



УДК 547.814.5

## УСОВЕРШЕНСТВОВАННЫЙ МЕТОД СИНТЕЗА ФЛАВАНОНОВ

© 2002 г. А. Айтмамбетов\*, А. А. Кубжетерова\*\*#

\* Нукусский филиал ТашПМИ, Узбекистан;

\*\* Комплексный институт естественных наук  
Каракалпакского отделения Академии наук Республики Узбекистан, Узбекистан,  
742000, Нукус, просп. Бердаха, 41

Поступила в редакцию 27.04.2001 г. Принята к печати 12.10.2001 г.

Описана изомеризация 2'-гидроксиалконов в соответствующие флаваноны в спирте в присутствии триэтиламина.

*Ключевые слова:* халкон; флаваноны, синтез, изомеризация.

Флаваноны, 2,3-дигидрофлавоны, привлекают исследователей как физиологически активные вещества с разносторонним спектром действия. Среди них найдены соединения, обладающие желчегонной, гепатозащитной, противовоспалительной и другими активностями.

Обычно флаваноны получают изомеризацией 2'-гидроксиалконов в кислой или щелочной среде. Однако условия, которые способствуют смещению равновесия в сторону образования флаванона невозможно предсказать.

Известны методы изомеризации 2'-гидроксиалконов в соответствующие флаваноны действием горячего этанольного раствора, разбавленной щелочи, серной, соляной и фосфорной кислоты. Метанольный раствор соляной кислоты, ацетат натрия и ионообменная смола амберлист [1] также часто используются в этих целях. Иногда применяют пиридин, ледяную уксусную кислоту, *n*-бутиламин, а также силикагель в присутствии концентрированной H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> этилендиамина или гидрохлорида гидроксиламина [2–6].

В настоящем сообщении приводятся результаты изомеризации некоторых 2'-гидроксиалконов в соответствующие флаваноны в спирте в присутствии триэтиламина.

При кипячении халконов (I) в спирте в присутствии триэтиламина за 2 ч с хорошими выходами (60–85%) образуются флаваноны (II). Наиболее высокие выходы флаванонов достигнуты изомеризацией халконов, содержащих в 5'-положении

электронодонорные и электроноакцепторные заместители, а также халконов не содержащих заместителей. Путем кристаллизации или дробной кристаллизации флаваноны были выделены в индивидуальном состоянии (таблица).

Строение и состав полученных флаванонов подтверждены данными элементного анализа, температурами плавления смешанных проб, ТСХ и химическими превращениями.

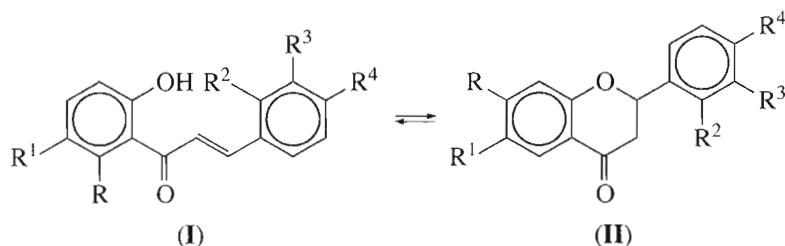
Таким образом, нами предложен усовершенствованный эффективный способ получения флаванонов и изучено влияние заместителей в кольцах А и В на ход изомеризации и выходы целевых соединений.

### ЭКСПЕРИМЕНТАЛЬНАЯ ЧАСТЬ

Ход реакции и чистоту полученных соединений проверяли ТСХ на пластинках Silufol UV-254. В качестве элюента применяли смесь бензола и этанола (9 : 1). Данные элементного анализа всех соединений соответствуют вычисленным.

