

topiperazin², eine Umamidierungsreaktion, durch welche ein carbonylgruppenaktives, bifunktionelles Molekül mit zwei freien ($-\text{O}-\text{NH}_2$)-Gruppen entsteht. Es ist nicht bekannt, ob dieser Verbindung noch antibakterielle Eigenschaften zukommen.

Das wie seinerzeit¹ erhaltene Cyanhydrin, β -(Diphenylmethylenaminoxy)-milchsäurenitril (V) wurde mit methanol. Dimethylamin in das überraschend schwach basische β -(Diphenylmethylenaminoxy)-N-dimethylaminitril (IV) $\text{C}_{18}\text{H}_{19}\text{N}_3\text{O}$, Schmp. 79° , übergeführt. Mineralsäure Verseifung des Nitrils (IV) unter Veresterungsbedingungen ergab das β -(Diphenylmethylenaminoxy)-N-dimethylalanin-methylesterchlorhydrat (III) $\text{C}_{19}\text{H}_{23}\text{O}_3\text{N}_2\text{Cl}$ vom Schmp. $164-165^\circ$, das unter Abspaltung des Benzophenonrestes durch energische, aber kurze Hydrolyse mit wäßr. Mineralsäure und Nachveresterung in das vermutliche Dichlorid des β -Aminoxy-N-dimethylalanin-methylesters (II) verwandelt wurde. Während nun das (II) entsprechende Bisnorderivat, mit einer alkohol. Triton-B-lösung behandelt, unter Abscheidung des in Alkohol schwerlöslichen Cycloserins reagierte, kann dieses Verfahren infolge der überraschend guten Löslichkeit des (I) in organischen Medien nicht angewendet werden. Man cyclisierte mit alkohol. Natronlauge, setzte mit alkohol. Salzsäure frei und nahm nach Abtrennung vom NaCl in Chloroform auf. Das schließlich aus Äther — in welchem Cycloserin gänzlich unlöslich ist — umkristallisierte (I) zeigte einen Schmp. von $112-117^\circ$ und gab die für $\text{C}_5\text{H}_{10}\text{N}_2\text{O}_2$ zu verlangenden Analysenwerte.

N,N-Dimethylcycloserin (I) gibt die schöne, für Cycloserin charakteristische blaue Farbreaktion mit Nitritopentacyanoferrat von R. Jones³, nicht jedoch, und unterschiedlich von Cycloserin, die Ninhydrinreaktion.

D,L-N,N-Dimethylcycloserin wurde parallel mit D,L-Cycloserin auf seine antibakterielle in vitro-Wirksamkeit gegen eine Reihe von grampositiven und gramnegativen Erregern, sowie gegen den Tbc-Stamm H₃₇Rv geprüft und erwies sich bis zur gewählten Höchstkonzentration von 500 γ pro ml Nährboden gänzlich unwirksam (E. Semenitz).

Ersatz der beiden Wasserstoffatome in der primären Aminogruppe des Cycloserins führt also zu gänzlichem Verlust der Wirksamkeit.

² Ph. H. Hidy, E. B. Hodge, V. V. Young, R. L. Harned, G. A. Brewer, W. F. Phillips, W. F. Runge, H. E. Stavelly, A. Pohland, H. Boaz und H. R. Sullivan, Commercial Solvents Co. und Lilly Research Lab., J. Amer. Chem. Soc. **77**, 2345 (1955).

³ L. R. Jones, Analyt. Chem. **28**, 39 (1956).

Erratum

In der Arbeit von Th. Gröger und E. Waldmann „Über Kondensationen von aromatischen Aldehyden mit Glykolsäurederivaten“ soll es (Mh. Chem. **89**, S. 374, 2. Zeile von unten) heißen: Benzyloxyessigsäure- (nicht Benzylhydroxyessigsäure-).