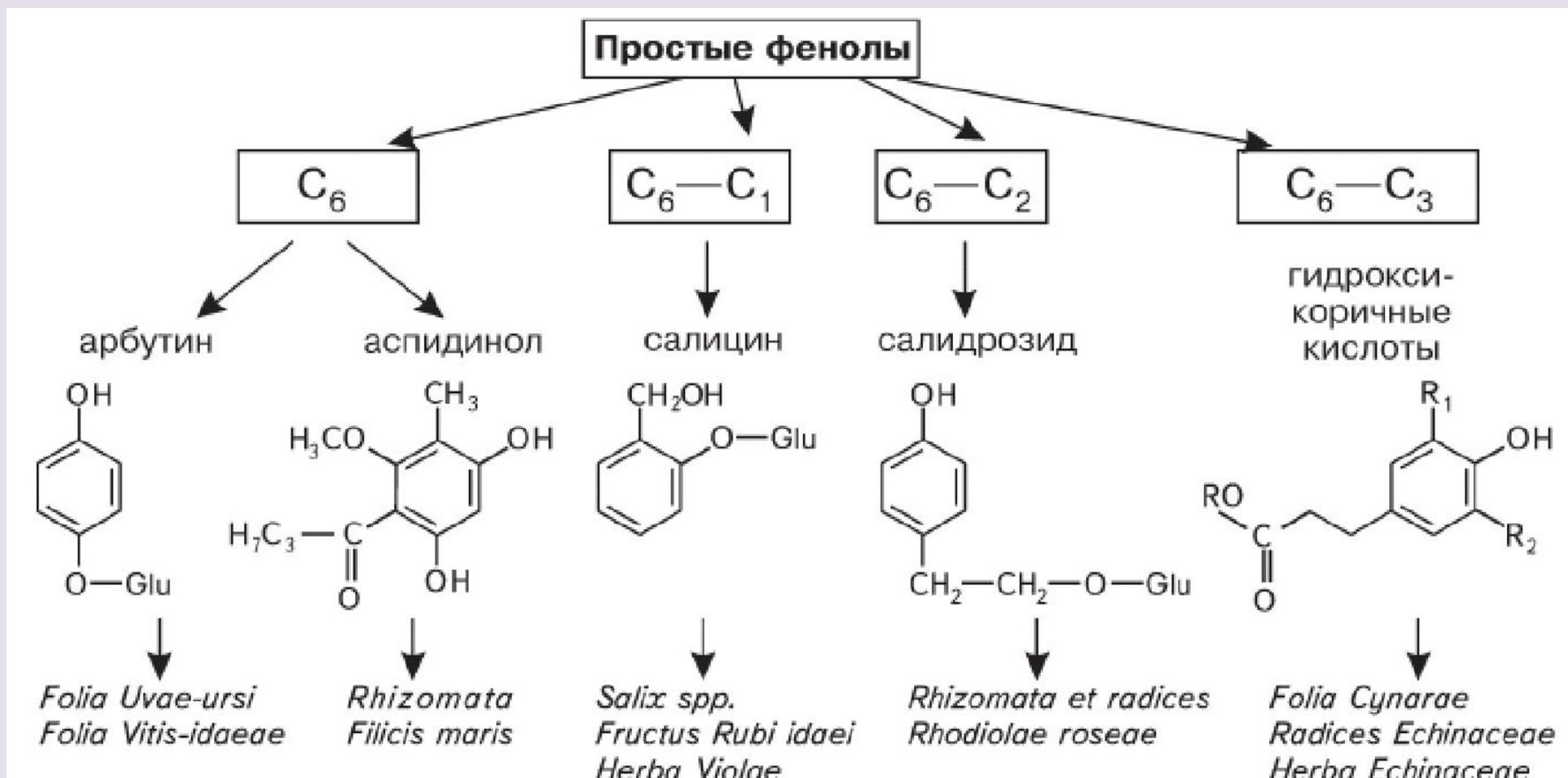


**ЛЕКАРСТВЕННОЕ
РАСТИТЕЛЬНОЕ СЫРЬЕ,
СОДЕРЖАЩЕЕ ФЕНОЛЫ,
ФЕНОЛОГЛИКОЗИДЫ,
ОКСИКОРИЧНЫЕ КИСЛОТЫ И
ЛИГНАНЫ**

Фенологликозиды и простые фенолы - C_6 , C_6-C_1 , C_6-C_2 -соединения, т.е. простые фенолы с одной или несколькими OH -группами и одним ароматическим кольцом (фенол, катехол, пирокатехин, пирогаллол, гидрохинон, флороглюцин и др.), а также производные бензойной кислоты, фенолоспирты или фенилуксусные кислоты. Чаще всего они находятся в связанном виде (в форме гликозидов или сложных эфиров) или же являются структурными элементами более сложных соединений.



Фенологликозиды – соединения, в которых гидроксильная группа связана с сахаром.

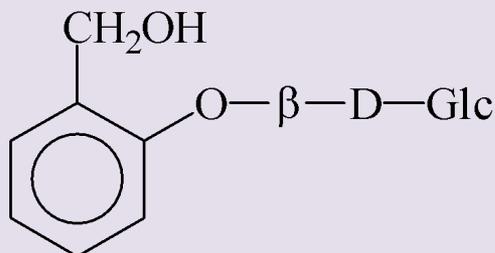
Первый фенологликозид, выделенные из растений, - **салицин** (из коры ивы) – представляет собой β -гликозид салицилового спирта.

β -гликозид гидрохинона – **арбутин** - он накапливается в листьях брусники, толокнянки, бадана толстолистного и др. Часто ему сопутствует в растениях **метиларбутин**.

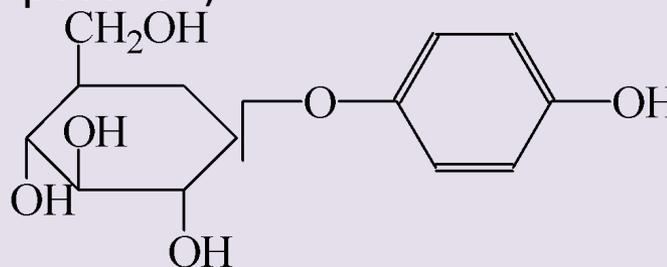
Салидрозид - β -глюкопиранозид п-тирозола, или п-гидроксифенил- β -этанола (кора ивы, подземные органы родиолы розовой).



