

Abstract

Project Code : MRG4980018

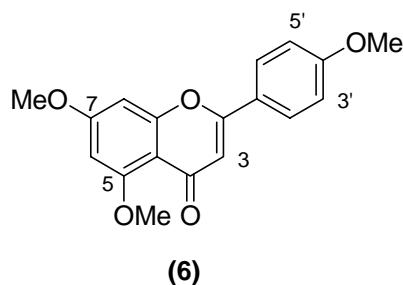
Project Title : Acetylcholinesterase inhibition compounds from *Kaempferia parviflora*

Investigator : Pattara Sawasdee

E-mail address: p_tiew@hotmail.com

Project period: 1 July 2006 - 30 June 2008

According to the extracts of *Kaempferia parviflora* showed the potent acetylcholinesterase inhibitory activity, they were separated and purified to obtain the active constituents by chromatography techniques. Three flavones were afforded from the hexane extract and additional eleven flavones were isolated from the dichloromethane extract. Their structures were completely elucidated based on NMR analysis and compared with literature reports. Moreover, five unnatural flavones were synthesized to investigate the structural activity relationship (SAR) of acetylcholinesterase (AChE) inhibitory activity. The results of AChE inhibition examination showed that compound **6**, 5,7,4'-trimethoxyflavone, had the highest activity (56% inhibition) at concentration 1 mg/mL. It was observed that compounds bearing the 5,7,4'-trimethoxy groups and a free methoxy group at C-3 had a significant inhibitory effect in the concentration tested, but bearing a 5-hydroxyl group reduced the inhibitory potency. On the other hand, flavones bearing a 3'-methoxy or 5'-methoxy did not influence the inhibitory effect.



(6)

Keywords: *Kaempferia parviflora*, flavones, acetylcholinesterase

บทคัดย่อ

รหัสโครงการ : MRG4980018

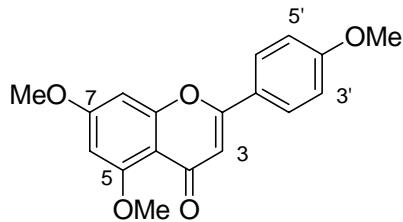
ชื่อโครงการ : สารออกฤทธิ์ยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเตอเรสจากกระชายดำ

ชื่อนักวิจัย : อาจารย์ ดร. พัฒนา สวัสดิ์

E-mail address: p_tiew@hotmail.com

ระยะเวลาโครงการ : 1 กรกฎาคม 2549 – 30 มิถุนายน 2551

สิ่งสกัดจากกระชายดำให้ฤทธิ์ยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเตอเรสที่นำสู่การดึงน้ำในตัวเอง ดังนั้นจึงได้ทำการแยกและทำให้บริสุทธิ์เพื่อหารายการออกฤทธิ์โดยใช้เทคนิคทางโคมาราฟี สามารถแยกสารฟลาโวนได้ 3 ชนิดจากสิ่งสกัดเอกซ์ tract และอีก 11 ชนิดจากสิ่งสกัดได้คลอโรเมทีน วิเคราะห์และพิสูจน์สูตรโครงสร้างของสารด้วยเทคนิคทางเอ็นเอ็มอาร์และเทียบกับเอกสารอ้างอิง นอกจากนี้ยังได้สังเคราะห์ฟลาโวนที่ไม่พบในธรรมชาติอีก 5 ชนิดเพื่อใช้ในการหาความสัมพันธ์ระหว่างสูตรโครงสร้างและฤทธิ์ยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเตอเรส ผลการทดสอบฤทธิ์ดังกล่าวพบว่า สาร (6) คือ 5,7,4'- trimethoxyflavon ให้ฤทธิ์สูงที่สุด (ยับยั้งได้ 56%) ที่ความเข้มข้น 1 มิลลิกรัม/มิลลิลิตร มีข้อสังเกตว่าสารที่มีหมู่เมทอกซีที่ตำแหน่ง 5, 7 และ 4' โดยที่ไม่มีหมู่เมทอกซีที่ตำแหน่งที่ 3 จะมีฤทธิ์การยับยั้งที่ดี แต่ถ้ามีหมู่ไฮดรอฟฟิลิกซีที่ตำแหน่งที่ 5 จะทำให้ฤทธิ์ลดลง ในทางกลับกัน ฟลาโวนที่มีหมู่เมทอกซีที่ตำแหน่งที่ 3' หรือ 5' จะไม่มีผลต่อฤทธิ์ดังกล่าวเลย



(6)

คำหลัก: กระชายดำ, ฟลาโวน, อะเซทิลโคลีนเอสเตอเรส