

Abstract:

The synthesis of the medicinal heterocyclic compounds using microwave irradiation was studied of the heterocyclic naphthoquinones, which were divided into 2 parts. The first part was concentrated of the synthesis of the heterocyclic naphthoquinones fused with 5-7 membered rings and the second part was concentrated of the synthesis of the heterocyclic naphthoquinones fused with 3-4 membered rings. Firstly, various natural occurring naphthoquinones were prepared and used as starting materials. For the first part, nucleophilic substitution of the quinone rings with 1° and 2° amines using microwave irradiation gave the corresponding aminonaphthoquinone in high yields. Intramolecular cyclisation of aminonaphthoquinones using microwave irradiation also afford the heterocyclic 6- and 7-membered rings. For the second part, the 3-membered ring naphthoquinones were synthesised using epoxidation reaction. A selected number of novel heterocyclic compounds were evaluated for their antimicrobial activities. Most of the tested compounds showed weak antifungal activity against the fungal strain *Candida albicans* and all strains of bacteria at the maximum concentration (64 µg/mL).

บทคัดย่อ

229322

การสังเคราะห์สารวงวิวิธพันธ์ทางยาโดยใช้ไมโครเวฟ ได้ทำการศึกษาการเตรียมสารประกอบวงวิวิธพันธ์ของสารประกอบแนฟโทควิโนน โดยแบ่งการสังเคราะห์ออกเป็นสองกลุ่มใหญ่ คือ การสังเคราะห์สารประกอบวงวิวิธพันธ์ที่มีขนาดกลาง 5-7 เหลี่ยม และ การสังเคราะห์สารประกอบวงวิวิธพันธ์ที่มีขนาดเล็ก 3-4 เหลี่ยม โดยเริ่มการสังเคราะห์สารประกอบแนฟโทควิโนนที่พบในธรรมชาติเพื่อใช้เป็นสารตั้งต้น จากนั้นจึงทำการเติมนิวคลีโอไฟล์ได้แก่ เอมีนปฐมภูมิ และ ทูติยภูมิเข้าที่วงควิโนน โดยใช้ไมโครเวฟ ให้สารผลิตภัณฑ์ aminonaphthoquinone ในเปอร์เซ็นต์ผลผลิตสูง เมื่อทำการปิดวงของสารประกอบ aminonaphthoquinone โดยใช้ปฏิกิริยา intramolecular cyclisation โดยใช้คลื่นไมโครเวฟ ให้สารประกอบวงวิวิธพันธ์แนฟโทควิโนนที่มีขนาด 6-7 เหลี่ยม ส่วนการเตรียมสารประกอบวงวิวิธพันธ์ที่มีขนาดเล็กสาม-สี่เหลี่ยม เตรียมได้โดยทำปฏิกิริยาอีพอกซิเดชัน เกิดเป็นสารประกอบอีพอกไซด์ เมื่อสังเคราะห์สารประกอบวงวิวิธพันธ์ของแนฟโทควิโนนได้แล้ว จึงนำสารที่สังเคราะห์ได้ไปทดสอบฤทธิ์ทางชีวภาพกับเชื้อจุลชีพก่อโรค ผลการทดสอบพบว่า สารส่วนใหญ่มีฤทธิ์ในการยับยั้งเชื้อจุลชีพได้ค่อนข้างต่ำที่ความเข้มข้นสูงสุดที่ 64 µg/mL