салициловый спирт



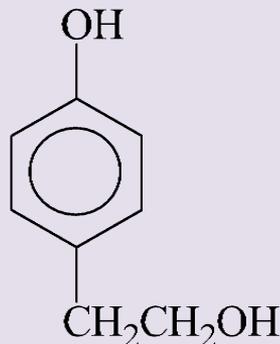
Салицин (саликозид)



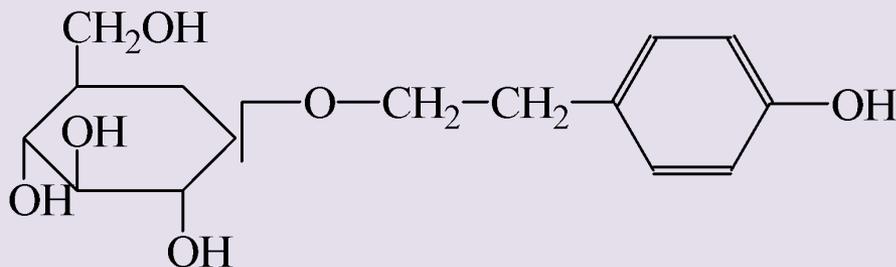
Арбутин



гидрохинон



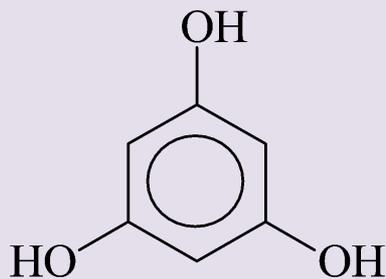
тиразол



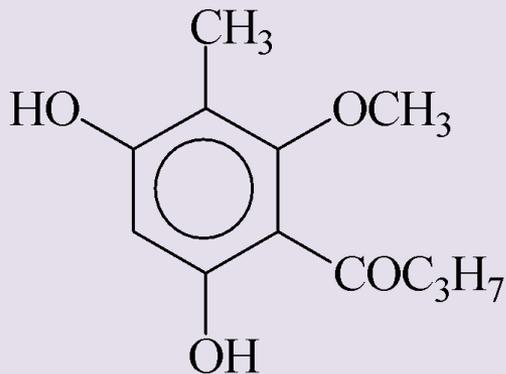
Салидрозид (родиолозид)

Производные флороглюцина и масляной кислоты – **флороглюциды** являются действующие вещества мужского папоротника. Они могут содержать одно кольцо флороглюцина (аспидинол) или представляют собой димеры или тримеры (флавастединовая и филиксовая кислоты).

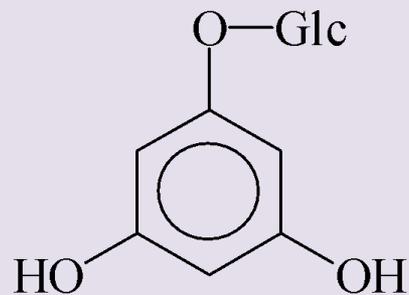
Глюкозид флороглюцина – **флорин** - содержится в кожуре плодов цитрусовых.



флороглюцин



Аспидинол



Флорин

Гидроксibenзойные кислоты, фенолоспирты и их производные.

n-гидроксibenзойная, протокатеховая, ванилиновая кислоты, обнаружены практически у всех покрытосеменных растений. Довольно часто встречаются также галловая и сиреневая, значительно реже салициловая:



$R_1=H, R_2=OH$ – протокатеховая кислота

$R_1=R_2=H$ – *n*-гидроксibenзойная кислота

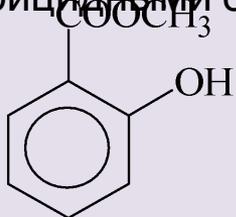
$R_1=H, R_2=OCH_3$ – ванилиновая кислота

$R_1=R_2=OCH_3$ – сиреневая кислота

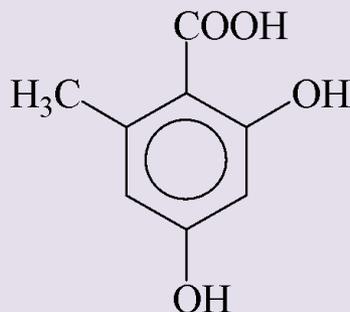
$R_1=R_2=OH$ – галловая кислота

Гидроксibenзойные кислоты содержатся в растительных тканях в свободном и связанном виде. Они могут быть связаны друг с другом по типу **депсидов** или же существовать в виде **гликозидов**.

Лишайниковые кислоты – специфические соединения, синтезируемые лишайниками. Исходным соединением при образовании лишайниковых кислот является **орселлиновая кислота**, широко распространенная в виде **депсида леканоровой кислоты**, обладающей бактерицидными свойствами.



Метилсалицилат
(обнаружен в подземных
органах пиона уклоняющегося)



Орселлиновая кислота



Леканоровая кислота

количественное определение.

Свободные фенольные соединения и их гликозидные формы в индивидуальном состоянии представляют собой кристаллы, растворимые в воде, этиловом и метиловом спиртах, этилацетате, а также в водных растворах гидрокарбоната и ацетата натрия. Под действием минеральных кислот и ферментов фенологликозиды способны расщепляться на агликон и углевод. Присутствие углевода в молекуле фенологликозида сообщает ей свойство оптической активности.

Простые фенолы и агликоны фенологликозидов дают характерные для фенольных соединений реакции: с железоаммонийными квасцами, с солями тяжелых металлов, с диазотированными ароматическими аминами и др.

Для определения арбутина в растительном сырье используют цветные качественные реакции: с сульфатом закисного железа, с 10%-ным раствором фосфорно-молибденовокислого натрия в хлористоводородной кислоте.

Фенольные соединения могут быть обнаружены и идентифицированы с помощью бумажной и тонкослойной хроматографии. При обработке специфическими реактивами и сканировании в УФ-свете они проявляются в виде окрашенных пятен с соответствующими значениями R_f .

Для количественного определения фенольных соединений наиболее часто применяют спектрофотометрический и фотоколориметрический методы, а иногда оксидометрические методы. Так, содержание арбутина в листьях толокнянки и брусники по ГФ XI определяют иодометрическим методом, основанным на окислении иодом гидрохинона, полученного после извлечения и гидролиза арбутина.

Низкомолекулярные фенольные соединения и их производные оказывают **антисептическое и дезинфицирующее действие**.

Арбутин проявляет, кроме того, умеренный **диуретический эффект**.

Фенологликозиды золотого корня (салидрозид, розавин) обладают **адаптогенными и стимулирующими свойствами**, подобно препаратам женьшеня.

Флороглюциды папоротника мужского действуют как **антигельминтные средства**.

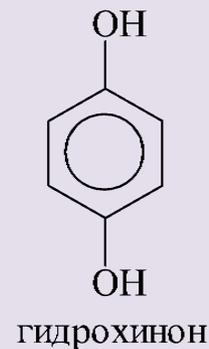
Салициловая кислота и ее производные известны как **противовоспалительные, жаропонижающие и болеутоляющие средства**. Так, вытяжка из коры ивы белой, содержащая салицин, издавна используется в народной медицине при лихорадочных состояниях, при воспалении слизистой ротовой полости и верхних дыхательных путей (полоскания), при кожных заболеваниях (примочки).



Arctostaphylos uva-ursi - Толокнянка
обыкновенная (медвежье ушко)
сем. Вересковые - Ericaceae
Uvae ursi folia - Толокнянки
листья, *Uvae ursi cormus* -
Толокнянки побеги



Действующие вещества – фенологликозиды. Главный компонент – **арбутин** – представляет собой β -D-глюкопиранозид гидрохинона (до 16,8-17,4%). В меньшем количестве содержатся **метиларбутин**, гидрохинон, 2-O- и 6-O-галлоларбутин; флавоноиды – гиперозид, мирицетин и их гликозиды; катехины; тритерпеноиды – урсоловая кислота (0,4-0,7%); фенолкарбоновые кислоты – галловая, эллаговая. Листья богаты дубильными веществами (от 7,2 до 41,6%) гидролизуемой группы.



В медицине применяют в виде настоя или отвара как антисептическое средство при заболеваниях почек и мочевыводящих путей. Входит в состав мочегонных сборов. Выпускают брикеты, экстракт толокнянки сухой (капсулы). При приеме больших доз препаратов может наблюдаться обострение воспалительных явлений в результате длительного раздражения почечных канальцев. Для устранения побочного действия препараты толокнянки следует использовать в комплексе с другими растениями, обладающими противовоспалительными свойствами. Кроме того, в листьях содержится много дубильных веществ, поэтому натощак это средство принимать нельзя (вяжущее действие). Применяется в гомеопатии и составе БАДов.

