

所属・資格 化学科・教授

申請者氏名 大崎 愛弓

研究課題		四国カルストに生育するイヌガヤの成分に関する研究
報告の概要	研究目的 および 研究概要	植物種の豊富な四国南西部域のうち、四国の高知県と愛媛県の県境の四国山脈高地は四国カルストと言われ、固有種を多く生育するなど植生に特異性がある地域である。申請者はこの地域に産するイヌガヤ( <i>Cephalotaxus harringtonia</i> )の成分について探索をしている。この地域に産するイヌガヤはセファロタキサスアルカロイドを多く含んでいることが明らかとなった。これらの成分の活性について詳細に検討を行った結果、強い殺細胞活性のほか、強いLPS誘導型のNO産生抑制が認められた。これまでに得た結果を踏まえて詳細な検討を行うべく、微量成分も含め網羅的な成分検討を行う。成分の構造解析には2DNMRや高分解能ESIMSを用いる予定である。
	研究の結果	高知県産イヌガヤの葉の部分メタノールにて抽出し、それらの抽出エキスより、セファロタキサスアルカロイド誘導体をこれまでに16種単離した。これらについてHL60細胞を用いた殺細胞活性を行ったところ、数種の化合物に対してIC <sub>50</sub> 1.0 μM以下の非常に強い殺細胞活性結果が得られた。同様にLPS誘導型のNO産生に対する抑制試験を行った結果、強い活性が認められた。今回は、神経芽腫細胞に対する殺細胞活性試験を行った。神経芽腫細胞としてIMR-32, NB-39細胞を用いて活性試験を行った。その結果、C-3位に糖あるいはエステル誘導体が付加したハリングトリン類縁体に対して、IC <sub>50</sub> 1.0 μM以下の強い活性が認められた。一方、LA-N-1細胞については活性が認められず、細胞選択性が認められる結果となった。一方、中性画分より、アビエタン類縁化合物について単離構造解析を行った。それらについて殺細胞活性試験を行い、HeLaおよびHL60細胞を用いて殺細胞活性試験を行った。その結果、いくつかの化合物に対して穏やかな活性が認められた。
	研究の考察・反省	ハリングトニン類は非常に強い作用を持つことが明らかとなった。今後は、低濃度にて活性試験を行うことによって、詳細な活性について検討を行う。中性画分については、強い活性は見出すことは出来なかった。アルカロイド画分についてはより詳細な分離検討を行うことにより、多くの化合物を見出し、構造活性相関を含めて検討を行う必要があると考える。
研究発表 学会名 発表テーマ 年月日/場所	論文 Sakiyama, R.; Aoyama, T.; Akazawa, H.; Kikuchi, N.; Omura, K.; Ohsaki, A.; Yasukawa, K.; Iida, T.; Kodomari, M. Solvent-Free Synthesis of 2-Alkylbenzothiazoles and Bile Acid Derivatives Containing Benzothiazole Ring by Using Active Carbon/Silica Gel and Microwave, <i>J. Oleo. Sci.</i> , <b>2018</b> , 67, 1209-1217.	
研究成果物 テーマ 誌名 巻・号 発行年月日 発行所・者	Taniguchi, K.; Funasaki, M.; Kishida, A.; Sadhu, S. K.; Ahmed, F.; Ishibashi, M.; Ohsaki, A. Two new coumarins and a new xanthone from the leaves of <i>Rhizophora mucronata</i> , <i>Bioorg. Med. Chem. Lett.</i> , <b>2018</b> , 1063-1066.  Yokoo, H.; Ohsaki, A.; Kagechika, H.; Hirano, T. Unique properties of 1,5-naphthyridin-2(1H)-one derivatives as environmental-polarity-sensitive fluorescent dyes, <i>Eur. J. Org. Chem.</i> , <b>2018</b> , 5, 679-687.	