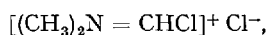


Ein neues Verfahren der Partialsynthese der Penicilline

Antibiotika vom Penicillintyp können ausser durch Fermentation auch durch partialsynthetische Verfahren, d.h. durch Acylierung der 6-Aminopenicillansäure (6-APA), dargestellt werden¹⁻⁴.

Ein neues Reagens für die Partialsynthese von Penicillinen mit einem weiten Anwendungsbereich fanden wir in N,N'-Dimethylchloroformiminiumchlorid⁵,



das durch Reaktion von Phosgen mit Dimethylformamid⁶ sehr leicht gewonnen wird. Dieses Reagens führt bereits bei sehr niedrigen Temperaturen organische Säuren in die reaktive Form über, die dann mit 6-APA kondensiert werden kann. Die Ausbeuten erreichen annähernd 85% der Theorie und die gewonnenen Antibiotika enthalten in der Regel keine Nebenprodukte. Da die Reaktion unter sehr schonenden Bedingungen durchgeführt wird, tritt auch keine bedeutende Spaltung des β -Lactamrings ein.

Das neue Verfahren zur Partialsynthese der Penicilline wird folgendermassen durchgeführt. Man lässt N,N'-Dimethylchloroformiminiumchlorid mit der äquivalenten Menge der entsprechenden organischen Säure in einem inerten Lösungsmittel (Halogenkohlenwasserstoffe, niedrigere Dialkylketone, Dimethylformamid, Acetonitril usw.) bei -20 bis 0°C reagieren. Die entstandene Lösung der reaktiven Form der Säure wird dann mit dem ge-

eigneten Salz der 6-APA bei ca. 0°C kondensiert und das Antibiotikum auf übliche Weise, z.B. in Form therapeutisch verwendbarer Salze, isoliert.

Die mit dieser Methode hergestellten bekannten und auch neuen Penicilline wurden qualitativ und quantitativ durch IR-Spektrophotometrie, Papierchromatographie, Hydroxylamin- und jodometrische Bestimmung sowie überdies durch bakteriologische Tests charakterisiert und geprüft. Eine ausführliche Publikation erfolgt an anderer Stelle.

Summary. A new method for preparing semisynthetic penicillin is based on the reaction of organic acids with N,N'-dimethylchloroformiminium chloride followed by condensation with salts of 6-aminopenicillanic acid. The method is very simple and has a broad application.

L. NOVÁK und J. WEICHET

Forschungsinstitut für Pharmazie und Biochemie, Praha (Tschechoslowakei), 5. November 1964.

¹ V. G. PERRON et al., J. Am. chem. Soc. **82**, 3934 (1959).

² D. C. HOBBS und A. R. ENGLISH, J. Med. Pharm. Chem. **4**, 207 (1961).

³ F. P. DOYLE et al., J. chem. Soc. **1962**, 1440.

⁴ K. BAUER et al., Naturwiss. **47**, 469 (1960). – W. KAUFMANN und K. BAUER, Naturwiss. **47**, 474 (1960).

⁵ Tschech. Pat. 112232 und Pat. Ann. 4786-62.

⁶ Z. ARNOLD, Coll. Czech. Chem. Comm. **24**, 4048 (1958).

CONGRESSUS

Czechoslovakia

(A) G. Mendel Memorial Symposium 1865–1965

Brno, August 4–7, 1965

(B) Symposium on the Mutational Process

Praha, August 9–11, 1965

(A) *Sessions:* Origin of Mendelism, Opening of the Mendel Memorial attached to the Moravian Museum, Development of Genetics, Modern Genetics, Applied Genetics.

(B) *Sessions:* The Mechanism of Mutation and Mutation-inducing Factors, The Physiology of Gene and Mutation Expression, Mutations in the Population, Genetic Variations in Somatic Cells.

Address for all correspondence: The Secretariat of the G. Mendel Memorial Symposium, The Secretariat of the Symposium on the Mutational Process, Flemingovo nám. 2, Praha 6 (Czechoslovakia).

Österreich-Schweiz

Seminar der biometrischen Gesellschaft

Innsbruck, 6.–10. September 1965

Die Internationale Gesellschaft für Biometric, Region Österreich-Schweiz, veranstaltet vom 6.–10. September 1965 in Innsbruck eine Tagung, die den Anwendungen biometrisch-statistischer Methoden in Biologie und Medizin, sowie in der Land- und Forstwirtschaft gewidmet ist.

Programm: Statistik in Biologie und Medizin, im besonderen in Genetik und Land- und Forstwirtschaft.

Referenten: Dozent Dr. OLBRICH, Prof. LE ROY, Prof. LINDER, PD. Dr. KÖNIG, PD. Dr. MARTHALER, Dozent Dr. WOHLZOGEN, Dr. H. GRIMM, Dr. F. H. SCHWARZENBACH, Prof. ROSIN, Prof. WEGMÜLLER und Dr. F. WEBER.

Anfragen und Anmeldungen: Dozent Dr. E. OLBRICH, Anatomisches und Histologisch-Embryologisches Institut der Universität, Innsbruck (Österreich), Müllerstrasse 59.

CORRIGENDUM

M. DA PRADA, G. BARTHOLINI, and A. PLETSCHER: Formation of 5-Hydroxytryptophol by Blood Platelets after Thrombin and Reserpine. *Experientia* **21**, 135 (1965). *Fig. 2:* The letters A and B on the right hand side of the Figure should be exchanged. The lower spot should be labelled with A (= 5-hydroxytryptamine) and the upper spot with B (= 5-hydroxytryptophol).