

บทคัดย่อ

งานวิจัยนี้ เป็นการออกแบบและสังเคราะห์อนุพันธ์ 2-(2-oxo-2H-chromen-4-yl)acetamide และทำการประเมินฤทธิ์ในการยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเทอเรสชนิดใหม่จำนวน 14 ชนิด (สารหมายเลข I, VII – XVIII) สารที่สังเคราะห์ได้แสดงฤทธิ์ที่แรงในการยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเทอเรส สารที่มีฤทธิ์แรงที่สุด ได้แก่ สารหมายเลข XIV ($IC_{50} = 1.20 \pm 0.03 \mu M$) ซึ่งแสดงฤทธิ์ใกล้เคียงกับยา Galantamine ($IC_{50} = 0.75 \pm 0.03 \mu M$) จากการศึกษาจลนศาสตร์ในการยับยั้งเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเทอเรส พบว่า สารหมายเลข XIV ยับยั้งเอนไซม์แบบไม่แข่งขันและจากการศึกษา molecular docking พบว่า สารหมายเลข XIV เกิดอันตรกิริยากับเอนไซม์อะเซทิลโคลีนเอสเทอเรสทั้งในส่วน Catalytic anionic site และ Peripheral anionic site แต่ด้วย affinity ที่ต่ำกว่ายา Donepezil