

26PA-pm425

PDE5 Assay によるシルデナフィル類似化合物を含有する健康食品の検出

○市川 瑤子¹, 西山 麗¹, 植村 望美¹, 岸本 清子¹, 佐藤 美紀¹, 中嶋 順一¹, 吉川 晶子², 鈴木 仁¹, 猪又 明子¹, 東屋 功², 守安 貴子¹ (¹都健安研セ, ²東邦大薬)

【目的】ホスホジエステラーゼ5(PDE5)阻害作用によるED治療効果を期待して、シルデナフィル類似化合物を配合した健康食品の発見事例が後を絶たない。これらの化合物の多くは、既存の医薬品との構造類似性を中心にPDE5阻害活性が推定されてきたが、これをより確実にするための情報として *in vitro* 系による評価が重要と考える。そこで、PDE5 Assay により健康食品抽出液のPDE5A1阻害活性を評価し、活性評価スクリーニングとなるか否かを検討した。併せて、新たに検出した化合物の構造解析及びPDE5A1阻害活性評価を行った。

【方法】都内販売店及び通販サイトで購入した男性機能の向上を謳う健康食品10製品を試料とした。①PDE5 Assay として、PDE5A1 Assay kit を用いて各試料の抽出液を反応させ、蛍光偏光を測定した。PDE5A1阻害活性は、同時測定したシルデナフィルクエン酸塩の結果と比較し評価した。②LC-PDA 及び LC-MS により含有成分の確認と定量を行った。③検出した化合物のうち国内での検出事例がなかったデスカルボンシルデナフィルについて、試料から単離し、高分解能 MS、NMR 及び単結晶 X線構造解析により構造を確認した。さらに、同物質のPDE5A1に対するIC₅₀値を測定した。

【結果】PDE5 Assay では、10試料中5試料が顕著なPDE5A1阻害活性を示した。LC-PDA 及び LC-MS の結果、同5試料からジメチルジチオデナフィル(2試料)、シルデナフィル(2試料)及びデスカルボンシルデナフィル(1試料)を検出し、PDE5 Assay の結果と一致した。また、デスカルボンシルデナフィルのPDE5A1阻害活性が明らかになった。