

(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7年)

(研究者)

新潟大学工学部 大学院自然科学研究科:安東政義 鈴木敏夫

越後製菓(株) 伊藤満敏

(研究の概要)

薬用植物、穿心蓮(*Andrographis paniculata*)に含まれる生理活性成分の検索を行った。また、比較的容易に、かつ大量に得られる天然物、andrographolide5に系統的な化学修飾を行った各種誘導体を合成し、得られた天然物、及び誘導体をあわせて免疫調節物質に関する生理活性試験を行った。

(成果の概要)

同植物地上部に含まれる成分検索を行った結果、10種類の既知エントラブダン型ジテルペンとあわせて、4種類の新規化合物1~4の単離構造決定に成功した。また、既知化合物で立体化学のこれまで不明であった6の14位、及び7の12位の立体化学の決定を行った。

一方、同植物地下部に含まれる生理活性物質に関しても検索をおこない、地上部から得られた化合物とは全く異なるフラボノイド、及びフラボノイド系化合物群が得られ、10種類の化合物の単離・構造決定に成功した。

次に、化学構造と生理活性との相関関係を調べるために、地上部から比較的容易に得られるandrographolide5のA環部に化学修飾を行い、系統的にその化学構造を変化させた各種誘導体を合成した。

こうして得られた天然物、及びその誘導体を用いて現在社会的要請に高い免疫調節物質に関する生理活性試験を行い、生理活性発現に必要な構造的因子を調べた。アッセイとしては細胞接着分子ICAM-1の誘導抑制活性、及び細胞傷害性T細胞を用いたキラー活性試験により行った。その結果、部分構造としてエキソ-a,b-不飽和-g-ラクトン構造を有する化合物がある程度の活性を示すことが明らかとなった。

(まとめ)

これまでの研究で、穿心蓮(*Andrographis paniculata*)に含まれる微量成分を含む主な成分を不明であった立体構造を含めて明らかにすることができた。また、得られた天然物から誘導される各種類縁体を合成し、免疫調節物質に関する生理活性試験の結果、幾つかの化合物が興味ある結果を示したことから、これらをリード化合物としたより有用な化合物の創製が期待される。