

บทคัดย่อ

รหัสโครงการ : MRG4980176

ชื่อโครงการ : ส่วนประกอบทางเคมีและฤทธิ์ทางชีวภาพของพืชสกุล *Alpinia* บางชนิด

ชื่อนักวิจัย และสถาบัน : ดร.นุชนิภา นันทะวงศ์

ภาควิชาเคมี คณะวิทยาศาสตร์ มหาวิทยาลัยเชียงใหม่

E-mail Address : nuchnipa@chiangmai.ac.th

ระยะเวลาโครงการ : 1 กรกฎาคม 2549 ถึง 30 มิถุนายน 2551

การศึกษาส่วนประกอบทางเคมีของเหง้าของข่าป่า (*Alpinia malaccensis* (Burm.) Roscoe) สามารถแยกสารได้ 8 ชนิด คือ 5,6-dehydrokawain (**20**), cardamonin (**21**), coronarin E (**22**), coronarin A (**23**), (E)-8(17),12-labdadiene-15,16-dial (**24**), hedyforrestin B (**25**), pinocembrin (**26**) และ alpinetin (**27**) โครงสร้างของสารหาได้จากเทคนิคทางสเปกโทรสโกปี และจากการเปรียบเทียบข้อมูลทางสเปกโทรสโกปีและข้อมูลทางกายภาพที่ได้กับสารที่มีรายงานไว้แล้ว โดยสารทั้ง 8 ชนิดนี้ พบว่ามีรายงานการแยกจากข่าป่าได้เป็นครั้งแรก Cardamonin (**22**) เป็นสารที่ใช้ในการปรับเปลี่ยนโครงสร้างได้แอนาลอกคือ 2'-hydroxy-4',6'-dimethoxychalcone (**28**), 2',4',6'-tri-methoxychalcone (**29**), 4'-acetoxy-2'-hydroxy-6'-methoxychalcone (**30**), 2',4'-diacetoxy-6'-methoxychalcone (**31**), 4'-benzoyl-2'-hydroxy-6'-methoxychalcone (**32**) และ 2',4'-dibenzoyl-6'-methoxychalcone (**33**)

ในส่วนของการทดสอบฤทธิ์ทางชีวภาพ ได้แก่ ฤทธิ์ต้านเชื้อมาลาเรีย, ฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรค, ฤทธิ์ต้านไวรัสเริม ของสาร **20** – **27** และการทดสอบความเป็นพิษต่อเซลล์มะเร็งในช่องปาก, เซลล์มะเร็งเต้านม, เซลล์มะเร็งปอด และ เซลล์ปกติของสาร **20** – **33** พบว่า สาร **21** มีฤทธิ์ในการ ฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรค และฤทธิ์ต้านเชื้อมาลาเรียสูงที่สุด ด้วยค่า MIC 6.25 $\mu\text{g/ml}$ และ IC₅₀ 4.09 $\mu\text{g/ml}$ ตามลำดับ และสารส่วนใหญ่ไม่แสดงฤทธิ์ต้านเชื้อไวรัสเริม เมื่อทดสอบความเป็นพิษต่อเซลล์ พบว่า สาร **29** มีฤทธิ์ยับยั้งเซลล์มะเร็งในช่องปาก และเซลล์มะเร็งปอดสูงที่สุด (IC₅₀ 0.623 และ 0.929 $\mu\text{g/ml}$, ตามลำดับ) ส่วนสาร **28**, **30**, **31** และ **33** มีฤทธิ์ ยับยั้งเซลล์มะเร็งในช่องปาก และเซลล์มะเร็งปอดสูง (IC₅₀ 1.73, 2.00, 2.37, 2.53 และ 1.65, 1.80, 1.84, 2.27 $\mu\text{g/ml}$, ตามลำดับ) นอกจากนี้สาร **31** และ **28** ยังแสดงฤทธิ์สูงต่อเซลล์มะเร็งเต้านมด้วย (IC₅₀ 2.33 และ 2.52 $\mu\text{g/ml}$, ตามลำดับ) ในขณะที่เดียวกันสารที่มีฤทธิ์ดังกล่าว ก็มีความเป็นพิษต่อเซลล์ปกติด้วย (IC₅₀ 5.67 - 7.94 $\mu\text{g/ml}$, ตามลำดับ)

คำหลัก : *Alpinia malaccensis*, Zingiberaceae, Antiplasmodial activity, Antimycobacterial activity, Cytotoxicity

ABSTRACT

Project Code : MRG4980176

Project Title : Chemical Constituents and Biological Activities of some *Alpinia* species

Investigator : Prof. Dr Nuchnipa Nuntawong

Department of Chemistry, Faculty of Science, Chiang Mai University

E-mail Address : nuchnipa@chiangmai.ac.th

Project Period : 1st July 2006 to 30th June 2008

Investigation of the chemical constituents of the rhizomes of *Alpinia malaccensis* has led to the isolation of eight known compounds; 5,6-dehydrokawain (**20**), cardamonin (**21**), coronarin E (**22**), coronarin A (**23**), (*E*)-8(17),12-labdadiene-15,16-dial (**24**), hedyforrestin B (**25**), pinocembrin (**26**) and alpinetin (**27**). The structures of all compounds were elucidated by spectroscopic techniques and by comparison of spectroscopic data and some physical data with those of reported values. All of these compounds are reported from this plant for the first time. Cardamonin (**21**) was subjected to structure modification. The synthesized analogues included 2'-hydroxy-4',6'-dimethoxychalcone (**28**), 2',4',6'-tri-methoxychalcone (**29**), 4'-acetoxy-2'-hydroxy-6'-methoxychalcone (**30**), 2',4'-diacetoxy-6'-methoxychalcone (**31**), 4'-benzoyl-2'-hydroxy-6'-methoxychalcone (**32**) and 2',4'-dibenzoyl-6'-methoxychalcone (**33**).

Biological activities including antiplasmodial, antimycobacterial, antiherpes simplex virus type-1 (HSV-1) of compounds **20** - **27** and cytotoxic activities against KB, BC, NCI-H187 and Vero cells of compounds **20** – **33** were evaluated. Among the tested compounds, **21** exhibited the highest antiplasmodial activity against *Plasmodium falciparum* (IC₅₀ 4.09 µg/ml) and antimycobacterial activity against *Mycobacterium tuberculosis* (IC₅₀ 6.25 µg/mL). Most of the tested compounds did not exhibit anti HSV-1 activity. For cytotoxic activities, compound **29** showed the highest activity against KB and NCI-H187 cells (IC₅₀ 0.623 and 0.929 µg/ml, respectively). Compound **28**, **30**, **31** and **33** exhibited strong activity against KB and BC cells (IC₅₀ 1.73, 2.00, 2.37, 2.53 and 1.65, 1.80, 1.84, 2.27 µg/ml, respectively). In addition, compound **31** and **28** also exhibited strong activity against the BC cell (IC₅₀ 2.33 and 2.52 µg/mL, respectively). It should be noted that all cytotoxic compounds were also toxic to Vero cells (IC₅₀ 5.67 - 7.94 µg/ml).

Key words : *Alpinia malaccensis*, Zingiberaceae, Antiplasmodial activity, Antimycobacterial activity, Cytotoxicity