

129th annual convention Japanese pharmacy meeting

26Q-am232

[Antitumor activity of constituents from the Brazilian plant *Tabebuia avellanedae*]ブラジル原産 *Tabebuia avellanedae* 由来成分の抗腫瘍活性

Masafumi Kaneko and Mitsuaki Yamashita (Faculty of Pharmacy, Takasaki University of Health and Welfare), Harukuni Tokuda (Department of Biochemistry, Kyoto Prefectural University of Medicine), Bacowsky Helmut (Zentrum Nosomi Clinic), Akira Iida (Faculty of Agriculture, Kinki University)

## 【目的】

*Tabebuia avellanedae* (Bignoniaceae:ノウゼンカズラ科) はブラジルから北アルゼンチンにいたる南アメリカに自生する樹木で、古くから様々な病気に効果のある伝承薬として知られている。この植物の内皮はアジア等へ輸出され、ハーブティーや健康食品として利用されている。近年、本植物ががんの効果のある医薬資源として着目されて以来、その成分研究が進み、(S)-5-hydroxy-2-(1-hydroxyethyl)-naphtho[2,3-b]-furan-4,9-dione (NQ801) 等のナフトキノン類やアントラキノン類が有効成分として報告されている。我々は *T. avellanedae* の抽出物やその成分であるNQ801が *in vitro* の系でTPAによる発がんの化学予防効果を示すこと、また *in vivo* の系ではマウス皮膚二段階発がん試験において阻害効果を示すことを報告した。*T. avellanedae* 由来成分をがん治療に用いる際の安全性と信頼性については未評価のままで、更なる活性の評価が求められるため、乳がん細胞MCF-7に対する細胞毒性と増殖抑制活性を調べた。さらにこれらの医薬資源の前臨床試験の結果についても報告する。

## 【結果】

*T. avellanedae* 抽出物とNQ801がMCF-7細胞に対して、濃度依存的に増殖抑制効果を示すことを見出した。細胞毒性に関しては、抽出物では微弱な活性であったが、そこに含有する主たる活性成分であるNQ801については強い活性がみられた。また、小規模な臨床試験においても *T. avellanedae* 抽出物がヒトカルシノーマに対して治療効果を示すことが明らかとなった。

## 【考察】

*T. avellanedae* 由来成分の効率的生産法の開発と、その生物活性の解明により、本植物の医薬素材としての応用が期待される。

## ■ English abstract

*Tabebuia avellanedae* (Bignoniaceae), which is native in South America from Brazil to northern Argentina, is well known in traditional folk medicine used for the treatment of various diseases during five hundred years. The inner bark of this plant produced in Brazil is distributed in Asia as a herb tea and healthy purpose. Naphthoquinones and anthraquinones such as (S)-5-hydroxy-2-(1-hydroxyethyl)-naphtho[2,3-b]-furan-4,9-dione (NQ801) are known as the active agent against cancers. Previously, we reported that the extract of *T. avellanedae* and including naphthoquinones type compounds, NQ801, inhibited TPA-induced *in vitro* conventional assay for chemopreventive activity and also inhibited TPA-induced *in vivo* assay on two-stage mouse skin test. The safety and reliability of this material for breast cancer remain to be rigorously evaluated and in order to more active potency of these materials, samples were tested for cytotoxic and antiproliferative activity against breast cancer cell line, MCF-7. Furthermore, the preclinical trials on anti-cancer activity will be discussed.

We found that MCF-7 cell exhibited a concentration dependent antiproliferative activity by the extract of *T. avellanedae* and NQ801 in 3 days treatment. Cytotoxic activity was higher in NQ801 compared to the extract of *T. avellanedae*. These data provide evidence that two materials may be applicable in the treatment of disease by delaying the onset of proliferation.

The constituents from *T. avellanedae* are worthy of medicinal resource on effective production of active compounds and evaluation of its activity.