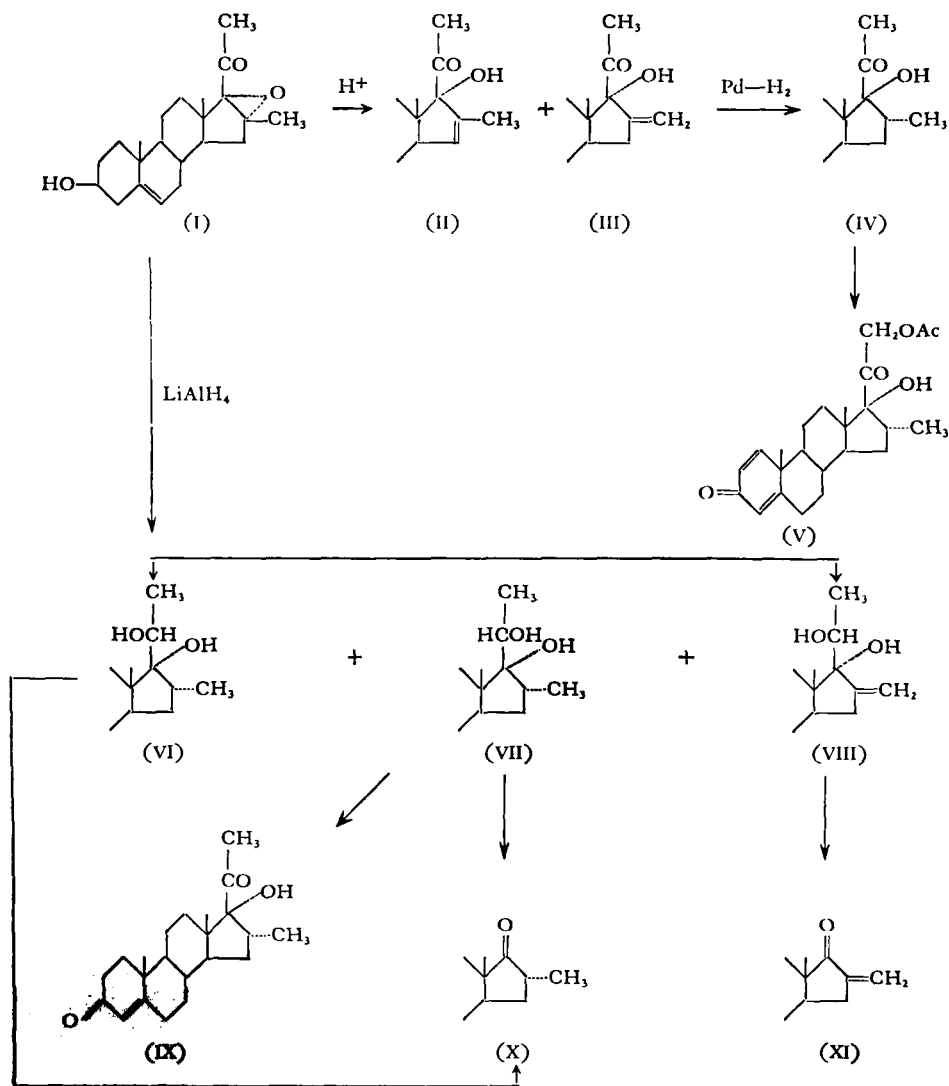
黄鸣龙 吴照华 金善焯 陈毓辉 蔡祖憚

(中国科学院有机化学研究所, 上海)

在甾体激素化合物的 C<sub>16</sub> 上加入甲基, 则疗效增强副作用减小。

(1) 新法引进 16 $\alpha$ -甲基合成 16 $\alpha$ -甲基-9 $\alpha$ -氟-1-脱氢考的唑(dexamethasone)。

作者发现一个简便的新法, 将易于生成的 16 $\beta$ -甲基变为 16 $\alpha$ -甲基, 同时又生成 17 $\alpha$ -羟基如下所示。化合物 II—IV, 都分别证明其结构。从 IV 经若干步合成化合物 V, 此物能变为 16 $\alpha$ -甲基-9 $\alpha$ -氟-1-脱氢考的唑是已知的事实。



将 I 用  $\text{LiAlH}_4$  还原得化合物 VI, VII 及 VIII, 其结构与构型都经若干实验例如转变为已知物 IX, X 及 XI 而证实.

(2) 合成含有  $\text{C}_6$  基团的  $16\alpha$ -甲基  $17\alpha$ -羟基甾体化合物.

用化合物 I 不先除去  $\Delta^5$ -即用 Gallagher 法加入  $17\alpha$ -羟基同时加入  $5\alpha, 6\alpha$ -环氧(II) 再用氯化氢破氧桥引入氯原子; 然后用铬酐氧化, 以酸脱水制成化合物 III.

