

ตัวอย่างสมุนไพร 51 อย่างจากพืช 50 ชนิดถูกเลือกมาทดสอบเบื้องต้นในการต้านฤทธิ์สารกระตุ้นประสาท โดยมีเกณฑ์ในการคัดเลือกอ้างอิงจากการใช้ในยาพื้นบ้านของไทย จากรายงานการวิจัยเกี่ยวกับฤทธิ์คลายเครียด ด้านชัก สงบระงับ หรือรายงานความสามารถในการจับกับตัวรับสารสื่อประสาทต่างๆ ของพืชนั้น รวมทั้งบางชนิดได้จากการสุ่มเลือก ตัวอย่างเหล่านี้ถูกทดสอบฤทธิ์ด้านการจับกับตัวรับ dopamine 1, แอลฟา 1 และ 5-HT<sub>2</sub> สารสกัดหยาบ ethanol ของใบน้อยหน่า ใบกะทกรก และลำต้นและใบไ้เตี้ยแสดงผลยับยั้งการจับกับตัวรับ dopamine 1 ได้ไม่น้อยกว่า 50% ในขณะที่สารสกัดจากรากระย่อมยับยั้งการจับกับตัวรับทั้ง แอลฟา 1 และ 5-HT<sub>2</sub> ได้มากกว่า 50% และสารสกัด ethanol ของผลมะตูมสามารถยับยั้งการจับกับตัวรับแอลฟา 1 ได้เช่นกัน

เลือกศึกษาพืช 3 ชนิดคือ น้อยหน่า กะทกรก และไ้เตี้ย การสกัดด้วยการ partition สารสกัดหยาบ ethanol ของพืชเหล่านี้ทำให้แยกย่อยออกได้เป็นสี่สกัด hexane, สกัด dichloromethane, สกัด butanol และ สกัด aqueous พบว่าสกัด dichloromethane ของพืชทั้ง 3 ชนิดมีฤทธิ์ยับยั้งการจับกับตัวรับได้ดีที่สุด เมื่อนำสกัด dichloromethane ของใบน้อยหน่ามาศึกษาทางพิษฤทธเคมี พบว่ามีองค์ประกอบเป็น  $\beta$ -sitosterol glucoside, ของผสมของ sterol glycoside หลายชนิด, สารกลุ่ม dioxaporphine alkaloid ชนิดหนึ่ง คือสาร lanuginosine และสารกลุ่ม acetogenin ซึ่งยังไม่ทราบโครงสร้างที่แน่นอน อย่างไรก็ตาม เมื่อภายหลังพบว่าสารสกัดจากพืชนี้มีความเป็นพิษสูงเกินไปต่อสัตว์ทดลอง จึงไม่ได้ดำเนินการต่อไป

สกัด dichloromethane ของใบกะทกรกมีองค์ประกอบเป็นของผสมของ  $\beta$ -sitosterol glycoside กับ stigmasterol glycoside รวมด้วยสารกลุ่ม flavonoid อีกหลายชนิด รวมทั้ง acacetin และ chrysoeriol สาร flavonoid เหล่านี้น่าจะมีประโยชน์ในฐานะของ chemical marker สำหรับศึกษาพืชนี้ต่อไป

การสกัดแยกและพิสูจน์สูตรโครงสร้างของสารที่พบในส่วนเหนือดิน (ลำต้นและใบ) ของไ้เตี้ยทำให้ได้สารชนิดใหม่ 1 ชนิดในกลุ่ม guanidine alkaloid ซึ่งให้ชื่อว่า canarosine และสารที่รู้จักกันอยู่แล้วอีก 5 ชนิด คือ  $\beta$ -sitosterol, stigmasterol,  $\beta$ -sitosterol glucoside, epi-inositol 6-O-methyl ether ซึ่งเป็นอนุพันธ์ของสาร cyclitol และ rutin ซึ่งเป็น flavonoid glycoside ชนิดหนึ่ง สาร canarosine สามารถยับยั้งไม่ให้สารมาตรฐานเข้าไปจับกับตัวรับ dopamine 1 ได้อย่างมีนัยสำคัญ และดังนั้นจึงเป็นสารที่น่าจะได้นำไปวิจัยต่ออย่างละเอียด

Fifty-one plant samples from 50 plant species were selected to be screened for their activity against CNS stimulants. The criteria for selection were based on their uses in traditional Thai medicine, their reported anxiolytic, anticonvulsant, sedative or receptor-binding activity, whereas a few of them were randomly selected. These samples were assayed for their inhibitory activity against dopamine 1,  $\alpha$  1 and 5-HT<sub>2</sub> receptor binding. The ethanol extracts of *Annona squamosa* leaves, *Passiflora foetida* leaves and *Canavalia rosea* aerial parts caused more than 50% inhibition of dopamine 1 receptors, while that of *Rauvolfia serpentina* roots was able to inhibit, at more than 50%, both  $\alpha$  1 and 5-HT<sub>2</sub> receptors, and the ethanol extract of *Aegle marmelos* fruit was similarly active against  $\alpha$  1 receptors.

Three plants, i.e. *A. squamosa*, *P. foetida* and *C. rosea*, were selected for further study. Partition of the ethanol extract of these plants yielded hexane extract, dichloromethane extract, butanol extract and aqueous extract. The dichloromethane extracts of all three plants were found to be the most active in the receptor binding assay. Phytochemical investigation of the dichloromethane extract of *A. squamosa* leaves showed the presence of  $\beta$ -sitosterol glucoside, mixture of sterol glycosides, lanuginosine, which is a dioxoaporphine alkaloid, and an unknown acetogenin. However, no further work was done on this plant after its extract was found to be too toxic in animal testing.

The dichloromethane extract of *P. foetida* leaves contained mixture of  $\beta$ -sitosterol glycoside and stigmasterol glycoside, together with several flavonoids, including acacetin and chrysoeriol. These flavonoids could be useful chemical markers for further study of this plant.

Isolation and structural elucidation of compounds from *C. rosea* aerial parts yielded a new guanidine alkaloid named canarosine, and five known compounds including  $\beta$ -sitosterol, stigmasterol,  $\beta$ -sitosterol glucoside, *epi*-inositol 6-O-methyl ether, which is a cyclitol derivative, and rutin, which is a flavonoid glycoside. Canarosine was able to significantly inhibit the binding of standard compound to dopamine 1 receptors, and, therefore, should be further studied.