Vaccinium vitis-idaea - Брусника
обыкновенная
сем. Вересковые - Ericaceae
Folia Vitis-idaeae - Брусники листья



Листья брусники содержат **арбутин** (4-9%), свободный гидрохинон; флавоноиды – гиперозид, кверцитрин, изокверцитрин, рутин, кемпферол; дубильные вещества преимущественно конденсированного ряда (до 15%); урсоловую, эллаговую и хинную кислоты.

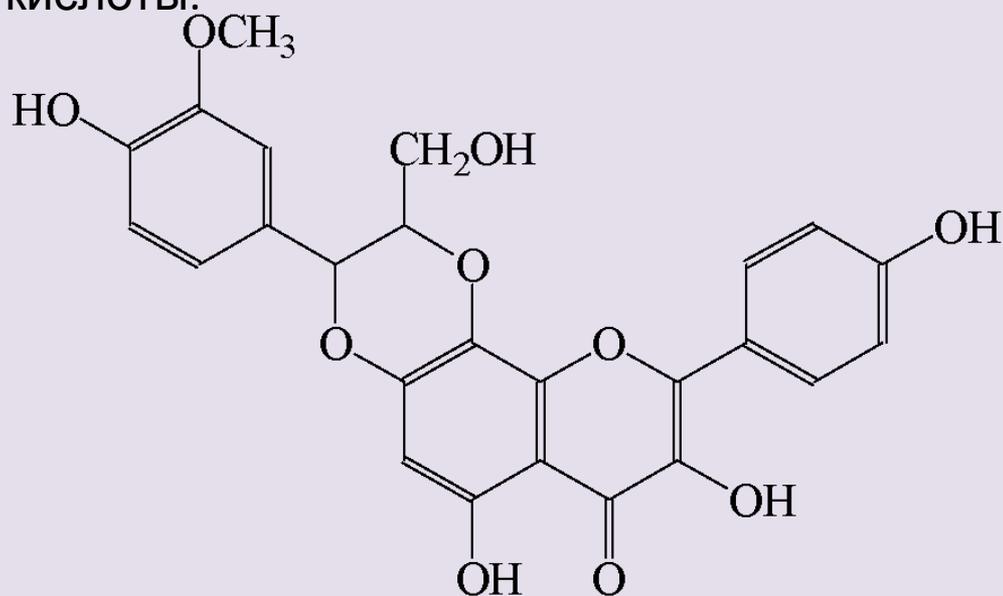
Назначают в виде отвара и настоя как дезинфицирующее и мочегонное средство, главным образом при почечно-каменной болезни, циститах, ревматизме и подагре. Препараты брусники обладают менее выраженным и более мягким диуретическим действием, чем препараты толокнянки, так как содержат меньше арбутина и дубильных веществ. Входят в сбор **«Бруснивер»**. Применяется в гомеопатии и БАДах.

Rhodiola rosea - Родиола розовая
сем. Толстянковые - Crassulaceae

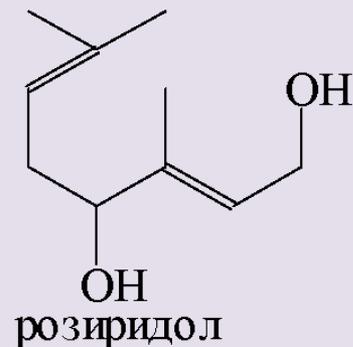
Rhodiola roseae rhizomata et radices - Родиолы корневища и
корни



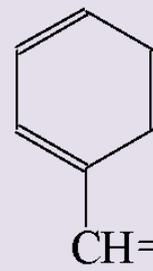
Корневища и корни родиолы розовой содержат фенолоспирт тиразол и его глюкозид салидрозид (около 1%), флавоноиды – производные гербацетина, трицина и кемпферола; гликозиды коричневого спирта – розавин (до 2,5%), розарин, розин; флавонолигнан родиолин; монотерпены – розиридол и розиридин; дубильные вещества (около 20%), эфирное масло и органические кислоты.



родиолин



розиридол



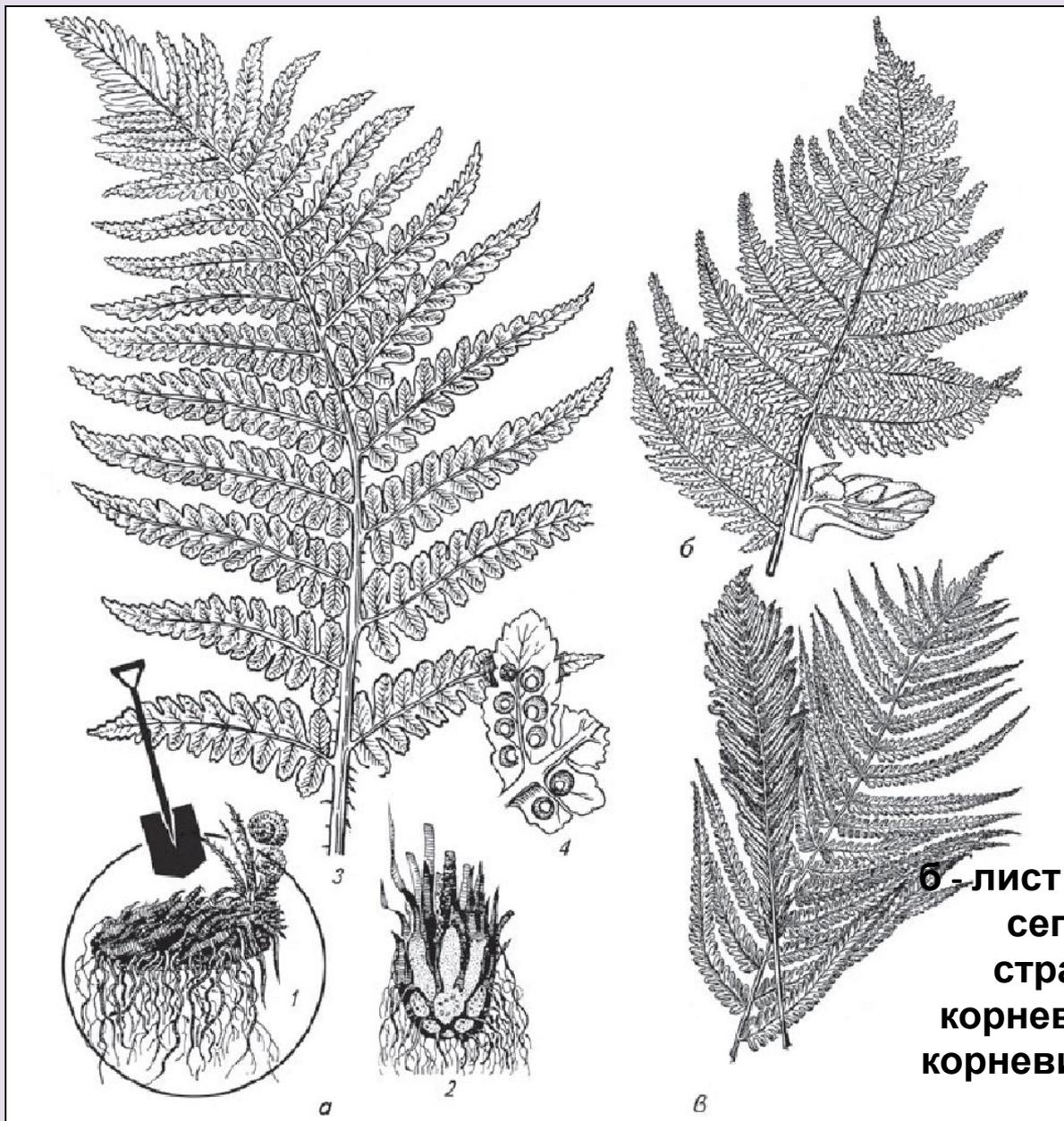
CH=CH—CH₂—O—Glc—Ara

розавин

Корневища и корни родиолы используют для получения жидкого экстракта, который применяют как стимулирующее и тонизирующее средство при функциональных заболеваниях центральной нервной системы, гипотонии, нервном и физическом истощении. Применяется в гомеопатии и БАДах.

