

连氨基头孢菌素7 α 位引入烷氧基的温和方法

孙快麟, 李润菘

国家医药管理局上海医药工业研究院

收稿日期 修回日期 网络版发布日期 接受日期

摘要 笔者曾在合成青霉素的过程开发了在连氨基青霉素上引入6 α 烷氧基的方法.

本文运用这一方法于头孢菌素系列在7 α 位引入烷氧基, 连氨基头孢菌素, 由于硝基的强吸电子性,

使共轭链的电子云向其偏移, 在C7位形成缺电子中心,

这样低级烷氧基可以相应的醇在温和条件下在质子酸存在下立体选择性地引入C-7 α 位, 叔丁醇和C7 α

的高级醇不起反应. 运用这一方法合成了12个7 α -烷氧基-7 β -肟头孢菌素二苯甲酯衍生物, 并用UV, IR,

质子磁共振和质谱鉴定了它们的结构.

关键词 [紫外分光光度法](#) [烷氧基](#) [红外分光光度法](#) [质谱法](#) [质子磁共振谱法](#) [一元醇](#) [头孢霉素](#)
[烷氧化反应](#)

分类号 [0629](#)

A mild method of introducing 7 α -alkoxy in cephalosporins

SUN KUAILIN, LI RUNSUN

Abstract A mild method of introducing 7 α -alkoxy in cephalosporins was developed. An electrophilic center was formed at the C-7 position of 7-substituted-azino-cephalosporins with the help of a nitro group via the conjugated system. The lower alkoxy groups (including C1-C3 alkyl and Bu) were stereoselectively introduced into the C-7 α position under mild conditions from the corresponding alcs., in the presence of protic acids. tert-Bu alcohol and its higher homologs do not react. Twelve new benzyhydril esters of 7 α -alkoxy-7 β -hydrazonocephalosporins I (R = H, OAc, methyltetrazolythio; R1 = nitrophenyl, nitrothienyl, nitrofuryl; R2 = Me, Et, Pr, Me2CH, Bu) were synthesized, the structures of which were identified with UV, IR, ¹H NMR and mass spectra.

Key words [ULTRAVIOLET SPECTROPHOTOMETRY](#) [ALKOXYL GROUP](#) [INFRARED SPECTROPHOTOMETRY](#) [MASS SPECTROGRAPHY](#) [PROTON MAGNETIC RESONANCE SPECTROMETRY](#) [MONOHYDRIC ALCOHOL](#) [CEPHALOSPORINS](#)

DOI:

通讯作者

扩展功能

本文信息

▶ [Supporting info](#)

▶ [PDF\(0KB\)](#)

▶ [\[HTML全文\]\(0KB\)](#)

▶ [参考文献](#)

服务与反馈

▶ [把本文推荐给朋友](#)

▶ [加入我的书架](#)

▶ [加入引用管理器](#)

▶ [复制索引](#)

▶ [Email Alert](#)

▶ [文章反馈](#)

▶ [浏览反馈信息](#)

相关信息

▶ [本刊中 包含“紫外分光光度法”的相关文章](#)

▶ 本文作者相关文章

· [孙快麟](#)

· [李润菘](#)