

สัญญาเลขที่ TRG5880005

โครงการ โครงการองค์ประกอบทางเคมีและฤทธิ์ชีวภาพจากรากและลำต้นของคันทรง

บทคัดย่อ

การแยกองค์ประกอบทางเคมีของพืชสมุนไพรไทยจากต้นคันทรงด้วยวิธีทางโครมาโทกราฟี แยกได้สารองค์ประกอบทั้งหมด 21 สาร โดยได้จากส่วนสกัดหยาบของกิ่งคันทรง 16 สาร ประกอบไปด้วยสาร ceanothic acid (1), granulolic acid (2), zizyberenalic acid (3), colubrinic acid (4), alphitolic acid (5) and betulinic acid (6), stigmast-5-en-7-one (7), 6 β -hydroxystigmast-4-en-3-one (8), stigmast-4-ene-3, 6-dione (9), ergosterol peroxide (10), β -sitosterol (11) and β -sitosterol-3-O-glycoside (20), 2-hydroxy-5-methoxybenzoic acid (12), (-)-auranamide (13), D-phenylalanine, N-benzoyl-(2R)-2-(acetylamino)-3-phenylpropyl ester (14), isointermedeol (15) และสาร 3",2"-O-acetylcolubrin (16) สำหรับการแยกส่วนสกัดหยาบของรากคันทรงประกอบไปด้วยสารใหม่กลุ่มไทรเทอร์พีนชนิด ceanothane จำนวน 2 สาร คือ 3 β -benzoylcolubenzoylatic acid (17) และ 3 β - acetylcolubenzoylatic acid (18) และสารที่รายงานโครงสร้างแล้ว 9 สาร คือ สาร ceanothic acid (1), granulolic acid (2), zizyberenalic acid (3), alphitolic acid (5), betulinic acid (6), β -sitosterol-3-O-glycoside (20), 3",2"-O-acetylcolubrin (16), 3"-O-acetylcolubrin (19) และสาร squalene (21) สำหรับการพิสูจน์โครงสร้างของสารเหล่านี้ อาศัยเทคนิคทางสเปกโทรสโกปี (UV, IR, HR-ESI-TOF-MS, ¹H NMR ¹³C NMR และ 2D NMR) จากการทดสอบฤทธิ์ทางชีวภาพของสารที่แยกได้ พบว่า สาร 3, 10, 17, 18 และสาร 21 มีฤทธิ์ต้านเชื้อมาลาเรีย *Plasmodium falciparum* ที่ค่า IC₅₀ ระหว่าง 2.32 ถึง 4.67 μ g/mL ในขณะที่สาร 5 และสาร 18 มีฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรค *Mycobacterium tuberculosis* ที่ค่า MIC 50.00 and 6.25 μ g/mL นอกจากนี้สาร 3, 5, 6, 10, 14, 16-19 และ 21 มีความเป็นพิษต่อเซลล์มะเร็ง KB, NCI-H187 และ MCF-7 ที่ค่า IC₅₀ ระหว่าง 8.32 ถึง 46.72 μ g/mL

คำสำคัญ: ต้นคันทรง วงศ์พุทรา ฤทธิ์ต้านเชื้อมาลาเรีย เป็นพิษต่อเซลล์มะเร็ง ฤทธิ์ต้านเชื้อวัณโรค

สัญญาเลขที่ TRG5880005

โครงการ Chemical constituents and bioactivity from roots and stem of *Colubrina asiatica*

Abstract

The phytochemical investigation of Thai medicinal plant, *Colubrina asiatica*, led to the isolation of twenty-one compounds. The crude extracts from the branches of *C. asiatica* gave sixteen compounds, ceanothic acid (**1**), granulolic acid (**2**), zizyberenalic acid (**3**), colubrinic acid (**4**), alphaltolic acid (**5**) and betulinic acid (**6**), stigmast-5-en-7-one (**7**), 6 β -hydroxystigmast-4-en-3-one (**8**), stigmast-4-ene-3,6-dione (**9**), ergosterol peroxide (**10**), β -sitosterol (**11**) and β -sitosterol-3-O-glycoside (**20**), 2-hydroxy-5-methoxybenzoic acid (**12**), (-)-auranamide (**13**), D-phenylalanine, *N*-benzoyl-(2*R*)-2-(acetylamino)-3-phenylpropyl ester (**14**), isointermedeol (**15**) and 3'',2'''-O-acetylcolubrin (**16**). The crude extracts from the roots of *C. asiatica* yielded two new ceanothane triterpenes, 3 β - benzoylcolubenzoylatic acid (**17**) and 3 β - acetylcolubenzoylatic acid (**18**), along with nine known compounds, ceanothic acid (**1**), granulolic acid (**2**), zizyberenalic acid (**3**), alphaltolic acid (**5**), betulinic acid (**6**), β -sitosterol-3-O-glycoside (**20**), 3'',2'''-O-acetylcolubrin (**16**), 3''-O-acetylcolubrin (**19**) and squalene (**21**). Their structures were elucidated by spectroscopic methods (UV, IR, HR-ESI-TOF-MS, ¹H NMR ¹³C NMR and 2D NMR). Compounds **3**, **10**, **17**, **18** and **21** showed antimalarial activity against *Plasmodium falciparum* with IC₅₀ values ranging from 2.32 to 4.67 μ g/mL, while compounds **5** and **18** showed antimycobacterial activity against *Mycobacterium tuberculosis* (MIC 50.00 and 6.25 μ g/mL, respectively). In addition, compounds **3**, **5**, **6**, **10**, **14**, **16-19** and **21** showed cytotoxicity against cancer cell lines, KB, NCI-H187 and MCF-7 with IC₅₀ values ranging from 8.32 to 46.72 μ g/mL.

Keyword: *Colubrina asiatica*, Rhamnaceae, antimalarial, cytotoxicity, antimycobacterial