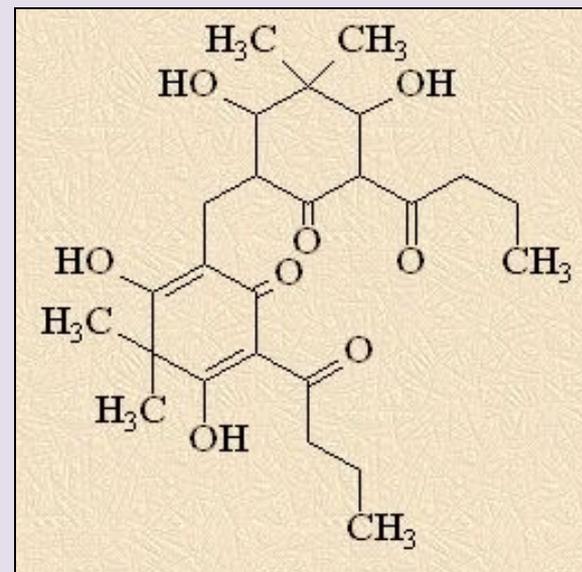
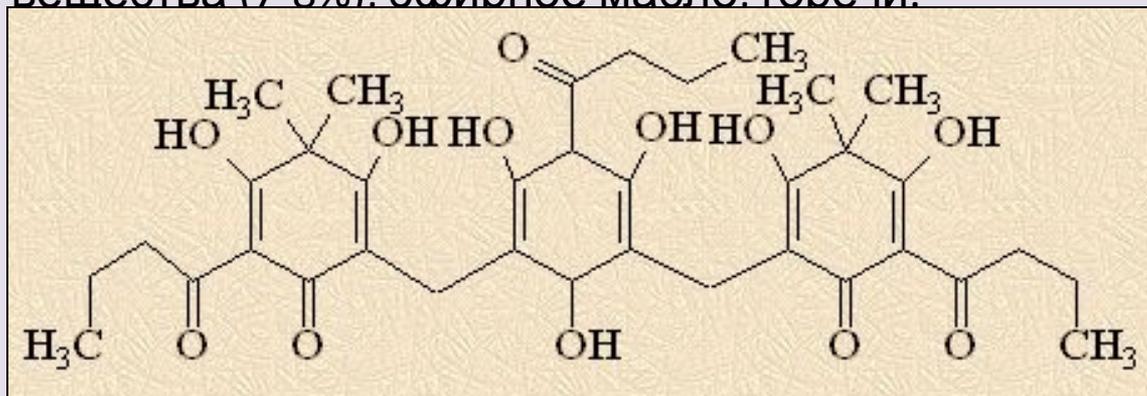
Dryopteris filix-mas -
Щитовник мужской
(папоротник мужской)
сем. Щитовниковые –
Dryopteridaceae
Filicis maris rhizomata -
Щитовника мужского корневища





Щитовник мужской (а):
б - лист кочедыжника женского и часть
сегмента I порядка; в - листья
страусника обыкновенного; 1 -
корневище; 2 -
корневище в разрезе; 3 - лист; 4 - часть
сегмента с сорусами

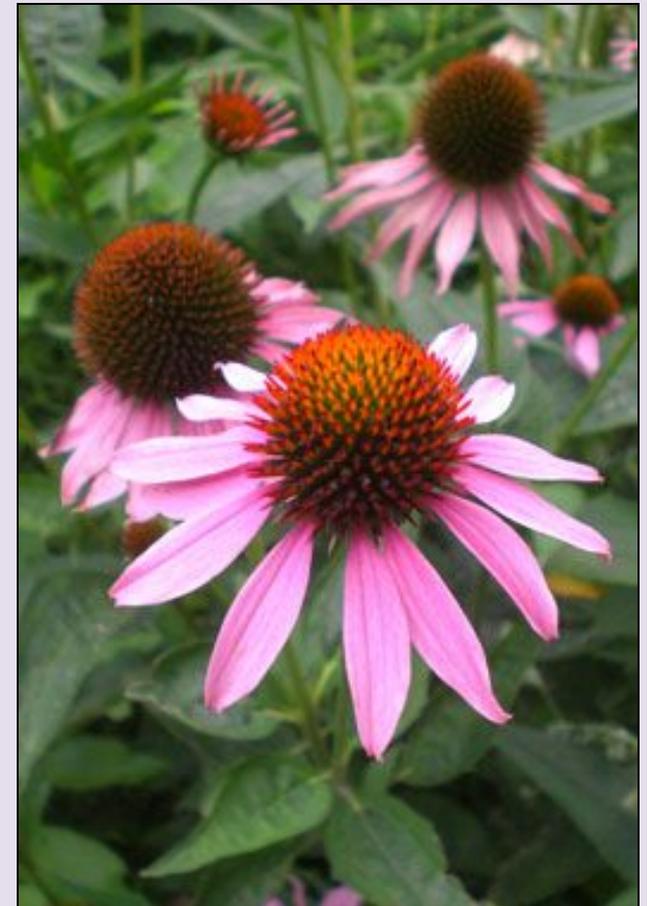
Химический состав. В корневищах щитовника содержатся фенольные соединения – флороглюциды (**филиксовая** и **флаваспидиновая** кислоты, **аспидинол**, **альбаспидин**), которые представляют собой моно-, ди- и тримерные производные флороглюцина. Кроме того, найдены дубильные вещества (7-8%), эфирное масло, горечи.



Корневище щитовника мужского используют для производства густого экстракта, который применяется в капсулах в качестве средства для изгнания ленточных глистов. Применяется в гомеопатии.

Echinacea purpurea - Эхинацея пурпурная
сем. Астровые – Asteraceae

Echinaceae purpureae herba - Эхинацеи пурпурной трава

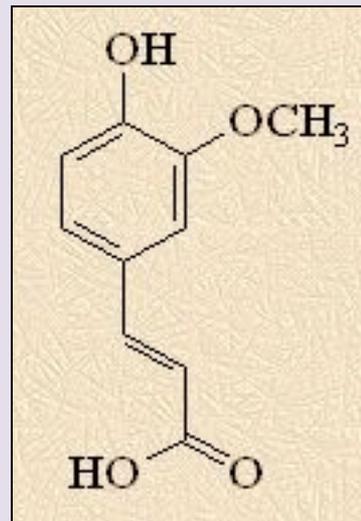


Трава эхинацеи содержит полисахариды, эфирное масло, флавоноиды, оксикоричные кислоты, дубильные вещества, сапонины, полиамиды, эхинацин (амид полиненасыщенной кислоты), ненасыщенный кетоспирт эхинолон, гликозид эхинакозид (при гидролизе расщепляющийся на пирокатехин, этанол, кофейную кислоты, две молекулы глюкоза и рамнозу), органические кислоты, смолы, фитостерины.

