

ผลงานวิจัยดีเด่นของ มหาวิทยาลัยมหิดล



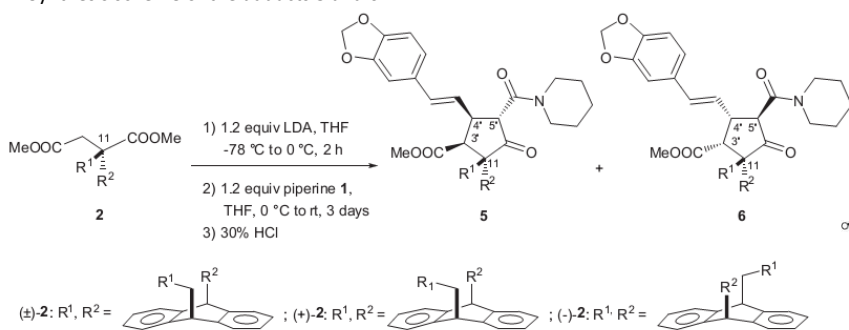
มหาวิทยาลัยมหิดล
กรุงเทพฯ@แผ่นดิน

งานสารสนเทศงานวิจัย กองบริหารงานวิจัย
สำนักงานอธิการบดีมหาวิทยาลัยมหิดล
โทร. 02-849-6241-6 โทรสาร 02-849-6247
E-mail : dircopra@mahidol.ac.th

Synthesis of racemic and optically active forms of novel antimalarial agents, spirocyclopentanone–anthracene adducts, via tandem Michael addition–Dieckmann condensation reactions as the key steps

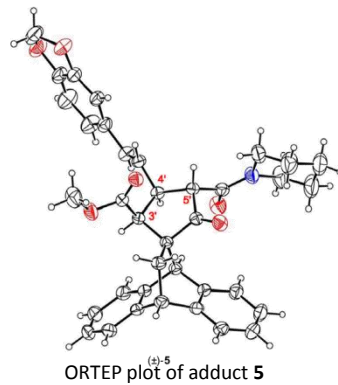
สารออกฤทธิ์จำเพาะต่อเชื้อมาลาเรียชนิดใหม่จากการทำปฏิกิริยา tandem Michael addition–Dieckmann condensation ระหว่างอนุพันธ์ของ anthracene และ piperine ได้เป็นSpirocyclopentanone–anthracene โดยสารผลิตภัณฑ์ที่ได้มีทั้งแบบที่เป็น racemic และ optically active ของdimethyl itaconate–anthracene สารที่สังเคราะห์ได้มีฤทธิ์ antimalarial activity IC_{50} values = 3.4–4.7 $\mu\text{g/mL}$ โดยไม่มีความเป็นพิษต่อ verocells

Synthesis scheme of the adducts 5 and 6.



Biological Activities of adducts 5 and 6

Compounds	IC_{50} ($\mu\text{g/mL}$)	
	Antimalarial activity ^{a,b}	Cytotoxicity ^{a,c} (vero cells)
Piperine 1	Inactive	Non-cytotoxic
(±)- 5	4.7	Non-cytotoxic
(±)- 6	3.4	Non-cytotoxic
(-)- 5	4.3	Non-cytotoxic
(-)- 6	3.6	Non-cytotoxic
(+)- 5	4.0	Non-cytotoxic
(+)- 6	4.5	Non-cytotoxic



Ruangrat Choommongkol, Rattana Jongkol, Samran Prabpai, Palangpon Kongsaree, Puttinan Meepowpan. Synthesis of racemic and optically active forms of novel antimalarial agents, spirocyclopentanone–anthracene adducts, via tandem Michael addition–Dieckmann condensation reactions as the key steps. *Tetrahedron:Asymmetry* 23 (2012) 357–363.

