

**ชื่อโครงการ** การสังเคราะห์และฤทธิ์ทางชีวภาพของอะมิโนสเตรอยด์  
**แหล่งเงิน** ประเภททุนงบประมาณ สถาบันเทคโนโลยีพระจอมเกล้าเจ้าคุณทหารลาดกระบัง  
ประจำปีงบประมาณ 2556  
จำนวนเงินที่ได้รับการสนับสนุน 250,000 บาท  
**ระยะเวลาทำการวิจัย** 1 ปี ตั้งแต่ 1 ตุลาคม 2556 ถึง 30 กันยายน 2557  
**หัวหน้าโครงการวิจัย** ผศ.ดร.พัชนี เจริญยิ่ง  
สาขาวิชาเคมี คณะวิทยาศาสตร์  
สถาบันเทคโนโลยีพระจอมเกล้าเจ้าคุณทหารลาดกระบัง

### บทคัดย่อ

งานวิจัยนี้เป็นการสังเคราะห์อะมิโนสเตรอยด์ชนิดใหม่ 58-67 จากเพรกนินโนโลน 1 โดยการปรับเปลี่ยนหมู่ฟังก์ชันที่วง A อะมิโนสเตรอยด์ 58-67 ถูกนำมาทดสอบฤทธิ์ต้านเชื้อจุลินทรีย์ก่อเกิดโรคต่อมนุษย์ในสถานะจำลอง จากการทดลองพบว่าอะมิโนสเตรอยด์ 58-67 ไม่มีฤทธิ์ต้านเชื้อจุลินทรีย์ทดสอบทั้งหมด อะมิโนสเตรอยด์ 58-67 ถูกนำมาทดสอบความเป็นพิษต่อเซลล์ไลน์ของมนุษย์ จากการทดลองพบว่า อะมิโนสเตรอยด์ 58, 59, 60, 61, 64, 65 และ 66 แสดงฤทธิ์ความเป็นพิษต่อเซลล์ไลน์ของมนุษย์ โดยเฉพาะในการศึกษานี้ อะมิโนสเตรอยด์ 64 มีฤทธิ์ความเป็นพิษต่อเซลล์มากที่สุด

นอกจากนั้น อนุพันธ์อะมิโนเอไมด์ 84-90 ถูกสังเคราะห์จากกรดคีโนโคลิก 7 และถูกนำมาประเมินฤทธิ์ต้านจุลินทรีย์ อนุพันธ์อะมิโนเอไมด์ 84-90 ถูกนำมาทดสอบฤทธิ์ต้านแบคทีเรีย 30 ชนิด ยีสต์ 3 ชนิด และ เชื้อรา 2 ชนิดด้วยวิธี disc diffusion จากการทดลองพบว่า อนุพันธ์อะมิโนเอไมด์ 84-90 มีฤทธิ์ต้านเชื้อแบคทีเรีย *Streptococcus milleri* group, *Streptococcus mutan*, *Staphylococcus coagulase negative*, *Corynebacterium diphtheriae* and Vancomycin Resistance *S. aureus* (VRSA) โดยมีค่า MIC อยู่ในช่วง 1.56-100 ไมโครกรัม/มิลลิลิตร แต่ อนุพันธ์อะมิโนเอไมด์ 84-90 ไม่มีฤทธิ์ในการต้านยีสต์และเชื้อราทดสอบทั้งหมด

**คำสำคัญ:** อะมิโนสเตรอยด์, ความเป็นพิษต่อเซลล์, ฤทธิ์ต้านจุลินทรีย์

**Research Title:** Synthesis and Bioactivities of Amino Steroids  
**Researcher:** Asst. Professor Dr. Patchanee Charoenying  
**Faculty:** Faculty of Science      **Department:** Department of Chemistry

## ABSTRACT

In this research, pregnenolone **1** was used as a starting template to develop new amino steroids. Ring-A modification of pregnenolone **1** resulted in the synthesis of amino derivatives **58-67**. These derivatives were evaluated for their *in vitro* antimicrobial properties against human pathogens. The results found that these derivatives did not show any significant activity against human pathogens. The amino steroids derivatives **58-67** were also tested for their cytotoxic activity against five human cell lines. The results of the *in vitro* study showed that amino steroids **58, 59, 60, 61, 64, 65** and **66** exhibited significant activity against all the cell lines and derivative **64** as the most active compounds in all derivatives of pregnenolone **1**.

Furthermore, a series of amino amides of chenodeoxycholic acid **84-90** were synthesized from chenodeoxycholic acid **7** and their antimicrobial activities were evaluated. The synthesized compounds were tested *in vitro* against 30 bacteria, 3 yeast and 2 fungi strains by disc diffusion method. All compounds exhibited the highest antibacterial activity against *Streptococcus milleri* group, *Streptococcus mutan*, *Staphylococcus coagulase negative*, *Corynebacterium diphtheriae* and Vancomycin Resistance *S. aureus* (VRSA). The MIC values of selected bacterial strains tested ranged from 1.56-100  $\mu\text{g/mL}$ . Unfortunately, no antifungal activity observed against tested strains of yeasts and fungi.

**Keywords:** amino steroids, cytotoxicity, antimicrobial