

ディオスゲニンの生物学的利用能に及ぼす修飾  $\beta$ -シクロデキストリンの影響  
○大川原 正喜<sup>1</sup>, 徳留 嘉寛<sup>1</sup>, 藤堂 浩明<sup>1</sup>, 杉林 堅次<sup>1</sup>, 橋本 フミ恵<sup>1</sup>(<sup>1</sup>城西大薬)

【目的】ディオスゲニンは *Dioscorea villosa* などに含まれるステロイドサポニンで、糖尿病や高コレステロール血症の改善作用が報告されている。また、卵巣摘出マウスへ経口投与することにより薄化した表皮の改善作用も報告されており、美容や健康を目的とした食品の有効成分として注目されている。これまでに、ディオスゲニンは  $\beta$ -シクロデキストリン (CD) と包接複合体を形成すること、 $\beta$ -CD との包接複合体を経口投与することにより、低値を示した生物学的利用能 (BA) が改善されることを明らかにしてきた。本研究では、ディオスゲニンの効果的な投与方法を検討することを目的として hydroxyethyl (HE) 及び hydroxypropyl (HP)  $\beta$ -CD との複合体を調製した。また、ディオスゲニンと HE 及び HP  $\beta$ -CD で調製した複合体の経口投与後の体内動態及び皮膚中濃度を明らかにすることを目的として実験を行った。

【方法】ディオスゲニンと HE または HP  $\beta$ -CD の混合物を蒸留水中で処理して複合体を調製した。複合体を示差走査熱量計 (DSC)、X 線回折装置 (XRD) で測定し、また走査型電子顕微鏡 (SEM) で観察した。さらに、雄性 Wistar ラットにおける複合体経口投与後の血漿及び皮膚中のディオスゲニン濃度を LC-MS で測定し、種々の動態パラメータを算出した。

【結果・考察】ディオスゲニンと HE 及び HP  $\beta$ -CD の複合体を DSC、XRD 及び SEM によって測定した結果、凍結乾燥法で調製した複合体において単純混合物とは異なるプロファイルや構造が確認され、包接化合物の形成が示唆された。また、HP  $\beta$ -CD 複合体の経口投与により、ディオスゲニン単独投与群と比べて高い血漿及び皮膚中濃度が得られ、血漿中濃度-時間曲線下面積及び BA が高値を示した。