

สำเนียง อภิสันติยาคม : การแยกและการวิเคราะห์ส่วนประกอบทางเคมีของสารที่ออกฤทธิ์ทางชีวภาพจากรากต้นชงโโค (*Bauhinia saccocalyx* Pierre) และต้นกันเกรา (*Fagraea fragrans* Roxb.) (IDENTIFICATION OF BIOACTIVE CHEMICAL CONSTITUENTS OF THE ROOTS OF BAUHINIA SACCOCALYX PIERRE AND FAGRAEA FRAGRANS ROXB.) อาจารย์ที่ปรึกษา: ผู้ช่วยศาสตราจารย์ ดร.ธนพร แม่น้ำ, 175 หน้า. ISBN 974-533-373-5

การแยกสารจากรากต้นชงโโค (*Bauhinia saccocalyx* Pierre) สามารถแยกสารจำพวกใบเบนซิลซึ่งเป็นสารใหม่ได้ 4 ชนิด คือ บัวขินอลเอ-ดี (**I-IV**) และสารที่มีการรายงานแล้ว 4 ชนิด ได้แก่ ใบเบนซิด **V** และ **VI**, บัวโนโนซิพินเอ (**VII**) และบัวโนโนซิพินบี (**VIII**) โดยพบว่าบัวขินอลเอ (**I**) มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งปอด มะเร็งเต้านม และมะเร็งช่องปากอย่างมีนัยสำคัญด้วยค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 3.4, 2.7 และ 4.5 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตรตามลำดับ บัวขินอลบี (**II**) มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งปอด (ค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 1.1 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) และมะเร็งเต้านม (ค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 9.7 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) แต่ไม่มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งช่องปาก (ที่ระดับความเข้มข้น 20 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) ใบเบนซิด **VI** มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งปอด (ค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 14.1 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) และมะเร็งเต้านม (ค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 4.0 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) แต่ไม่มีฤทธิ์ยับยั้ง (ที่ระดับความเข้มข้น 20 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) การเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งช่องปาก นอกเหนือไปจากนี้ สาร **I, II** และ **VI** ยังมีฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรคอย่างอ่อน ด้วยค่าเอ็มไอโอซีเท่ากับ 50, 25 และ 50 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตรตามลำดับ แต่ไม่มีฤทธิ์ (ที่ระดับความเข้มข้น 20 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร) ต้านเชื้อมาลาเรียสายพันธุ์ค 1 (*Plasmodium falciparum*) โดยสาร **II** และ **VI** มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเชื้อราน (*Candida albicans*) ในระดับอ่อนด้วย (ค่าไอโอซี 50 เท่ากับ 28.9 และ 11.7 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตรตามลำดับ) ในขณะที่สาร **I** ไม่มีฤทธิ์ต้านการอักเสบโดยยับยั้งการทำงานของเอนไซม์ไชโคลออกซิเจนส 1 (COX-1) และไชโคลออกซิเจนส 2 (COX-2) สาร **II** และ **VI** มีฤทธิ์ยับยั้งการทำงานของเอนไซม์ทั้งสองชนิดนี้ ด้วยค่าไอโอซี 50 ไกลีเคียงกับยาแอสไพรินซึ่งใช้เป็นสารมาตราฐานด้วย

ในส่วนของต้นกันเกรา (*Fagraea fragrans* Roxb.) สามารถแยกสารที่มีการรายงานแล้ว 4 ชนิด ได้แก่ ใบโนเรชินอล (**IX**), น้ำคลิคอล (**X**), เgenitiojinol (**XI**), และสารอโรไชด์ (**XII**) จากส่วนของเปลือกลำต้น, ราก, ผลไม้ และลำต้นตามลำดับ โดยพบว่าสาร **IX** มีฤทธิ์ต้านเชื้อ

ปอด (ค่าไอซี 50 เท่ากับ 18.94 และ 5.06 ในโครงรัมต่อมิลลิตรตามลำดับ) และมีฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรคอย่างอ่อน (ค่าเอ็มไอซีเท่ากับ 200 และ 50 ในโครงรัมต่อมิลลิตรตามลำดับ) แต่ไม่มีฤทธิ์ยับยั้งการเจริญเติบโตของเซลล์มะเร็งเต้านมและมะเร็งช่องปาก และไม่มีฤทธิ์ต้านเชื้อนมาลาเรียสายพันธุ์เค 1 (ที่ระดับความเข้มข้น 20 ในโครงรัมต่อมิลลิตร) สาร XII มีฤทธิ์ต้านเชื้อไวรัสที่ก่อให้เกิดโรคเริม (เปอร์เซ็นต์การยับยั้งไม่น้อยกว่า 35-50% ที่ระดับไอซี 50 เท่ากับ 1.2 ± 0.3 ในโครงรัมต่อมิลลิตร)