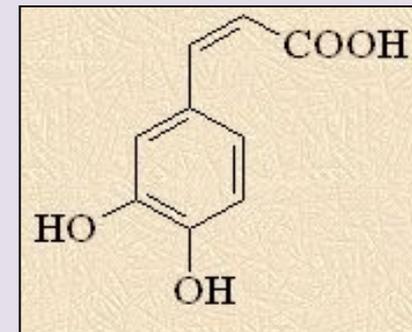
Подземные органы содержат до 6% инулина, эфирное масло, жирное масло, фенолкарбоновые кислоты, смолы, гликозид эхинакозид. Все растение богато ферментами, микро- и макроэлементами.

Измельченная трава эхинацеи пурпурной поступает на производство для изготовления препарата «**Эстифан**» (экстракт эхинацеи), применяемого как иммуностимулирующее средство.

Корневища с корнями свежие применялись ранее для получения спиртовой настойки, которая входила в комплексный препарат «**Ангиноль**» («**эхинор**»), использовавшегося как антисептическое средство.

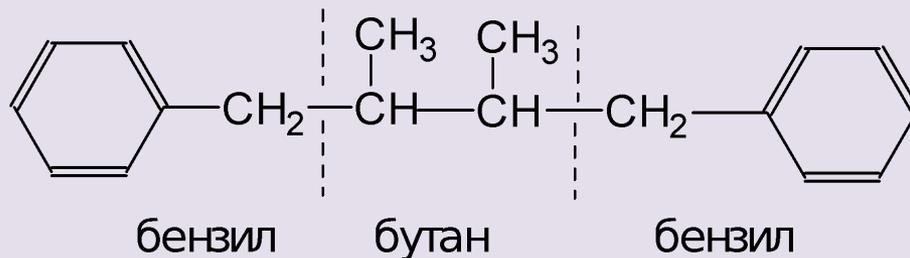
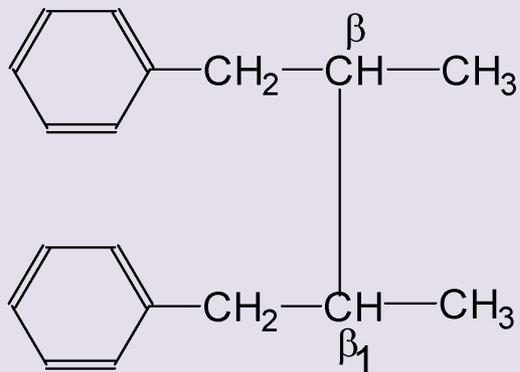


феруловая к-
та



кофейная к-
та

Лигнаны – природные фенольные соединения, димеры фенолпропана, связанные β , β' углеродными атомами боковых цепей.

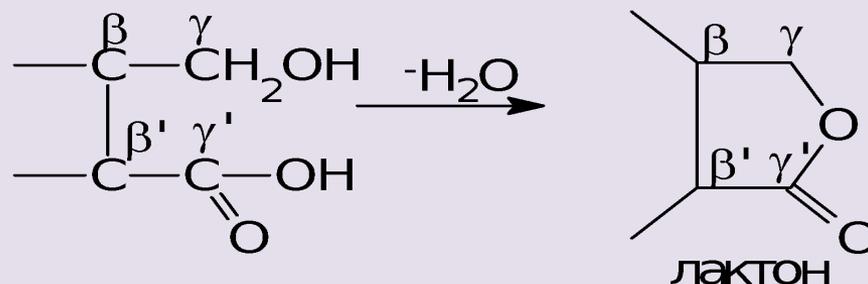
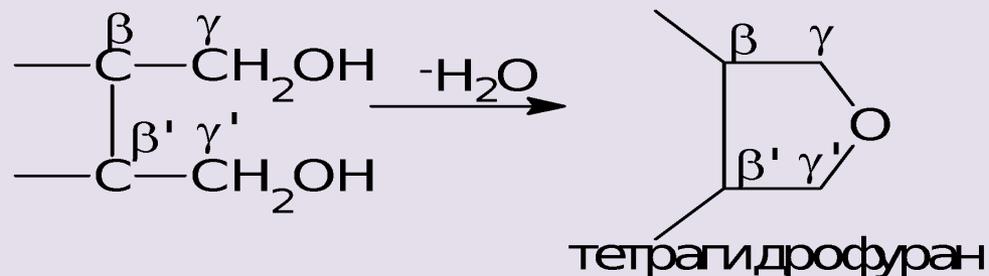


Исходными соединениями являются коричные спирты (но возможно, также, и коричные кислоты), такие, как п-кумаровый, конифероловый и синаповый спирты.



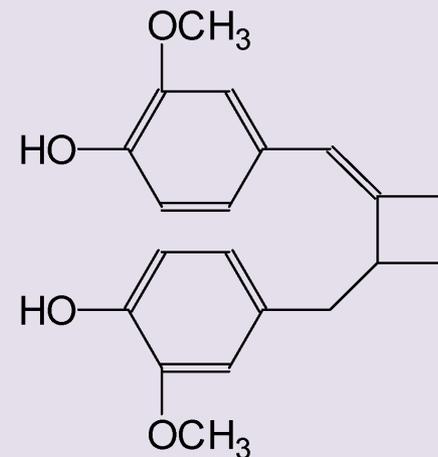
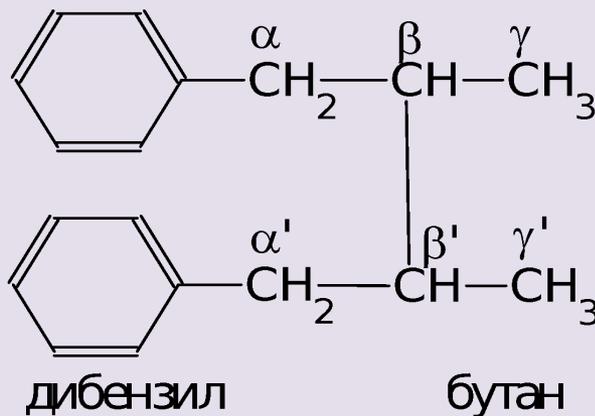
Разнообразие лигнанов обусловлено наличием различных заместителей в бензольных кольцах и характером связей между ними, а также степенью насыщенности боковых цепей и степенью их окисления. Наиболее часто в составе ароматических колец имеются гидроксильные, метоксилильные и метилendigидрокси группы.

При окислении углеродных атомов боковых цепей часто образуются оксидные и лактонные циклы.



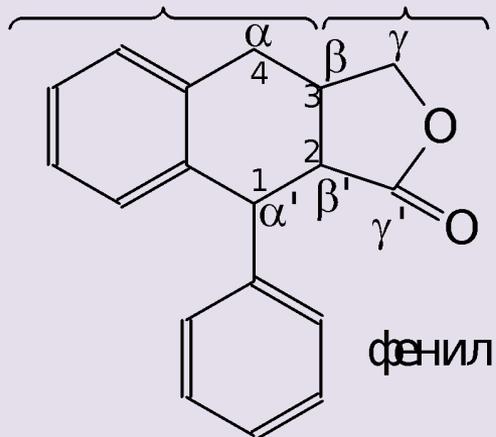
В настоящее время из разнообразных лигнанов можно выделить несколько типовых структур:

- Производные дибензилбутана (диарилбутановый тип) – это лигнаны гваяковой смолы, получаемой из гваякового дерева. Например, **гваяретовая кислота**.

