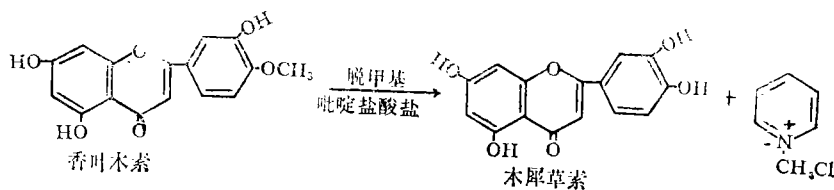


木犀草素半合成中脱甲基方法的改进

安徽省医学科学研究所(合肥 230061) 金继曙 郝述虎

木犀草素(luteolin)是镇咳祛痰有效药物^[1], 化学结构为5, 7, 3', 4'-四羟基黄酮。原合成路线是以橙皮甙为起始原料, 经乙酰化、脱氢、水解得香叶木素, 再行脱甲基(用氢碘酸)和聚酰胺柱层析等步。原路线^[2]用氢碘酸脱甲基, 由于氢碘酸不仅不易储存, 每次使用前都要重新处理, 而且价格很贵, 因此给工业生产带来了一定的困难。为了克服以上缺点, 我们曾参照文献^[3]普雷(preg)芳基烷基醚裂解反应(芳基烷基醚和无水吡啶盐酸在180~200°C长时间加热则发生裂解, 脱烷基而生成酚类的反应), 用吡啶盐酸盐对香叶木素进行脱甲基试验, 结果取得了和氢碘酸相近的效果, 且成本大大下降, 工序亦有所简化, 反应式如下图。



方法: 取香叶木素3g, 吡啶盐酸盐90g, 回流加热约5h, 倾入冰水中, 滤出棕色沉淀物, 用水洗涤后, 干燥, 得木犀草素粗品约2.7g。粗品经聚酰胺柱层析精制, 再用稀醇重结晶, 得到淡黄色木犀草素结晶(收率与氢碘酸脱甲基同时对对照试验相近)。mp327~329°C; IR $\nu_{\text{max}}^{\text{KBr}}$ cm^{-1} : 3360 (-OH), 1650 (C=O), 1600, 1500, 1432 (苯核), 1120 (C-O-C), 875, (1,2,3,5-四取代), 839 (1,3,4-三取代); UV $\lambda_{\text{max}}^{\text{EtOH}}$ nm: 255, 268 (肩), 350。以上分析结果与用氢碘酸脱甲基所得的木犀草素完全一致。

参 考 文 献

- 1 沈芸蓀, 等, 上海药物实用手册, 上海: 文汇出版社, 1992, 883
- 2 金继曙, 等, 中草药通报, 1978, 9(10): 7
- 3 俞凌云中, 有机化学中的人名反应, 北京: 科学出版社, 1984, 156
- 4 韩广甸, 等, 有机制备化学手册, 上卷, 北京: 石油工业出版社, 1977, 146

(1993-10-18收稿)

• 新书预告 •

《虎、豹及其类似动物骨骼比较解剖图志》征订启事

本书由陈代贤主编, 楼之岑、赵达文、赵尔宏审阅。对虎、狮、黑熊、金钱豹、雪豹、云豹、猞猁、金猫、豹猫、家猫等10种动物骨骼, 按其自然连续顺序编排, 精心画出了每种完整的一具成年骨骼各骨块共计两千多个观察面的原大形态素描图, 均按同等比例缩小, 组合编排成200个图版, 解剖学名称直接注在图上。有近400条解剖名称注解及相应英、拉文解剖学名称相对照; 并有这些骨骼的解剖特征比较表和检索表。图谱精美、准确、清晰、逼真, 真实地反映出各种骨骼的形态特征, 方便比较与鉴别, 又利于理解及文献查阅。本书是一部难得的、有珍贵科学价值和实用价值的图鉴书。它是从事动物学基础及中医药科研、教学、药材鉴别、农林、自然资源保护人员实用、方便的工具书。

本书16开本; 书号ISBN 7-5067-1390-X。每册定价35.00元(另加挂号邮费20%), 由中国医药科技出版社1995年5月正式出版, 自办发行, 数量有限, 订阅请从速。

地址: 大连市沙河口区黄河路806-1号 大连市药品检验所

联系人: 陈代贤 任玮 邮编: 116021 电话: 0411-4601506

开户行: 大连市工商银行青办, 帐号: 030-14417422