

ฤทธิ์ต้านอนุมูลอิสระของอนุพันธ์ไพรีดิโนน

นางสาวกฤติยา สุระอมรรัตน์
นางสาวยุพาพร รุ่งทาบนภา

โครงการพิเศษนี้เป็นส่วนหนึ่งของการศึกษาตามหลักสูตร
ปริญญาเภสัชศาสตรบัณฑิต
คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล
พ.ศ. 2546

Tyrosinase inhibitory activity of pyridinone derivatives

MISS KRITIYA SURAMORNROT
MISS YUPHAPORN RUNGTHAPNAPHA

A SPECIAL PROJECT SUBMITTED IN PARTIAL FULFILMENT
OF THE REQUIREMENT FOR
THE BACHELOR DEGREE OF SCIENCE IN PHARMACY
FACULTY OF PHARMACY
MAHIDOL UNIVERSITY

2003

โครงการพิเศษ
เรื่อง ฤทธิ์ต้านอนุมูลอิสระของอนุพันธ์ไพรีดีโนน

.....
(นางสาวกฤติยา สุระมรรตน์)

.....
(นางสาวยุพาพร รุ่งทาบนภา)

.....
(รศ.ดร.จิตต์กวี ปวโร)
อาจารย์ที่ปรึกษา

.....
(ผศ.ดร.พรรณวิภา กฤษฎาพงษ์)
อาจารย์ที่ปรึกษาร่วม

บทคัดย่อ

ฤทธิ์ต้านเอนไซม์ไทโรซิเนสของอนุพันธ์ไพริดิโนน

กฤติยา สุรอมรรตน์, ยุพาพร รุ่งทาบนา

อาจารย์ที่ปรึกษา : จิตต์กวี ปวโร*, พรรณวิภา กฤษฎาพงษ์**

*ภาควิชาเภสัชเคมี คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

**ภาควิชาเภสัชกรรม คณะเภสัชศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล

คำสำคัญ : กรดโคจิก, อนุพันธ์ N-methyl of kojic acid, อนุพันธ์ N-ethyl of kojic acid, อนุพันธ์ N-methyl of maltol, อนุพันธ์ N-ethyl of maltol, ฤทธิ์ต้านเอนไซม์ไทโรซิเนส

กระบวนการเกิดสีผิวถูกยับยั้งโดยสารยับยั้งเอนไซม์ไทโรซิเนส เช่น กรดโคจิก ซึ่งเป็นสารฟอกสีผิวที่นิยมในปัจจุบัน มีกลไกการยับยั้งการสร้างเมลานินโดยเกิดสารเชิงซ้อนกับคอปเปอร์ที่มีอยู่ในเอนไซม์ไทโรซิเนส โครงการพิเศษนี้จึงได้สังเคราะห์อนุพันธ์ N-methyl และ N-ethyl of kojic acid และอนุพันธ์ N-methyl และ N-ethyl of maltol ปริมาณสารที่สังเคราะห์ได้เท่ากับร้อยละ 12.41, 19.02, 26.14 และ 32.84 ตามลำดับ และพิสูจน์สูตรโครงสร้างทางเคมีโดยวิธีทางสเปกโตรสโคปี ทดสอบฤทธิ์ต้านเอนไซม์ไทโรซิเนสเปรียบเทียบกับกรดโคจิกที่ความเข้มข้น 10, 20, 30, 40, 50, 70, 100 และ 150 ไมโครโมลาร์ โดยวิธีโดปาโครม ใช้ microplate reader (Molecular device) วัดค่าการดูดกลืนแสงที่ความยาวคลื่น 490 นาโนเมตร จากกราฟแสดงความสัมพันธ์ระหว่างความเข้มข้น (ไมโครโมลาร์) และเปอร์เซ็นต์การต้านเอนไซม์ไทโรซิเนส สรุปได้ว่าฤทธิ์ต้านเอนไซม์ไทโรซิเนสของอนุพันธ์ N-methyl of kojic acid (IC_{50} = 15.32 ไมโครโมลาร์) และอนุพันธ์ N-ethyl of maltol (IC_{50} = 34.61 ไมโครโมลาร์) ดีกว่ากรดโคจิก (IC_{50} = 40.51 ไมโครโมลาร์)

Abstract

Tyrosinase inhibitory activity of pyridinone derivatives

Kritiya Suraamornrat, Yuphaporn Rungthabnapha

Project advisor : Chitkavee Pavaro*, Panvipa Krisadaphong**

* Department of Pharmaceutical Chemistry, Faculty of Pharmacy, Mahidol University

** Department of Pharmacy, Faculty of Pharmacy, Mahidol University

Keyword : kojic acid, N-methyl derivative of kojic acid, N-ethyl derivative of kojic acid, N-methyl derivative of maltol, N-ethyl derivative of maltol, tyrosinase inhibitor

Melanogenesis can be suppressed by tyrosinase inhibitor. Pyridinone derivatives were explored that have pharmacophore similar to kojic acid, currently used as whitening agents. Mechanism of inhibiting melanogenesis can be achieved by forming complex with copper in tyrosinase. Thus this special project was aimed to synthesize pyridinone derivatives such as N-methyl and N-ethyl derivatives of kojic acid and maltol. Yield of four synthesized compounds were obtained 12.41, 19.02, 26.14 and 32.84% respectively. The structures were identified by spectroscopic methods and compared the tyrosinase inhibitory activity with kojic acid in various concentrations (10, 20, 30, 40, 50, 70, 100 and 150 μM) by dopachrome method, using a microplate reader (Molecular device) at 490 nm as the detector. The graph was plotted between the concentration (μM) and percent tyrosinase inhibition. From the data, we can conclude that the N-methyl derivative of kojic acid (IC_{50} = 15.32 μM) and the N-ethyl derivative of maltol (IC_{50} = 34.61 μM) exhibited stronger tyrosinase inhibitory activity than kojic acid (IC_{50} = 40.51 μM).