

ชื่อเรื่องวิทยานิพนธ์	การคัดแยก การตัดแปร โครงสร้าง และฤทธิ์ต้าน มาลาเรียของสารออกฤทธิ์ทางชีวภาพจากคิงดั้น
ผู้เขียน	นายเฉลิม ทราอินทร์
ปริญญา	วิทยาศาสตรดุษฎีบัณฑิต (เภสัชศาสตร์)
คณะกรรมการที่ปรึกษาวิทยานิพนธ์	รศ. ดร. บุญบัน ศิริชัยญาณลักษณ์ รศ. ดร. कम สุคนธสรทรัพย์ อ. ดร. อภิวัฒน์ บารมี ผศ. ดร. กรกนก อิงคินันท์

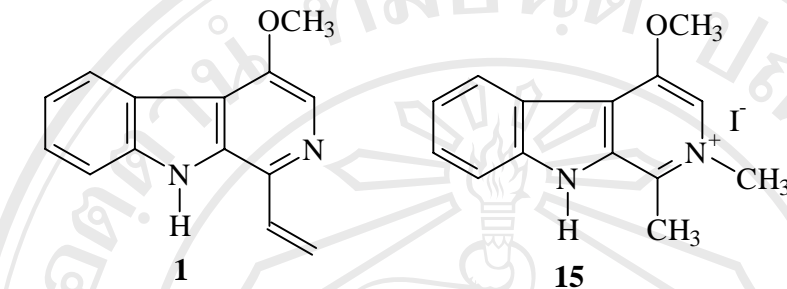
บทคัดย่อ

ได้ทำการเตรียมสารสกัดจากเปลือกต้นและเนื้อไม้คิงดั้นจำนวน 8 ตัวอย่าง ผลการศึกษาฤทธิ์ต้านมาลาเรียในหลอดทดลองต่อเชื้อ *Plasmodium falciparum* K1 โดยการตัดแปรวิธี [³H]hypoxanthine incorporation พบว่าสารสกัดเปลือกต้นด้วยเฮกเซนมีฤทธิ์ต้านมาลาเรียสูงสุดโดยมีค่า IC₅₀ เท่ากับ 3.3 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร ในขณะที่สารสกัดเปลือกต้นด้วยคลอโรฟอร์มมีค่า IC₅₀ เท่ากับ 20.0 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร

นำสารสกัดเปลือกต้นด้วยเฮกเซนมาแยก ได้สารประกอบหลักคือ บีต้า-ลิโตสเตอรอล ในขณะที่การแยกสารสกัดเปลือกต้นด้วยคลอโรฟอร์ม พบว่าสารส่วนอัลคาลอยด์มีฤทธิ์ต้านมาลาเรีย โดยมีค่า IC₅₀ เท่ากับ 15.0 ไมโครกรัมต่อมิลลิลิตร การศึกษาองค์ประกอบเคมีของสารส่วนอัลคาลอยด์ทำโดยใช้เทคนิค Gas chromatography-Mass spectrometry พบสารประกอบหลักคือ 1-vinyl-4-methoxy-β-carboline (1)

ได้ทำการสังเคราะห์สารในกลุ่ม 1-substituted-4-oxygenated-β-carbolines ผลการศึกษาฤทธิ์ต้านมาลาเรียในหลอดทดลองต่อเชื้อ *P. falciparum* FCR-3 และการศึกษาความเป็นพิษต่อ mouse mammary tumor FM3A พบว่าเกลือแอมโมเนียม คือ 1, 2-dimethyl-4-methoxy-β-carboline

iodide (15) มีฤทธิ์ต้านมาลาเรียสูงสุด และมีอัตราส่วนระหว่างฤทธิ์ต้านมาลาเรียต่อความเป็นพิษสูงสุด การศึกษานี้แสดงให้เห็นอย่างเด่นชัดว่าหมู่เมทิลที่อะตอมไนโตรเจนตำแหน่งที่ 2 มีความสำคัญต่อฤทธิ์ต้านมาลาเรีย



ลิขสิทธิ์มหาวิทยาลัยเชียงใหม่
Copyright © by Chiang Mai University
All rights reserved

Thesis Title	Isolation, Structural Modification and Antimalarial Activity of Bioactive Compounds from <i>Picrasma javanica</i> Bl.		
Author	Mr. Chalerm Saiin		
Degree	Doctor of Philosophy (Pharmacy)		
Thesis Advisory Committee	Assoc. Prof. Dr. Busaban Sirithunyalug	Chairperson	
	Assoc. Prof. Dr. Kom Sukontason	Member	
	Lecturer Dr. Apiwat Baramee	Member	
	Asst. Prof. Dr. Kornkanok Ingkaninan	Member	

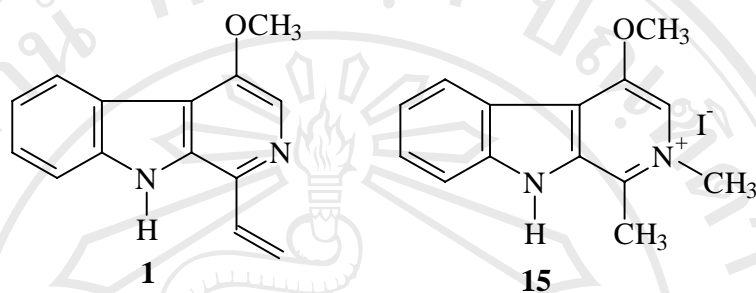
ABSTRACT

Eight extracts from the stembark and wood of *Picrasma javanica* Bl. were prepared. The *in vitro* antimalarial activities against *Plasmodium falciparum* K1 of these extracts were determined using a modification of the [³H]hypoxanthine incorporation method. It was found that the hexane extract of stembark showed the highest level in vitro antimalarial activity with an IC₅₀ of 3.3 μg/ml, while the chloroform extract of stembark showed that of 20.0 μg/ml.

Further isolation of hexane extract provided β-sitosterol as the major compound. Further isolation of chloroform extract yielded alkaloidal portion that showed an *in vitro* antimalarial activity with an IC₅₀ of 15.0 μg/ml. The component of alkaloidal portion was determined using Gas chromatography-Mass spectrometry technique. The mass spectra of the major compound corresponded to that of 1-vinyl-4-methoxy-β-carboline (1).

A series of 1-substituted-4-oxygenated-β-carbolines were synthesized, and evaluated for *in vitro* anti-malarial activities against *P. falciparum* FCR-3 strain and cytotoxicities against

mouse mammary tumor FM3A. The result showed that the carbolinium salt, 1,2-Dimethyl-4-methoxy- β -carboline iodide (15) had the highest level of antimalarial activity and selective toxicity. It was clear that the methyl moiety at N-2 position is necessary for antimalarial activity.



ลิขสิทธิ์มหาวิทยาลัยเชียงใหม่
Copyright © by Chiang Mai University
All rights reserved