

## 新潟大学工学部と越後製菓株式会社において「穿心蓮」の薬理効果に関する研究が平成6年と平成7年に研究されています。

(研究タイトル)

薬理作用を有する天然有機化合物の検索に関する研究(平成6年)

(研究者)

安東政義(新潟大学工学部)

鈴木敏夫(新潟大学工学部)

山崎彬(越後製菓株式会社)

伊藤満敏(越後製菓株式会社)

(研究の概要)

地球上に生息している多種多様な植物は種々の生理活性天然物を含有している。これらの中には我々の生活にとって有用なものが多く存在し、古くからその検索が行われてきた。

なかでも民間伝生薬は興味ある薬理作用を有する化合物の宝庫であり、格好の研究対象となってきた。

この分野の研究は、ここ十数年間の高速クロマトグラフィーなどの単離、精製技術の効率化、及び核磁気共鳴装置(MRI)を中心とした各種分析機器の発達と相まって、微量成分の単離、構造決定が可能となり急激な進展をみせている。また、従来困難であった複雑な疾病に対しても薬理作用を評価できる新しいアッセイ系が開発され、既知化合物であっても新しい生理活性を見出し得る可能性が出てきた。

本研究ではこれら民間伝生薬として伝わる植物に含まれる微量成分を含めた薬理有効成分を明らかにするとともに、既知化合物の再検討を含めたそれら薬理作用の詳しい検索を行う。また、得られた成分をリード化合物として化学的手法により種々の誘導体を合成し、新しい医薬品、あるいは健康食品の開発を行うことを目的としている。

平成6年度は東南アジアで民間薬として広範囲に用いられている穿心蓮(*Andrographis paniculata*)を試料として選び、その生理活性成分の検索と生理活性テストを行った。

(研究成果の概要)

乾燥 *Andrographis paniculata* のメタノールエキスを順次 n-ヘキサン、酢酸エチル、塩化メチレンで抽出を行った。これらのうち、最も生理活性成分の含有が期待される酢酸エチル抽出物をシリカゲルクロマトグラフィー、高速液体クロマトグラフィーを繰り返すことにより、化合物の単離、精製を行った。その結果、7種類の化合物を得ることに成功した。

続いて、核磁気共鳴装置を中心とした各種スペクトル機器を用いて構造解析を行ったところ、これら化合物は Fig.1 に示した *Andrographolide 1* をはじめとした、アント-ラプタン型ジテルペン化合物であることがわかった。これらの内、化合物 1 ~ 5 は既知であるが、ジエノール構造を有する 6, 7 は今まで天然からは得られておらず、新規な化合物である。

次に、化合物 1, 2, 4 を用いて生理活性試験を行った。最近、特に問題となっている免疫疾患に対する薬理活性を調べるため、新しく開発された幾つかのアッセイ系に付した。

その結果、化合物 1 及び 2 が T 細胞傷害阻害活性において強い活性を示すことがわかった(Fig.2)。化合物 4 においては有為な活性が認められないことより、化合物 1, 2 に共通のヒドロキシブテノリド構造が活性発現に必須であると考えられる。

(まとめ)

これまでの研究成果は直接、医薬品、健康食品の製品化へと結びつくという段階ではないが、健康食品開発に必須な構成成分の解明を行い、また、免疫疾患に対する医薬品としての可能性を見出した点で意味は大きい。今後、ここで得られた化合物に対して、科学的修飾を施した種々の人工的誘導体を合成したその有用性を探っていく予定である。また、新しい資料についても検索を行う予定である。