ติดต่อรายละเอียดเพิ่มเติม



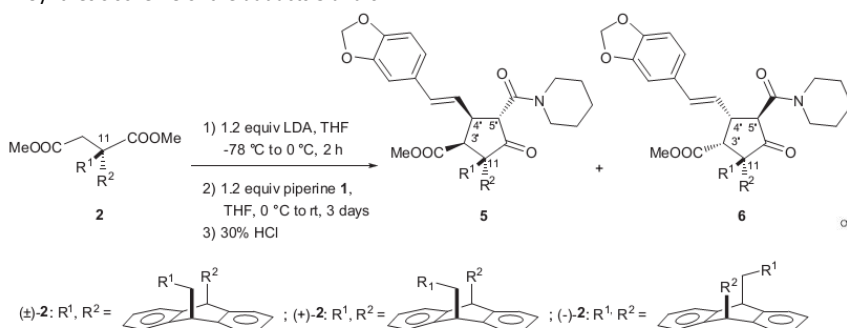
หัวหน้าโครงการ : รศ.ดร.พลังพล คงเสรี
ที่อยู่ : ภาควิชาเคมีและหน่วยวิจัยโครงสร้างและการทำงาน
ของโปรตีน คณะวิทยาศาสตร์ มหาวิทยาลัยมหิดล
โทร : 0-22015190
E-mail : scpks@mahidol.ac.th

Research Management and Development
Office of the President
Tel : 02-849-6241-6 Fax : 02-849-6247
E-mail : dircopra@mahidol.ac.th

Synthesis of racemic and optically active forms of novel antimalarial agents, spirocyclopentanone–anthracene adducts, via tandem Michael addition–Dieckmann condensation reactions as the key steps

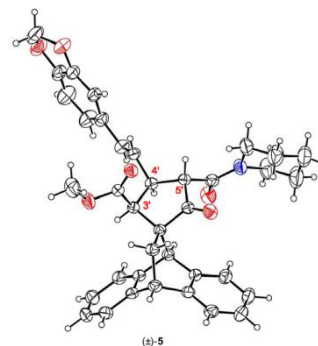
Spirocyclopentanone–anthracene adducts, novel antimalarial agents, have been synthesized by employing the racemic and the optically active dimethyl itaconate–anthracene adducts in a reaction with piperine via tandem Michael addition–Dieckmann condensation reactions as the key steps. All adducts exhibited antimalarial activity with IC_{50} values of 3.4–4.7 $\mu\text{g}/\text{mL}$, and importantly displayed non-cytotoxicity to verocells

Synthesis scheme of the adducts 5 and 6.



Biological Activities of adducts 5 and 6

Compounds	IC_{50} ($\mu\text{g}/\text{mL}$)	
	Antimalarial activity ^{a,b}	Cytotoxicity ^{a,c} (vero cells)
Piperine 1	Inactive	Non-cytotoxic
$(\pm)\text{-}5$	4.7	Non-cytotoxic
$(\pm)\text{-}6$	3.4	Non-cytotoxic
$(-)\text{-}5$	4.3	Non-cytotoxic
$(-)\text{-}6$	3.6	Non-cytotoxic
$(+)\text{-}5$	4.0	Non-cytotoxic
$(+)\text{-}6$	4.5	Non-cytotoxic



ORTEP plot of adduct 5

Ruangrat Choommongkol, Rattana Jongkol, Samran Prabpai, Palangpon Kongsaree, Puttinan Meepowpan. Synthesis of racemic and optically active forms of novel antimalarial agents, spirocyclopentanone–anthracene adducts, via tandem Michael addition–Dieckmann condensation reactions as the key steps. *Tetrahedron:Asymmetry* 23 (2012) 357–363.



Name (PI)
Address

Tel
E-mail

For More Information

: Assoc. Prof. Palangpon Kongsaree
: Department of Chemistry and Center for
Protein Structure and Function
Faculty of Science, Mahidol University
: 0-2201-5190
: scpks@mahidol.ac.th