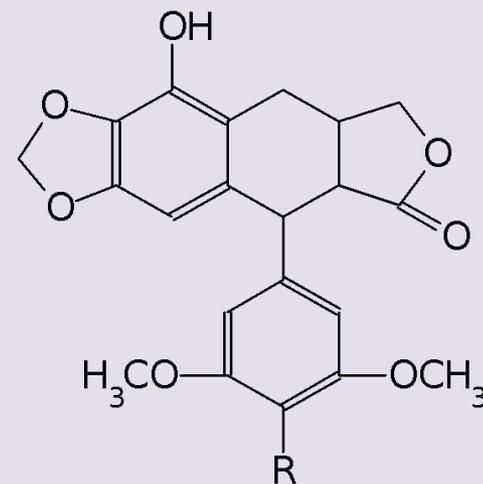


- Производные 1-фенилтетрагидронафталин-2,3-лактона (1-фенилтетрагидронафталиновый тип) – это лигнаны смолы, получаемой из подземных органов подофилла щитовидного и п. Эмоди, например, **подофиллотоксин**.

тетрагидронафталин бутиролактон

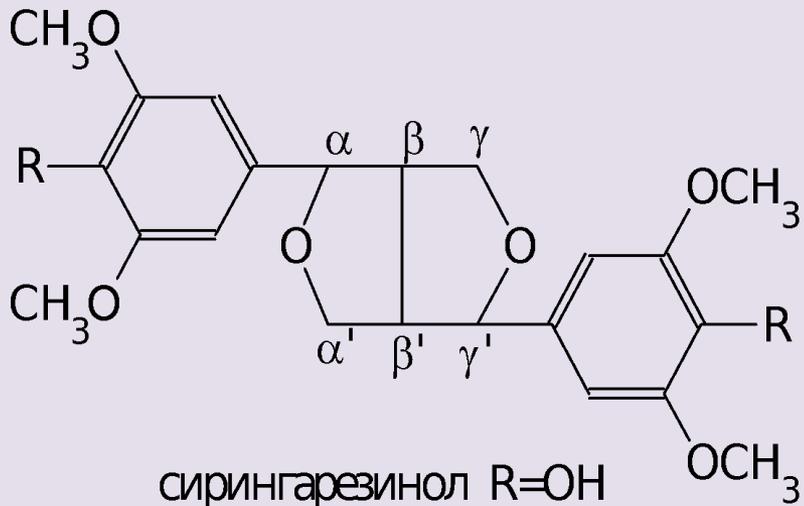
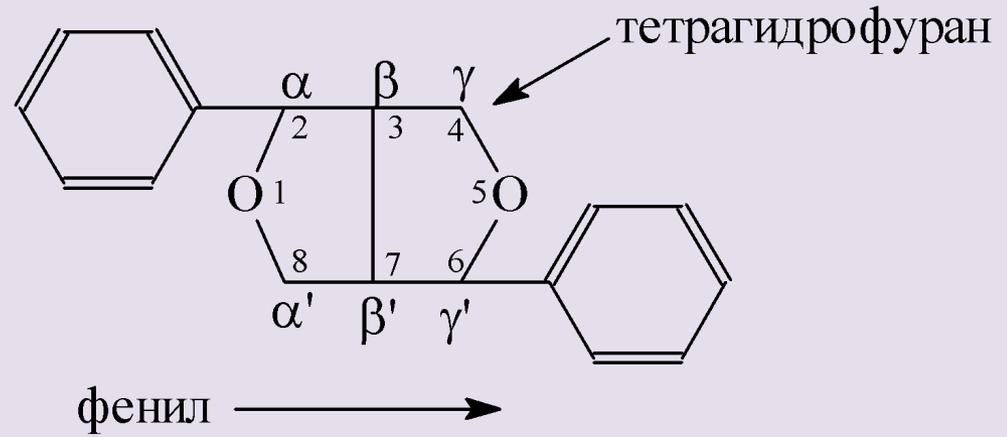


подофиллотоксин

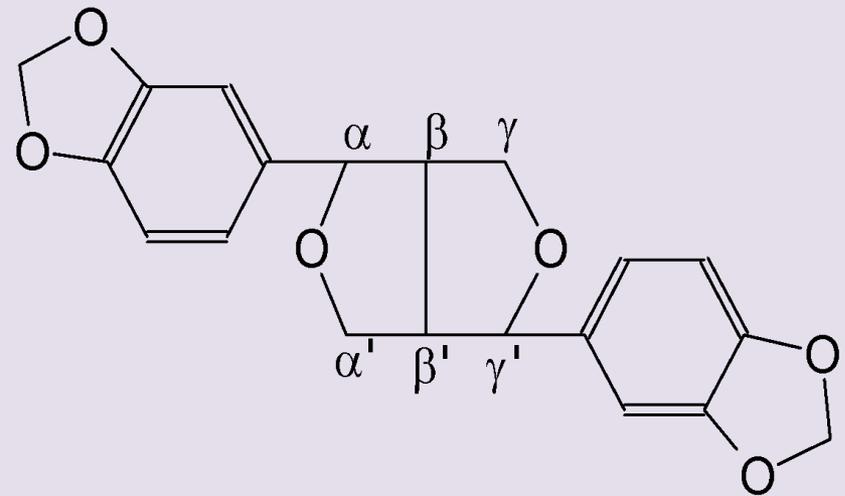


α -пельтатин R=OH
 β -пельтатин R=OCH₃

- Производные 2,6-дифенилтетрагидрофурана (циклогексалигнаны (сезаминовый тип)) – это **сирингарезинол** из корневищ и корней элеутерококка колючего и лигнан сезамин из семян кунжута индийского.



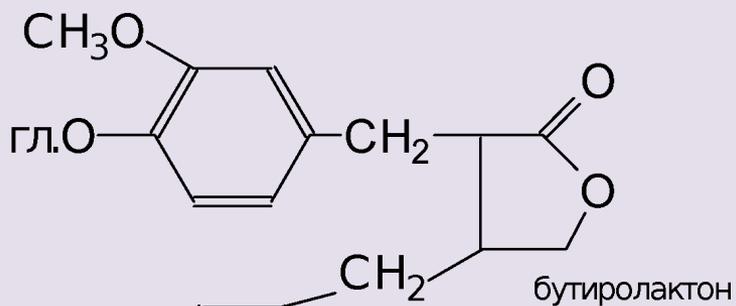
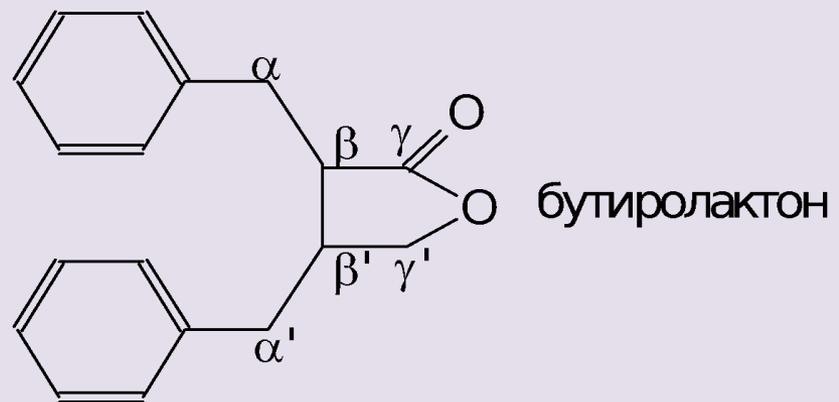
сирингарезинол R=OH
 элеутерозид E R=O-Glc