การพิสูจน์โครงสร้างทางเคมีของสารทั้ง 12 ชนิด ใช้วิธีวิเคราะห์ข้อมูลทางスペกโโทรสโคปี

สาขาวิชาเคมี
ปีการศึกษา 2547

ลายมือชื่อนักศึกษา _____ ดร. สมชาย สงวน
 ลายมือชื่ออาจารย์ที่ปรึกษา _____ อ. ดร. อรุณรัตน์ สงวน
 ลายมือชื่ออาจารย์ที่ปรึกษาร่วม _____ ดร. อรุณรัตน์ สงวน
 ลายมือชื่ออาจารย์ที่ปรึกษาร่วม _____ J.B. Bremer

SAMNEANG APISANTIYAKOM : ISOLATION AND IDENTIFICATION
OF BIOACTIVE CHEMICAL CONSTITUENTS OF THE ROOTS OF
BAUHINIA SACCOCALYX PIERRE AND *FAGRAEA FRAGRANS* ROXB.
THESIS ADVISOR : ASST. PROF. THANAPORN MANYUM, Ph.D.
175 PP. ISBN 974-533-373-5

BAUHINIA SACCOCALYX/FAGRAEA FRAGRANS/BIBENZYL/CYTOTOXICITY
ANTIFUNGAL/ANTIMYCOBACTERIAL

Four new bibenzyls, bauhinols A-D (**I-IV**), together with four known compounds, bibenzyls **V** and **VI**, bauhinoxepin A (**VII**), and bauhinoxepin B (**VIII**) were isolated from the roots of *Bauhinia saccocalyx*. Bauhinol A (**I**) exhibits significant cytotoxicity towards NCI-H187 (small-cell lung cancer), BC (breast cancer), and KB (oral-cavity cancer) cell lines, with IC₅₀ values of 3.4, 2.7, and 4.5 µg/mL, respectively. Bauhinol B (**II**) is cytotoxic against NCI-H187 (IC₅₀ = 1.1 µg/mL) and BC (IC₅₀ = 9.7 µg/mL) cell lines, but inactive towards the KB cell line (at 20 µg/mL). Bibenzyl **VI** is active against NCI-H187 (IC₅₀ = 14.1 µg/mL) and BC (IC₅₀ = 4.0 µg/mL) cells, but inactive (at 20 µg/mL) towards the KB cell line. Compounds **I**, **II**, and **VI** show mild antimycobacterial activities, with MIC values of 50, 25, and 25 µg/mL, respectively, but are inactive (at 20 µg/mL) against K1 malarial parasite strain (*Plasmodium falciparum*). Compound **II** and **VI** also demonstrates mild antifungal activities towards *Candida albicans* (IC₅₀ = 28.9 and 11.7 µg/mL, respectively). While compound **I** is inactive against cyclooxygenase 1 (COX-1) and

Four known compounds, pinoresinol (**IX**), naucledal (**X**), gentiogenal (**XI**), and sweroside (**XII**) were isolated from the stem bark, roots, fruits, and stems of *Fagraea fragrans* Roxb., respectively. Compound **IX** possesses antimalarial activity against *Plasmodium falciparum* (K1 strain), with IC₅₀ value of 3.4 µg/mL, and antitubercular activity against *Mycobacterium tuberculosis* (H37Ra), with MIC value of 200 µg/mL. Compounds **X** and **XI** exhibit cytotoxicity towards NCI-H187 cell line (IC₅₀ values of 18.94 and 5.06 µg/mL, respectively) and also demonstrate mild antitubercular activity (MIC = 200 and 50 µg/mL, respectively). However, compounds **X** and **XI** are inactive towards the KB and BC cell lines, and inactive against K1 malarial parasite strain (at 20 µg/mL). Compound **XII** demonstrates mild anti-HSV-1 (Herpes simplex virus type 1) activity (% inhibition ≥ 35-50% at IC₅₀ = 1.2 ± 0.3 µg/mL).

Chemical structures of these isolated compounds were elucidated by analyses of spectroscopic data.

School of Chemistry

Academic Year 2004

Student's Signature Samneang Apisantiphom.

Advisor's Signature T. Mayer

Co-advisor's Signature H. D.

Co-advisor's Signature J.B. Brunner