

「タイトル：ケルセチン配糖体を用いたOATP2B1標的型吸収促進法の開発」

研究者名:小倉 次郎
所属・役職:北海道大学薬学研究院・助教

共同研究者:なし

番号: H26 FT-7	研究分野	研究キーワード
	健康に有効な道産食 素材の探索・分析機能 解明	キーワード:ケルセチン 配糖体、OATP2B1、 吸収改善、抗酸化物質

背景・目的

抗酸化物質はanti-agingや疾病予防効果を期待して使用される一方、吸収性の問題からその効果を十分に発揮できていない。これまでに、ケルセチン配糖体のひとつであるルチンがOATP2B1を介した物質輸送を促進することを見出している。しかしながら、ルチンは難吸収性のため、消化管で輸送促進効果を示さなかった。本研究ではルチンに代わるOATP2B1標的型吸収促進剤の候補として、消化管吸収性に優れるケルセチン配糖体に着目して検討を行った。

研究の成果

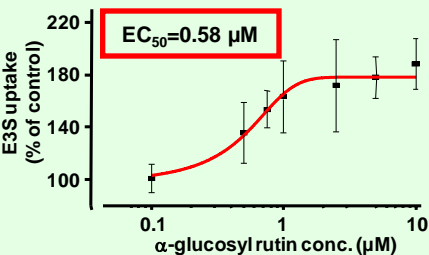
本検討により、ルチンに代わるOATP2B1標的型吸収促進剤の候補として、消化管吸収性に優れるα-glucosyl rutin、quercetin-3,4'-diglucosideを見出した。これらのOATP2B1輸送促進効果のEC₅₀はそれぞれ0.58 μM、1.51 μMであり、ルチンのEC₅₀ (2.32 μM) より低濃度で効果を示すことが明らかとなった。α-glucosyl rutinのバイオアベイラビリティ (4.1%) はルチン (0.8%) の約5倍である¹⁾。また、quercetin-3,4'-diglucosideを2 mg摂取した際の血中濃度はルチンより吸収性に優れるquercetin (バイオアベイラビリティ:2.0%¹⁾) を同量摂取した場合より高い²⁾。以上のことから、これらケルセチン配糖体はOATP2B1基質に対する吸収促進剤として有用と示唆された。
¹⁾ Makino et al., Biol. Pharm. Bull. (2009), ²⁾ Murota et al., Arch. Biochem. Biophys. (2010).

将来展望

今後は、ヒト消化管モデル細胞株であるCaco-2細胞を用いて、消化管における吸収促進効果を検討するとともに、ポリフェノールをはじめとする各種有機アニオン性抗酸化物質のOATP2B1に対する親和性を検討し、OATP2B1と高い親和性を有する抗酸化物質の探索を行う。以上の検討から、OATP2B1に高い親和性を有する抗酸化物質とケルセチン配糖体を併用することで優れた抗酸化サプリメント製剤の開発が実現すると期待される。

図表・グラフ・写真・ポンチ絵・フロー図:

<α-glucosyl rutin>



<Quercetin-3,4'-diglucoside>