**Общая методика изомеризации халконов (Ia)–(Im) в флаваноны (IIa)–(IIm).** Раствор 2 ммоль соответствующего 2'-гидроксиалкона и 0.28 мл (2 ммоль) триэтиламина в 25 мл спирта кипятили 2–3 ч. Затем реакционную смесь выливали в холодную воду, содержащую 1 мл 10% соляной кислоты. Выпавший осадок отфильтровывали, про-

# Автор для переписки (факс: (361) 223-65-66).



a:  $R = R^1 = R^2 = R^3 = R^4 = H$ ,

b:  $R = R^2 = R^3 = H, R^1 = CH_3, R^4 = OCH_3$ ,

c:  $R = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^1 = F$ ,

d:  $R = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^1 = Cl$ ,

e:  $R = R^2 = H, R^1 = CH_3, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ ,

f:  $R = R^2 = R^3 = R^4 = H, R^1 = OCH_3$ ,

g:  $R = R^1 = R^2 = R^3 = H, R^4 = OCH_3$ ,

h:  $R = R^1 = R^2 = H, R^3 = R^4 = -OCH_2O-$ ,

i:  $R = R^1 = R^2 = H, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ ,

j:  $R = R^2 = H, R^1 = OCH_3, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ ,

k:  $R = R^2 = H, R^1 = F, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ ,

l:  $R = R^2 = H, R^1 = Cl, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ ,

m:  $R = R^2 = H, R^1 = Br, R^3 = R^4 = -OCH_2CH_2O-$ .

#### Схема.

#### Характеристика соединений (IIa)–(IIm)

Соединение	Выход, %	Т. пл., °С	Брутто-формула	Растворитель для кристаллизации
(IIa)	47.6	76–78	$C_{15}H_{12}O_2$	EtOH
(IIb)	69.4	109–110	$C_{17}H_{16}O_3$	EtOH
(IIc)	72.1	76–77	$C_{15}H_{11}FO_2$	EtOH
(IId)	78.5	96–97	$C_{15}H_{11}ClO_2$	EtOH
(IIe)	73.3	76–78	$C_{17}H_{14}O_4$	EtOH
(IIf)	75.2	94–95	$C_{16}H_{14}O_3$	MeOH
(IIg)	58.8	97–98	$C_{16}H_{14}O_3$	EtOH
(IIh)	85.2	127–128	$C_{16}H_{12}O_4$	MeOH
(Iii)	73.3	108–109	$C_{17}H_{14}O_4$	MeOH
(IIj)	82.3	180–181	$C_{18}H_{16}O_5$	MeOH
(IIk)	79.8	120–121	$C_{17}H_{13}FO_4$	MeOH
(IIl)	81.7	115–116	$C_{17}H_{13}ClO_4$	MeOH
(IIm)	84.1	121–122	$C_{17}H_{13}BrO_4$	AcOEt/петр.эфир

мывали водой и кристаллизовали из подходящего растворителя (см. таблицу).

#### СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Patonay T., Litkei G., Zsuga M., Kiss A. // Org. Prep. and Proceed. 1984. V. 16. P. 315–319.
2. Dutta C.P., Roy P.K. // Ind. J. Chem. 1975. V. 13. P. 425–426.

3. Bagade M.B., Thool A.W., Lokhande P.D., Ghiya B.J. // Ind. J. Chem. 1991. V. 30. P. 973–975.
4. Айтмамбетов А., Хиля В.П. // Химия природн. соед. 1994. № 3. С. 351–355.
5. Айтмамбетов А., Хиля В.П. // Химия природн. соед. 1994. № 4. С. 480–483.
6. Айтмамбетов А., Шинкарук С.Н., Бондаренко С.П., Хиля В.П. // Химия природн. соед. 1994. № 4. С. 494–497.

## An Improved Method for the Synthesis of Flavanones

A. Aitmambetov\* and A. A. Kubzheterova\*\*\*

# Fax: (361) 223-6566

\*Nukus Branch, Tashkent Institute of Pediatric Medicine, ul. Kurbanova 223, Nukus, 742016 Uzbekistan

\*\*\*Complex Institute of Natural Sciences, Kara-Kalpak Division, Academy of Sciences of Uzbekistan, prosp. Berdakha 41, Nukus, 742000 Uzbekistan

An isomerization of 2'-hydroxychalcones into the corresponding flavanones in ethanol in the presence of triethylamine is described. The English version of the paper: *Russian Journal of Bioorganic Chemistry*, 2002, vol. 28, no. 2; see also <http://www.maik.ru>.

Key words: chalcone, flavanone, isomerization, synthesis