

ABSTRACT

Studien über Sexualhormone

Über die Ergebnisse der chemischen Synthese und biologischen Prüfungen von 17 α -Methyl-3-keto-5,17-dioxy-androstan

Shunji FUKUDA

(Utzino Laboratorium)

Eingegangen am 24. Januar 1955

Zur peroralen Prüfung wurde das 17 α -Methyl-3-keto-5,17-dioxyandrostan (X) aus dem Dehydro-isoandrosteron (I) auf zwei Wegen bereitet. Die eine Darstellung ist zwar der Juliaschen und Heusserschen gleich, aber die andere ist die folgende: Dehydro-isoandrosteron (I) lieferte bei der Oxydation mit Benzopersäure in der Hauptreaktion 5,6 α -Epoxyd (IV), dessen Monoacetat durch Hydrierung mit Platinoxid als Katalysator in Eisessiglösung ins 3 β -Acetoxy-5,17 β -dioxy-androstan (VI) übergegangen ist. Diese Verbindung (VI) lieferte durch Oxydation mit Chromtrioxyd und durch nachfolgende Verseifung mit Pottasche in Methanol 3 β ,5-Dioxy-androstanon-(17) (VIII).

Dieses Keton (VIII) liess sich durch Behandlung mit Grignard-reagens ins 17 α -Methyl-3 β ,5,17-trioxy-androstan (IX) überführen, und die Mischprobe mit dem Reduktionsprodukt vom 5,6 α -Oxyd (III) zeigte keine Erniedrigung des Schmelzpunktes. Die nachfolgende Oxydation dieser Verbindung (IX) mit Chromtrioxyd führte zum gesuchten Endprodukt (X) dieses Versuches.

Der Verfasser hat die relative Potenz des 17 α -Methyl-3-keto-5,17-dioxy-androstans zu Methyltestosteron durch die statistische Behandlung des Hähnchenkammtestes (4-Punkt-Plan) geprüft und konnte feststellen, dass bei peroraler Applikation sie 1.24 mal so gross als Methyltestosteron ist und ihre zuversichtliche Grenze mit 5 % Wahrscheinlichkeit zwischen 0.83 und 2.24 liegt.