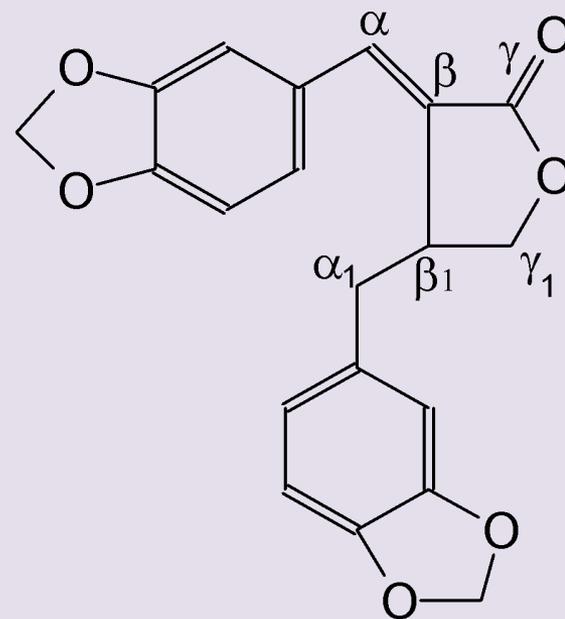
сезамин

• Производные дибензилбутиролактона

дибензил

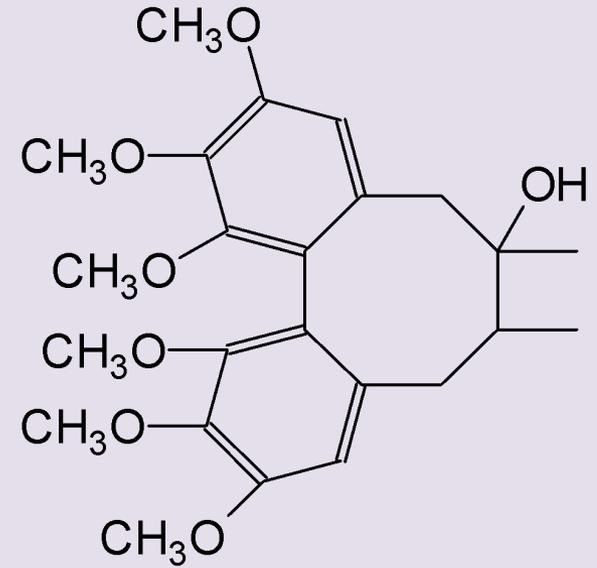
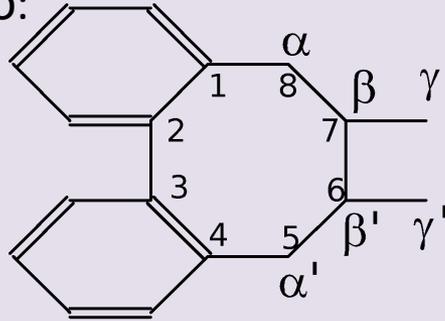


**Элеутерозид F
(арктиин)**

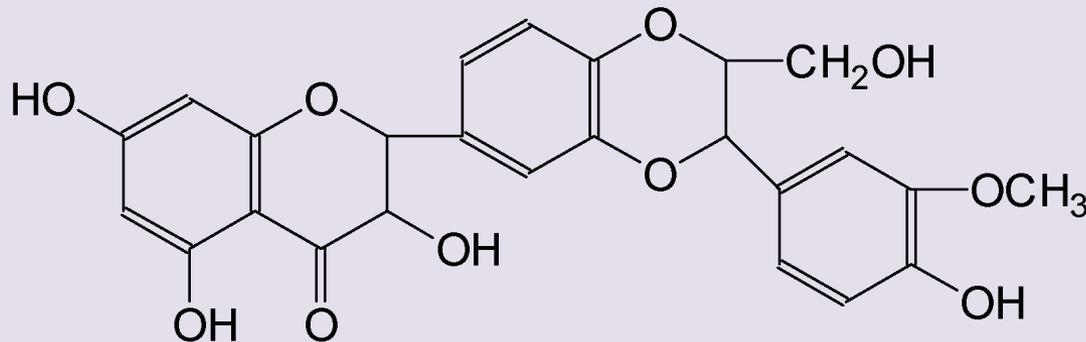


**Элеутерозид D
(савинин)**

- Производные дибензоциклооктадиена (циклоокталигнаны) – это **схизандрин** и схизандрол из плодов и семян лимонника китайского:



- Флаволигнаны**, имеют более сложную структуру и сочетают в себе свойства флавоноидов и лигнанов, например, **силибин**, силидианин и силихристин из плодов расторопши пятнистой.



Лигнаны представляют собой в большинстве твердые кристаллические вещества липофильной природы. В воде они не растворимы, их растворимость в спирте и хлороформе варьирует.

В растении они бывают растворены в эфирном или жирном масле и могут выпадать в виде «бусин» (лигнаны семян лимонника). В УФ-свете лигнаны флюоресцируют голубым или желтым цветом. Прочие свойства зависят от наличия тех или иных реакционных группировок.

Заготовка, сушка, хранение сырья.

Сроки сбора индивидуальны для каждого вида сырья. Корневища с корнями подофилла сушат при температуре не выше 40⁰, корневища и корни элеутерококка – при 70-80⁰. Хранят сырье по общему списку, сырье подофилла щитовидного по списку Б.

Многие лигнановые соединения обладают ценными фармакологическими свойствами.

Схизандрин, сирингарезинол и их производные обладают **стимулирующими и тонизирующими свойствами**. Лигнаны подофилла щитовидного, главным из которых является подофиллотоксин, оказывают влияние на деление клеток и обладают **цитостатической активностью**. Препарат «**Подофиллин**» нашел применение в качестве **противоопухолевого средства** при кандиломах наружно и при папилломатозе мочевого пузыря и гортани. Лигнаны кунжута обладают **антигеморрагическими свойствами**. Масляное извлечение из корней лопуха (репейное масло), в которое переходит лигнан артиин, **укрепляет корни волос**.

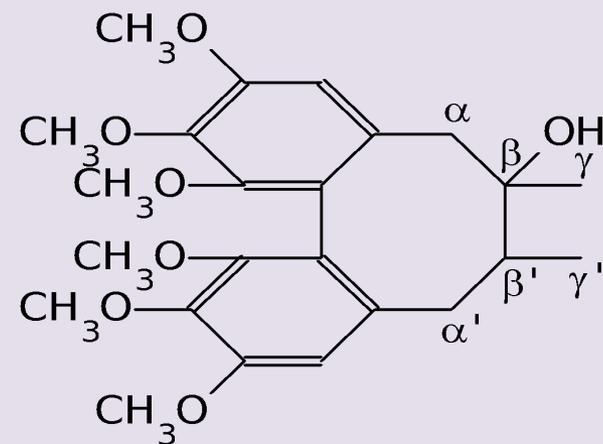
Флаволигнаны расторопши пятнистой оказывают **гепатозащитное действие** (препараты силибор, легалок, карсил).

