

บทคัดย่อ

อนุพันธ์ของสารคาร์สเตอรอล (13-15) ถูกสังเคราะห์ขึ้นโดยเปลี่ยนหมู่ฟังก์ชันไฮดรอกซีที่ตำแหน่ง C22 ไปเป็นหมู่ acetyl (13) หมู่ benzyl (14) และหมู่ benzoyl (15) สารเหล่านี้แสดงฤทธิ์ยับยั้งไลเปสด้วยค่าเปอร์เซ็นต์การยับยั้งไลเปส เท่ากับ $72.60 \pm 5.9\%$, $87.82 \pm 3.00\%$ และ $81.26 \pm 3.64\%$ ตามลำดับ ที่ความเข้มข้น 1.25 mg/ml ขณะที่สารคาร์สเตอรอลแสดงฤทธิ์ยับยั้งไลเปสด้วยค่าเปอร์เซ็นต์การยับยั้งไลเปส เท่ากับ $62.3 \pm 6.2\%$ ที่ความเข้มข้นเดียวกัน นอกจากนี้ยังทดสอบฤทธิ์ยับยั้งไลเปสของสารที่มีโครงสร้างหลักคล้ายคาร์สเตอรอล ได้แก่ stigmasterol, β -sitosterol, campesterol และ cholesterol พบว่าสารทั้งสี่มีฤทธิ์ยับยั้งไลเปสน้อยกว่าสารคาร์สเตอรอล อนุพันธ์ของ stigmasterol and cholesterol ถูกสังเคราะห์โดยการเปลี่ยนหมู่ไฮดรอกซีที่ตำแหน่ง C3 เป็นหมู่ acetyl (7 และ 10), หมู่ benzyl (8 และ 11) และหมู่ benzoyl (9 และ 12) ตามลำดับ อนุพันธ์ที่สังเคราะห์ได้ทั้งหมด 7-12 แสดงฤทธิ์ยับยั้งไลเปสที่มากกว่าสาร stigmasterol และ cholesterol การแทนที่ด้วยหมู่ acetyl หมู่ benzyl และหมู่ benzoyl ที่ตำแหน่ง C3 และ C22 ทำให้สารมีความสามารถยับยั้งการทำงานของเอนไซม์ไลเปสได้สูงขึ้น

Abstract

Derivatives of carpesterol (**13-15**) were synthesized by converting hydroxyl group at C22 to acetyl group (**13**), benzyl group (**14**) and benzoyl group (**15**). They exhibited lipase inhibition activity with %inhibition of lipase as $72.60 \pm 5.9\%$, $87.82 \pm 3.00\%$ and $81.26 \pm 3.64\%$, respectively at concentration of 1.25 mg/ml while %inhibition of lipase of carpesterol was $62.3 \pm 6.2\%$ at same concentration. Moreover, stigmasterol, β -sitosterol, campesterol and cholesterol were also evaluated for this activity, but they showed weaker lipase inhibition activity than carpesterol. Derivatives of stigmasterol and cholesterol were synthesized by converting hydroxyl group at C3 to acetyl group (**7** and **10**), benzyl group (**8** and **11**), and benzoyl group (**9** and **12**), respectively. All synthesized compounds **7-12** exhibited stronger lipase inhibition activity than stigmasterol and cholesterol. Substitution of acetyl group, benzyl group and benzoyl group on C3 and C22 had ability to induce lipase inhibition activity of studied compounds.