

食品素材からのジペプチジルペプチダーゼ IV 阻害物質の探索

応用生物科学専攻 食資源科学講座 食品機能化学 上西 雄大

1. 背景・目的

糖尿病の患者数は年々増加傾向にあり、早期の治療や予防法の開発が望まれる。ジペプチジルペプチダーゼ IV (DPP-IV) はインクレチンを分解する酵素である。インクレチンは食後に腸上皮細胞から分泌される消化管ホルモンであり、インスリン分泌を促進し、血糖値を正常値へと低下させる。DPP-IV の阻害はインクレチン分解を抑制することで血糖の低下を促進させるため糖尿病治療の標的となる。本研究では健康飲料として飲用されている食品素材から DPP-IV 阻害物質の探索を行った。

2. 方法

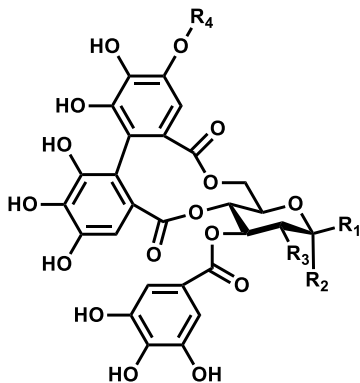
酵素阻害活性試験は DPP-IV inhibitor screening kit (ケイマンケミカル) を用いて次のように行った。C 末端に蛍光基 (7-アミノ-4-メチルクマリン) を結合したジペプチドを基質とし、DPP-IV 反応によって遊離する蛍光量を 5 分ごとに測定して反応速度を求め、コントロールと被検物質の比から阻害率を算出した。

3. 結果

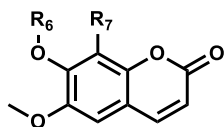
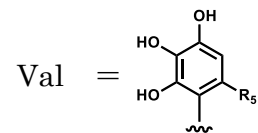
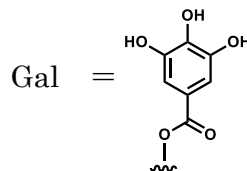
スクリーニング試験の結果、高い阻害活性を示したローズバツエキスパウダー (*Rosa gallica*)、ノニ (*Morinda citrifolia*)、メグスリノキ (*Acer nikoense*) の食品素材から DPP-IV 阻害物質の単離を試みた。

各種クロマトグラフィーに供した結果、ローズバツエキスパウダーから活性物質として 7 種のタンニン (化合物 1-7) を単離した。その中でも化合物 2 と 6 の阻害活性は高く、IC₅₀ はそれぞれ 25.8 μM, 28.5 μM であった。

同様にノニから化合物 8 と 9 を、メグスリノキから化合物 8 と 10 を活性物質として単離した。化合物 8 の阻害活性は高く、IC₅₀ は 25.5 μM であった。



- 1 : R₁, R₂ = H, OH, R₃ = Gal, R₄ = H
- 2 : R₁, R₂ = H, OH, R₃ = Gal, R₄ = Val, R₅ = COOH
- 3 : R₁ = H, R₂ = Gal, R₃ = OH, R₄ = H
- 4 : R₁, R₂ = H, OH, R₃ = Gal, R₄ = Val, R₅ = COOEt
- 5 : R₁ = Gal, R₂ = H, R₃ = Gal, R₄ = H
- 6 : R₁ = Gal, R₂ = H, R₃ = Gal, R₄ = Val, R₅ = COOH
- 7 : R₁ = Gal, R₂ = H, R₃ = Gal, R₄ = Val, R₅ = H



- 8 : R₆ = H, R₇ = H
- 9 : R₆ = Ac, R₇ = H
- 10 : R₆ = H, R₇ = OMe