***Schisandra chinensis* - Лимонник
китайский**

**сем. Лимонниковые - Schizandraceae
Schisandrae semina - Лимонника семена,
Schisandrae fructus - Лимонника плоды**



Во всех частях лимонника содержатся лигнаны: в околоплоднике и семенах – до 4-5%. Это **схизандрин**, **схизандрол**, **дезоксисхизандрин**; в плодах обнаружены лигнаны **гомизины**. Именно они и обуславливают лечебное действие растения. Плоды богаты органическими кислотами: лимонной (11%), яблочной (10%), винной, щавелевой, янтарной, аскорбиновой (до 500 мг%). Имеются сесквитерпеноиды, пектиновые вещества и сахара. В семенах содержатся эфирные масла (1,9-2,9%), сесквитерпеновые кетоны, витамин E, жирное масло (до 33%).



Схизандрин

Плоды и семена используют для получения настойки, которая применяется в качестве тонизирующего и стимулирующего центральную нервную систему средства. Плоды и семена оказывают общеукрепляющее действие на организм. Семена лимонника в виде порошка содержат больше лигнанов, чем настойка. Они широко применяются в народе как эффективное средство при гиперацидных гастритах (по 1 г 3 раза в день до еды), повышают также остроту зрения. Препараты лимонника противопоказаны при повышенной нервной возбудимости, бессоннице, повышенном артериальном давлении и нарушениях сердечной деятельности. Используются в составе БАД к пище, влияющих на функции ЦНС.

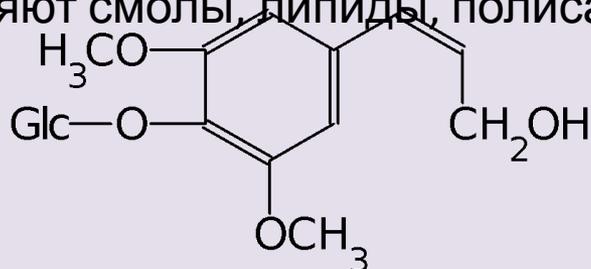
Eleutherococcus senticosus - Элеутерококк колючий

сем. Аралиевые – Araliaceae

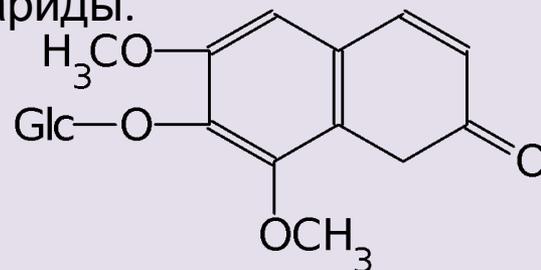
Eleutherococci rhizomata et radices - Элеутерококка колючего
корневища и корни



Биологически активные вещества корневищ и корней элеутерококка колючего можно разделить на несколько групп. В первую группу входят четыре стерина, в числе которых идентифицированы β -ситостерин, его гликозид даукостерин и тритерпеноиды. Вторая группа представлена веществами фенольной природы. Это ароматические спирты (в частности, моногликозид синапового спирта – элеутерозид В); кумарины (гликозид изофраксидина); лигнаны (арктиин, савинин и производное сирингарезинола – элеутерозид Е). Третью группу составляют смолы, липиды, полисахариды.



элеутерозид В
сирингин



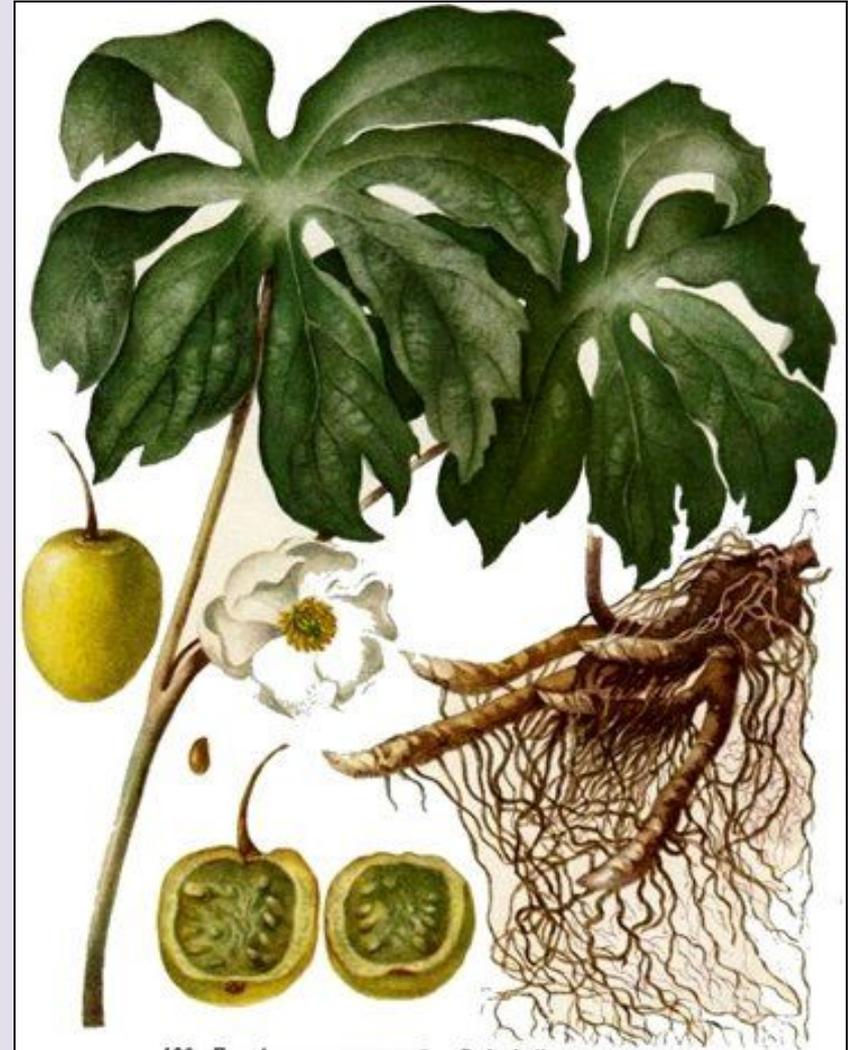
7 глюкозид
изофраксидина

Из сырья получают жидкий экстракт и сухой экстракт, который входит в состав таблеток, покрытых оболочкой. Все препараты обладают адаптогенным действием. Корневища и корни элеутерококка входят в состав сбора урологического (ВФС 42-2717-96). Элеутерозид В обладает противодиабетической активностью.

В качестве сырья предложены листья для получения жидкого экстракта, рекомендованного к применению при климактерическом синдроме, а также стебли, которые имеют аналогичный подземным органам состав элеутерозидов. Это сырье можно заготавливать не только осенью, но и зимой.

Используется в БАЛах к пище, влияющих на функции ЦНС.

Podophyllum peltatum - Подофилл щитовидный,
Podophyllum hexandrum - Подофилл шеститычинковый
сем. Барбарисовые – *Verberidaceae*
Podophylli rhizomata cum radicibus - Подофилла корневища с
корнями



Корневища с корнями подофилла содержат до 8% смолы – **подофиллина**, основными компонентами которого являются лигнановые агликоны **подофиллотоксин** (до 40%), пельтатины и флавоноиды. Найдены также гликозилированные производные подофиллотоксина и пельтатинов.



подофиллотоксин



α -пельтатин R=OH
 β -пельтатин R=OCH₃

Сырье используют для получения препарата «Подофиллин» (список А), который применяют наружно при кандиломах, а также в качестве вспомогательного средства при папилломатозе мочевого пузыря и гортани. Препарат обладает цитостатической активностью и блокирует митоз на стадии метафазы. Кроме того, оказывает сильное слабительное и желчегонное действие, однако в виду токсичности с такой целью не используется.

Подофилл щитовидный применяется в гомеопатии.

