〔薬 学 雑 誌〕
YAKUGAKU ZASSHI
84 (11) 1143 ~ 1144(1964)

UDC 615.713.3 : 581.6

萩庭丈寿, 原田正敏: 医薬資源の開発に関する研究(第2報^{*1}) ベルベリン
資源植物としての *Xanthorrhiza apiifolia* L'HÉRIT

Joju Haginiwa and Masatoshi Harada: Studies on the Development of
Medicinal Resources. II. *Xanthorrhiza apiifolia* L'HÉRIT as
the Plant of Berberine Resources.

(Faculty of Pharmacy, Chiba University^{*2})

On the chemical components of *Xanthorrhiza apiifolia* L'HÉRIT, grown in the south of the United States, as one of the berberine containing drugs, and their pharmacological activities, some remarkable findings were already reported. The cultivation and the yield of berberine·HCl from aqueous extract were examined and comparing with Japanese *Phellodendron amurense* Rupr. and *Coptis japonica* MAKINO, the cultivation was found to be easy and also this plant was found to be pretty noticeable plant-resources for berberine·HCl. The base in this plant is also identified with the tetrahydro derivative to be berberine.

(Received June 5, 1964)

数あるベルベリン含有植物中本邦で実用的にこの抽出に用いられる原料植物は第1にキハダ(黄柏)である。その樹皮オウバクは家庭薬, 民間薬の原料に多量消費されるため栽植が間に合わず近年欠乏の一途をたどっている。またオウバクは水溶性の粘物質を多量に含み, これは著者の既報¹⁾のごとく生薬の薬効としては好ましい一面もあるが, オウバクの水による抽出液から直接塩酸ベルベリンを沈殿させる上にははなはだ不便である。この点オウレンはベルベリンの含有量高く粘液質を含まず好都合で将来ともあるいは林業の副産物としても考慮されるべきものではあろうが, 栽培に長年月を要するうらみがある。

著者は先にベルベリン含有生薬を主として薬物学的見地から検討し, その際一つの材料としてキンボウゲ科に属する *Xanthorrhiza apiifolia* L'HÉRIT の根をとりあげ, 本個体がベルベリン含有量や薬理試験の結果の点で少しく注目され得ることに言及した。その後さらに栽培試験, 地上部分の成分, ベルベリンの抽出法などを検討し, この植物は少なくとも千葉地方では栽培がきわめて容易なこと, さらに地上, 地下部よりのベルベリンの抽出がはなはだ簡単に行ない得ることを知りベルベリン資源として好適なことを認めたのでこれを報告する。

本植物はアメリカ南部原産の灌木で幹の高さ 1 m., 直径 0.5~1.5 cm. で地下茎をひき繁殖する。幹, 地下茎, 根ともに黄色を呈し, 4月に暗紫色, 下垂状の花をつける。土壌結束用として植えられ, また根は黄色染料の原料とされる。成分面での研究報告はわずかにベルベリンの記載²⁾がある以外はほとんどみあたらない。この植物の繁殖, 栽培はきわめて簡単である。厳寒, 酷暑時に移植, 株分けを行なっても枯死することはほとんどないが, 好適期は春発芽前と秋落葉時で地下部 12~16 cm. をつけた株を株間 25~30 cm., 畝幅 50 cm. ほどに植えつけばよい。3.3 m² 当たりの植付けの苗は乾燥量として地上, 地下部合わせて約 0.6 kg. である。耕地は肥沃で適湿の陽地がもっともよいが半陰地や乾燥地でもよく育ち病虫害の心配はほとんどない。管理は一般作物と同様適宜除草を行なう。春一夏一秋にかけ盛んに地下部が伸び満3年で飽和状態となる。こうなるといわゆる被地植物なので雑草の侵入する余地はなくなり除草の管理が省ける。栽培期間と生薬の収量との関係の1例は Table I のごとくであるが半陰地や除草せぬ地では収量は落ちる。

ついで生薬各部のエタノール抽出による総色素量とベルベリン含有量を定量し, 後者は地上部, 地下部とも大差なく約 1.5%, ^{*3} および前者の 80~90% を占めるという値を与えた。本生薬の水性流エキスよりベルベリン

^{*1} 第1報: 本誌, 83, 597 (1963).

^{*2} Yahagi, Chiba.

^{*3} オウバク, オウレン中のベルベリン含有量はそれぞれ 1% 以上, 3.5% 以上(局方)である。

1) 萩庭, 原田: 本誌, 82, 726 (1962).

2) C. Wehmer: "Die Pflanzenstoffe," zweite Auflage, 314 (1929), Gustav Fischer, JENA.

TABLE I. Yield of the Crude Drug per 3.3 m² (kg.)

Period of cultivation (month)	Part on field	Part in field
12	0.15	1.5
36	2	5

(塩酸塩)を塩酸のみを用いて 1.2% あまり収量し得、さらにアセトン付加物として 0.07% を取得した。なおベルベリンであることの証明はパラジウム-炭による接触還元または亜鉛-酢酸による還元を行ない、標準ベルベリンから同様にして誘導した *dl*-テトラヒドロベルベリン (m.p. 171°) との混融によった。

オウバクやオウレンと並んで生薬または粉末生薬としての見地から本植物を評価すると、上 2 種はそれぞれ特徴ある薬効を備えており、一応著者は本植物の根はオウレンにもっとも近似していると考えてはいるが、和漢薬としての使用面の歴史がない。一方上記の結果よりベルベリン資源としての見地からは本植物は比較的高く評価されてよいと思われる。すなわち栽培が容易で採取までの期間が短いこと、塩酸ベルベリンの単離が、取得面、操作面、経済面などできわめて好条件にある。

実 験 の 部

生薬の総色素量と含有ベルベリンの定量 上記既報に準じ標準ベルベリンとで比色定量を行なった。抽出は 50% EtOH で抽出液の黄色がほぼ一定になるまで反覆した。

生薬よりベルベリン (塩酸塩) の抽出 細切した地上部、地下部ともに同じ抽出法をとり得る。乾燥原料 1 kg. に水 15~20 L. を数回に分ち加え煮沸浸出し、浸出液は減圧濃縮して約 1.5 L. となしコンゴ赤紙酸性を呈するまで conc. HCl を加え冷処に 1~2 日放置すれば塩基の HCl 塩が沈殿する。これを少量の水で洗い MeOH または MeOH-EtOH より再結晶して塩酸ベルベリンを得る。収量 12~13 g. 母液は NaOH アルカリ性 (フェノールフタレン) となしアセトン 30~35 ml. を加え付加物を沈殿させ、水洗後 dil. HCl と加温して塩酸ベルベリンを得る。収量約 0.7 g. $C_{20}H_{18}O_4NCl \cdot 2H_2O$ Anal. Calcd.: C, 58.90; H, 5.44; N, 3.43. Found: C, 58.65; H, 5.38; N, 3.84.

***dl*-テトラヒドロベルベリンの誘導** 上記塩酸ベルベリンを谷等³⁾の方法で接触還元または Zn-AcOH で還元を行なうと無色針状晶 m.p. 171° を得る。標準塩酸ベルベリンより同様にして得た *dl*-テトラヒドロベルベリンと混融し融点降下せず。 $C_{20}H_{21}O_4N$ Anal. Calcd.: C, 70.78; H, 6.24; N, 4.13. Found: C, 70.85; H, 6.22; N, 3.97.

千葉大学薬学部

3) 谷, 高尾: 本誌, 77, 805 (1957).