

## キキョウサポニンの構造とガン細胞増殖抑制効果の相関性

平井 康昭<sup>1</sup>, 福村 基徳<sup>1</sup>, 口野 嘉幸<sup>1</sup>, 伊田 喜光<sup>1</sup>(<sup>1</sup>昭和大薬)

【目的】 前報で述べたように、我々はキキョウから5種の新規化合物を含む13種のサポニン成分を単離した。今回、これらの化学構造とヒトガン細胞増殖抑制活性との相関性を検討した。その結果、アグリコンの種類、アグリコンに結合した糖の種類、およびそれらの結合様式の違いにより増殖抑制活性の強さが大きく左右されることがわかった。

【方法・結果】 キキョウから得た13種のサポニンおよびそれらの部分分解物のガン細胞増殖抑制活性は、MTT法を用いて測定した。その結果、以下の現象が見られた：

- (1) ガン細胞増殖抑制活性の発現には、アグリコンの3位および28位の糖鎖は必須である。
- (2) 3位の糖鎖については、長過ぎると逆に活性が低下する。
- (3) 28位の糖鎖の一部にアセチル基が結合する場合には、その結合位置の違いによって活性の強さは大きく左右される。
- (4) 28位の糖鎖のみでは活性は示さなかった。
- (5) アグリコンについては、4b位のヒドロキシメチル基が酸化されてカルボン酸になった場合には、元のヒドロキシメチル基の場合よりも活性が強い。

