

TỔNG HỢP CÁC DẪN XUẤT DIARYL ETHER CỦA OSTRUTHIN VÀ ĐÁNH GIÁ HOẠT TÍNH ỨC CHẾ ENZYME α -GLUCOSIDASE

*Nguyễn Trí Tuệ¹, Phan Nguyễn Hữu Trọng¹, Đặng Hoàng Phú¹,
Nguyễn Trung Nhân¹*

¹Khoa Hoá học, Trường Đại học Khoa học Tự Nhiên, ĐHQG-HCM
trituelhp@gmail.com, pnhtrong@hcmus.edu.vn, dhphu@hcmus.edu.vn,
ntnhan@hcmus.edu.vn

Tóm tắt

Ostruthin là hợp chất thể hiện nhiều hoạt tính sinh học và là hợp chất chính trong cây Xáo tam phân (*Paramignya trimeria*). Tuy nhiên, chưa có nghiên cứu nào chứng minh khả năng ức chế enzyme α -glucosidase của ostruthin và các dẫn xuất. Trong số các dẫn xuất đã được biết đến, dẫn xuất diaryl ether thể hiện rất nhiều hoạt tính sinh học. Do đó, nghiên cứu này tập trung vào việc tổng hợp các dẫn xuất diaryl ether của ostruthin bằng phản ứng ghép cặp Chan–Lam và Buchwald–Hartwig. Các điều kiện phản ứng như xúc tác, dung môi, base, và khí quyển đã được tối ưu nhằm thu được sáu hợp chất mới (**TUE1–6**). Hoạt tính ức chế enzyme α -glucosidase của các hợp chất đã được đánh giá. Tất cả các hợp chất đều thể hiện hoạt tính ức chế với giá trị $IC_{50} \leq 100 \mu\text{M}$. Hợp chất **TUE6** thể hiện hoạt tính mạnh nhất với giá trị $IC_{50} = 33.9 \mu\text{M}$, so với chất đối chứng dương acarbose ($IC_{50} = 214.5 \mu\text{M}$).

Từ khóa: Ostruthin, *Paramignya trimeria*, dẫn xuất diaryl ether, ức chế enzyme α -glucosidase

SYNTHESIS OF DIARYL ETHER DERIVATIVES OF OSTRUTHIN AND EVALUATION OF THEIR α -GLUCOSIDASE INHIBITORY ACTIVITY

*Tue Tri Nguyen*¹, *Trong Huu Nguyen Phan*¹, *Phu Hoang Dang*¹,
*Nhan Trung Nguyen*¹

¹Faculty of Chemistry, VNUHCM-University of Science
trituelhp@gmail.com, pnhtrong@hcmus.edu.vn, dhphu@hcmus.edu.vn,
ntnhan@hcmus.edu.vn

Abstract

Ostruthin is the major compounds in Xao tam phan (*Paramignya trimera*) that has many biological activities. However, there are no research on the α -glucosidase inhibition of ostruthin and its derivatives. Among the known derivatives, the diaryl ether derivatives showed many biological activities. Thus, this study focused on the synthesis of diaryl ether derivatives of ostruthin by Chan–Lam and Buchwald–Hartwig coupling reactions. The reaction conditions such as catalysts, solvents, bases, and atmospheres were optimized to obtain six new diaryl ether compounds (TUE1–6). Moreover, their α -glucosidase inhibitory activities were evaluated. All compounds showed inhibitory activity with the IC₅₀ values \leq 100 μ M. Compound TUE6 showed the most potent activity with an IC₅₀ value of 33.9 μ M, which was comparable with the positive control acarbose (IC₅₀ value of 214.5 μ M).

Keywords: Ostruthin, *Paramignya trimera*, diaryl ether derivatives, α -glucosidase inhibitory