

インドネシア産薬用植物中の低極性 α -アミラーゼ阻害物質の探索研究

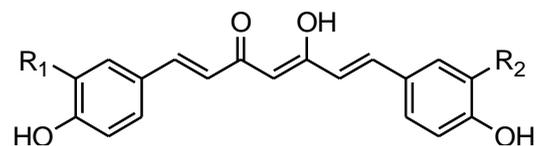
食資源科学講座 食品機能化学分野
島田 実幸

【背景と目的】

ヒトの摂取エネルギーの大部分を占めるデンプンの消化吸收抑制は、肥満や糖尿病の予防に効果的である。現在日本で薬剤として認可されている酵素阻害剤としてアカルボースなどが知られている。しかし、これらの薬剤は重篤な副作用を示すことがあり、日常的な健康管理の目的には、天然素材由来のおだやかな活性成分の利用が望ましい。しかしながらこれまでに天然由来の有効なアミラーゼ阻害物質は、特異性の低い高極性ポリフェノール以外はほとんど知られていない。そこで本研究ではアミラーゼの活性中心に疎水性残基が多いことに着目し、これまでになくタイプの低極性阻害物質の発見を目指してインドネシア産薬用植物から活性成分の探索を行った。

【方法および結果】

インドネシア産植物サンプル 73 種の 50%メタノール抽出物の酢酸エチル可溶部についてスクリーニングを行った結果、9 種類の植物に高いブタ膵臓 α -アミラーゼ阻害活性があることがわかった。そのうち *Terminalia bellirica* 実から、gallic acid および chebulagic acid、chebulinic acid、chebulanin を含むエラジタンニン混合物を活性成分として同定した。活性物質としてタンニン類が単離されたことから、酢酸エチルと水の溶媒分配法では高極性タンニン類の効率的除去ができないことがわかったので、次に 50%メタノール抽出物からクロロホルム抽出によって得た高極性タンニン除去画分について、さらにインドネシア産植物 37 種のスクリーニングを行った。その結果、*Curcuma longa* 根茎抽出物に高い酵素阻害活性がみられた。*Curcuma longa* 根茎抽出物のクロロホルム可溶部を各種クロマトグラフィーで分画したところ、主に阻害活性に寄与しているのは大量に含まれる curcumin (1)、demethoxycurcumin (2)、および bisdemethoxycurcumin (3) であることがわかった。しかし、これら主要クルクミノイドは含量は高いものの酵素阻害活性は非常に弱かったため、より高極性画分からさらに活性物質の探索を行ったところ、微量阻害活性物質として demethoxydemethylcurcumin (4) を単離した。本化合物は $IC_{50} = 0.5$ mM と curcumin の 100 倍近い活性を示した。



- 1 : $R_1 = R_2 = OCH_3$ (curcumin)
- 2 : $R_1 = H, R_2 = OCH_3$ (demethoxycurcumin)
- 3 : $R_1 = R_2 = H$ (bisdemethoxycurcumin)
- 4 : $R_1 = H, R_2 = OH$ (demethoxydemethylcurcumin)