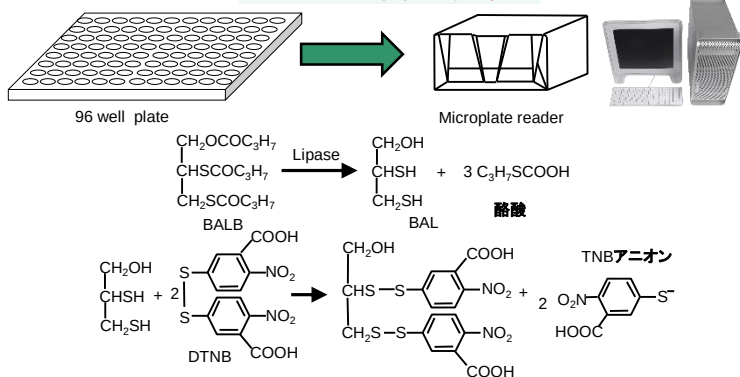


茶カテキンのリパーゼの抑制効果 ーカテキン関連物質を用いた抑制モードの推定ー

技術の特徴

- ・茶カテキン類は血圧降下作用、抗炎症作用、高肥満作用等々活性が見出されている。
- ・高肥満作用の一つとして、リパーゼの抑制効果を調べ、その抑制モードを詳細に検討した。
- ・これまでの報告では、抑制モードについて結論が様々あり、2つのプロットを用いてモードを明らかにした。

リパーゼ活性測定系



研究の内容

雑穀や茶に含まれるフラボノイドを中心に、膵臓リパーゼの抑制効果を確認し、抑制モードの解析を行った。

リパーゼ抑制活性は、市販のヒト血中リパーゼ活性測定用試薬「リパーゼキットS」を用いた。すなわち96穴プレートを用い、ブタ膵臓リパーゼを用い、合成基質2,3-dimercapto-1-propanol tributyrateを使用し、発色剤を用いた方法で行った。各データは50%抑制濃度(IC50)を求めた後、Lineweaver-Burk(L-B)プロットおよびDixonプロットで解析し、その抑制モードを推測した。

結果と今後の展開

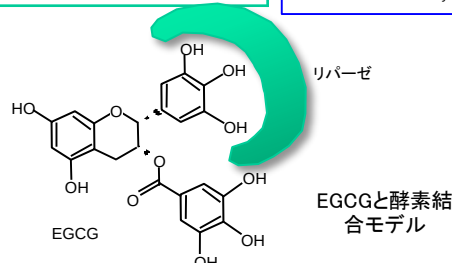
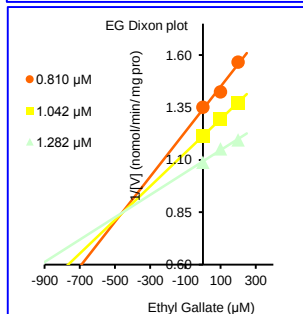
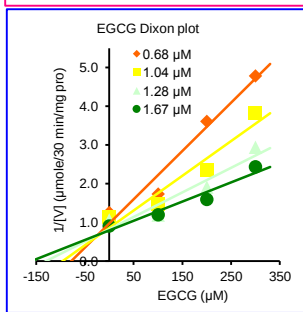
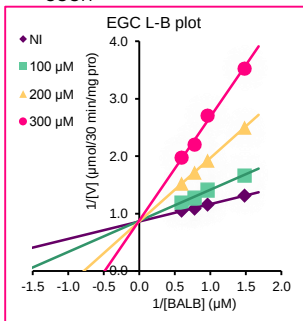
抑制の強い物質は、すべてガロイル基(ベンゼン環に水酸基3つ)を有する物質であった。結合定数(Ki)はEGが小さく、抑制活性と結合力は一致しなかった。これまでの報告では、抑制モードについて競合型とも非競合型とも提唱されていたが、このガロイル基を有するフラボノイドはほぼ、**競合型**であることが確認された。これらの抑制物質は特にお茶に多く含まれているが、活性成分の構造が明らかになったことより、効率の高い脂肪吸収抑制効果を持つ機能性食品が開発されることが期待される。

参考

1. Abu Torab M.A. Rahim, Yoko Takahashi, and Kohji Yamaki. Mode of pancreatic lipase inhibition activity in vitro by some flavonoids and non-flavonoid polyphenols. *Food Research International* **75**, 289-294 (2015).

Flavonoids	IC50 (μM)
Apigenin and its glycosides	
Apigenin (4',5,7-trihydroxyflavone)	1.37E+21
Apigenin-7-glucoside	7.57E+10
Isovitexin (Apigenin-6-C-glucoside)	5.28E+11
Rhoifolin (Apigenin-7-rhamnogalactoside)	2.23E+05
Saponarin (Isovitexin-7-O-glucoside)	1.85E+05
Vitexin (Apigenin-8-C-glucoside)	ND
Vitexin-2"-O-rhamnoside	4.44E+33
Catechins derivatives	
Epicatechin gallate (ECG)	4.6E+05
Epigallocatechin (EGC)	237.3 ± 34.8*
Epigallocatechin-3 gallate (EGCG)	391.2 ± 49.7*
Non-flavonoids	
Phenolic acids	
Gallic Acid (GA)	387.2 ± 27.3*
Ellagic acid (EA)	8.86E+07
Ferulic acid (FA)	5030.0 ± 250.0*
Gallic acid derivatives	
Ethyl gallate (EG)	4.5E+03 ± 0.7*
Galloyl glucose (GG)	4.4E+05

ND, Not detected; *Mean ± SD, n=4-6; Bold figures indicate relatively high inhibitor potency



EGCGと酵素結合モデル