

29Q-am09S

親油性安定型アスコルビン酸誘導体の抗アレルギー作用

○三浦 香織¹, 田井 章博¹ (¹県広島大生命環境)

【目的】プロビタミン C 剤として実用化されているアスコルビン酸 2-グルコシド (AA-2G) の、AA としての利用効率を向上させるために様々な炭素数のアシル基を導入した 6-O-acyl-2-O- α -D-glucopyranosyl-L-ascorbic acid (6-Acyl-AA-2G) がある。このうち、分岐鎖アシル基を持つ 6-Acyl-AA-2G は、AA としてだけでなく代謝途中の 6-Acyl-AA としても抗腫瘍作用を示し、AA よりも低用量で活性を発揮することを見出している。このように、6-Acyl-AA-2G は AA として作用を発揮するだけでなく、代謝途中段階や代謝を受けていない誘導体そのものでも活性を示すことが期待される。そこで、6-Acyl-AA-2G の新たな生理作用の発見のため、抗アレルギー作用に着目し、本研究を行った。

【方法・結果】脱顆粒応答に関連するヒアルロニダーゼの阻害活性と、ラット好塩基球性白血病細胞 RBL-2H3 を用いた脱顆粒抑制活性の評価を行った。ヒアルロニダーゼ阻害試験において、直鎖アシル基を持つ 6-Acyl-AA-2G の IC₅₀ は、陽性対照のクロモグリク酸ナトリウムよりもはるかに低濃度だった。また、アシル基の炭素鎖が伸長するほど低濃度で発揮した。6-Acyl-AA-2G の代謝物である AA、AA-2G や 6-Acyl-AA の活性が 6-Acyl-AA-2G よりも弱かったことから、6-Acyl-AA-2G のヒアルロニダーゼ阻害活性は 6-Acyl-AA-2G そのものの活性であると考えられる。脱顆粒抑制活性においても、アシル基の炭素鎖が伸長するほど低濃度で活性を発揮した。AA、AA-2G は濃度依存的に脱顆粒を抑制する傾向はあったが有意な活性は認められなかった。従って、6-Acyl-AA-2G の脱顆粒抑制作用も 6-Acyl-AA-2G 自体の作用であると言える。以上より、直鎖アシル基を持つ 6-Acyl-AA-2G はプロビタミン C 剤としてだけでなく、抗アレルギー薬としての利用も期待できる。