

伝統薬物タヒボの抗がん活性と医薬品開発への展開

飯田 彰

近畿大学農学部応用生命化学科 教授



日本における死亡原因の第一位が「がん」になって久しいが、これからの超高齢化を迎える日本で、がん患者とがんによる死亡数の急増は疑いのない想定事実である。先進欧米各国の多くでも、がんによる死亡数がいっさらに増加しており、世界保健機関の予測どおり、近い将来循環器系疾患による死亡数を上回るであろう。すでに、欧米系大手製薬メーカーは、心疾患などの生活習慣病薬関連事業を縮小し、抗がん剤開発に注力している。したがって、がんに対する新しい治療薬の開発に挑戦することは創薬を研究テーマの一つとして掲げる応用化学の使命であり責務でもある。

イペ、ラパコ、イペロショなどとも呼ばれる“タヒボ”は、南米アマゾン川流域に自生するノウゼンカズラ科の巨木 *Tabebuia avellanedae* のことをさす。タヒボは、500年以上にわたり、収斂剤や利尿剤としてあるいは皮膚病など多くの疾患に効果のある民間薬として利用されてきた。近年、その化学的研究により、本植物内皮のエタノール抽出エキスは、抗がん、免疫賦活、抗菌、抗真菌、抗アレルギー、抗炎症、抗感染といった多様な生物活性を示すことが明らかにされてきた。特に、その強力な抗がん活性に着目した多くの研究グループによる広範な研究の結果、化学構造的にはキノン系に分類される色素成分群が抗がん活性発現に深くかかわっていることが明らかとなった。

演者の属する研究グループもまた、20年以上にわたり、タヒボの秘めたる生理機能の解明を目的として、特に抗がん活性に関する化学的および生化学的な基礎研究を行ってきた。その結果、がん細胞に対して強力な抗細胞増殖作用を示すキノン系色素成分 NQ801 を見出すとともに、NQ801 が抗がん作用のみならず、がんの予防にも効果があることも突き止めた。さらに、NQ801 がタヒボに含まれる最強の抗がん活性成分であることも明らかにした。一方で、最近、NQ801 のさらなる薬理学的効果の解明と臨床応用を目的として、NQ801 の化学的な大量合成法の開発にも成功した。

今回、発表の前半部分においては、がん補完代替医療として用いられているタヒボ、およびその臨床応用例と使用に際してのタヒボの安全性についてご報告したい。また、発表の後半部分では、NQ801 の抗がん特性に関する基礎データをタヒボに含まれる他の有効成分のそれらと比較しながらご紹介したい。さらに、NQ801 のがん細胞に対する抗細胞増殖作用がビタミン類の添加により劇的に向上するという新知見とあわせ、NQ801 が新しい抗がん剤開発のシーズとして非常に有望であることをご説明したい。

参考文献

1. Synthesis and evaluation of bioactive naphthoquinones from the Brazilian medicinal plant, *Tabebuia avellanedae*, M. Yamashita, M. Kaneko, H. Tokuda, K. Nishimura, Y. Kumeda, A. Iida, *Bioorg. Med. Chem.*, **17**, 6286–6291 (2009).
2. Stereoselective Synthesis and Biological Evaluation of A Cancer Chemopreventive Naphthoquinone from *Tabebuia avellanedae*, M. Yamashita, M. Kaneko, A. Iida, H. Tokuda, K. Nishimura, *Bioorg. Med. Chem.Lett.*, **17**, 6417–6420 (2007).
3. S. Ueda, T. Umemura, K. Dohguchi, T. Matsuzaki, H. Tokuda, H. Nishino, A. Iwashima, *Phytochemistry*, **36**, 323 (1994).

プロフィール

- 1983年 京都大学薬学部製薬化学科卒業
1985年 京都大学大学院薬学研究科修士課程修了
1988年 京都大学大学院薬学研究科博士後期課程所定の研究指導認定
1988年 京都大学薬学部助手
1996年 京都大学薬学部助教授
1997年 京都大学大学院薬学研究科助教授
2006年 高崎健康福祉大学薬学部教授
2008年 近畿大学農学部教授（現在に至る）

共催：タヒボジャパン株式会社