

VOLLSTÄNDIGE SYNTHESE DES VOGELIENS, EINES FLAVONOLS VON

TEPHROSIA VOGELII HOOK.

H.WAGNER, L.HÖRHAMMER und G.HITZLER

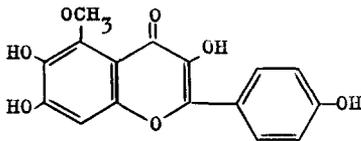
Institut für Pharmazeutische Arzneimittellehre der Universität
München

L.FARKAS*)

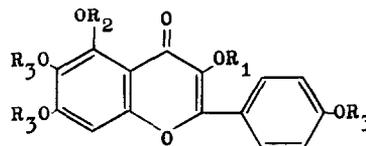
Die Zemplén Gedenk-Laboratorien der Ungarischen Akademie der
Wissenschaften, Technische Universität Budapest

(Received 29 August 1965)

RANGASWAMI und SASTRY¹⁾ isolierten im Jahre 1956 aus den
Samen von *Tephrosia vogelii* Hook ein
Flavon, dem RANGASWAMI und HANUMANTHA RAO²⁾ den Namen
V o g e l e n g a b e n und als 3,6,7,4'-Tetrahydroxy-5-
methoxy-flavon (I) identifizierten.



I



- II a: $R_1=H$; $R_2=R_3=CH_3$
II b: $R_1=R_2=R_3=H$
II c: $R_1=R_2=R_3=COCH_3$
II d: $R_1=R_3=COCH_3$; $R_2=H$
II e: $R_1=R_3=COCH_3$; $R_2=CH_3$
II f: $R_1=R_3=C_2H_5$; $R_2=CH_3$

1) S.RANGASWAMI und B.V.R.SASTRY, Ind.J.Pharm. **18**, 339 (1956)
2) S.RANGASWAMI, F.A.Sc. und K.HANUMANTHA RAO, Proc.Ind.Acad. Sci. **49A**, 241 (1959)

*) zur Zeit, visitor research associate Dep.of Chemistry,
Florida State University, Tallahassee

Zum Strukturbeweis synthetisierten wir das Vogeletin in folgender Weise: 2-Hydroxy-4,5,6-trimethoxyacetophenon wurde in 50%iger Kalilauge mit Anisaldehyd zu 2'-Hydroxy-4,4',5',6'-tetramethoxychalkon (Smp. = 137°) kondensiert. Das Chalkon läßt sich durch modifizierte Algar-Flynn-Oyamada-Oxydation in der Hitze³⁾ in das entsprechende Flavonol (II a: Smp. = 131-132°) überführen. Aus diesem erhält man durch Entmethylierung das 3,5,6,7,4'-Pentahydroxy-flavon (= Nor-Vogeleitin II b: Lit.Smp.: Zersetzung bei 320°). Das dargestellte Nor-Vogeleitin-Pentaacetat (II c) schmilzt bei 229-230° (Literatur²⁾ Smp. = 228-231°).

Führt man mit II b die partielle Acetylierung nach SIMOKORIYAMA⁴⁾ durch, so gewinnt man das 5-Hydroxy-5,6,7,4'-tetraacetat (= Nor-Vogeleitin-tetraacetat: II d) und durch anschließende 2stündige Methylierung mit Methyljodid das 5-Methoxy-3,6,7,4'-tetraacetat (= Vogeletin-tetraacetat: II e: Smp. = 214-215°, Literatur²⁾ Smp. = 211-212°). Durch Verseifen von II d mit methanolischer Salzsäure wird das Vogeletin (I) vom Smp. = 284-285° erhalten (Literatur²⁾ Smp. = 283-284°). Für den Mischschmelzpunkt konnte keine Vergleichsprobe erhalten werden.

Das durch Äthylierung in üblicher Weise dargestellte und chromatographisch gereinigte 3,6,7,4'-Tetraäthyl-vogeletin (II f) weist einen um 20° höheren Schmelzpunkt auf als in der Literatur angegeben (Smp. = 105-106°, Lit.²⁾ Smp. = 84-85°).

Eine ausführliche Mitteilung erfolgt in Kürze in den Chemischen Berichten.

-
- 3) L.HÖRHAMMER, H.WAGNER, K.RÜSLER, E.GRAF und L.FARKAS, Chem.Ber. **97**, 2857 (1964);
Chem.Ber. **98**, 548 (1965)
- 4) M.SIMOKORIYAMA, Bull.chem.Soc.(Japan) **16**, 284 (1941)