

〔Japan. J. Pharmacol., 29, 17 (1979)〕

### Hydrolysis of Ester-Type Drugs by the Purified Esterase from Human Intestinal Mucosa

MICHIKO INOUE\*, MASAKO MORIKAWA\*, MINORU TSUBOI\*,  
TAKASHI YAMADA\*, MAMORU SUGIURA

ヒト小腸粘膜より精製したエステラーゼによるエステル型薬物の加水分解

井上みち子\*, 森川正子\*, 坪井 実\*, 山田 隆\*, 杉浦 衛

ヒト小腸粘膜から TritonX-100 による可溶化, DEAE-cellulose, SephadexG-100, hydroxylapatite, 等電点分離により, エステラーゼを 210 倍まで精製した。精製エステラーゼは disc 電気泳動的に均一であり, 分子量は  $5.5 \times 10^4$ , 等電点は pH 5.02, diethyl *p*-nitro phenyl phosphate(F-600)および diisopropyl fluorophosphate によって強く阻害されたが, eserine sulfate および *p*-chloromercuribenzoate による阻害は認められなく, 本エステラーゼは carboxylesterase の 1 つであることが明らかとなった。また aspirin, clofibrate, indanylcarbenicillin, procaine のようなエステル型薬物を加水分解したが, アミド型およびコリン型薬物の加水分解は認められなかった (Table I)。

TABLE I. Substrate specificities of esterase from human intestinal mucosa

Substrate	Relative rates of hydrolysis
$\beta$ -Naphthyl acetate	100
$\beta$ -Naphthyl propionate	311
$\beta$ -Naphthyl butyrate	354
$\beta$ -Naphthyl valerate	291
$\beta$ -Naphthyl caprate	23
$\beta$ -Naphthyl oleate	N.D.
Phenyl acetate	102
Tributyryn	95
Olive oil	N.D.
Aspirin	$81 \times 10^{-3}$
Clofibrate	$31 \times 10^{-3}$
Indanyl carbenicillin	$15 \times 10^{-3}$
Procaine	$39 \times 10^{-3}$
Procainamide	N.D.
Lidocaine	N.D.
Atropine	N.D.
Acetylcholine	N.D.
Benzoylcholine	N.D.
Succinylcholine	N.D.
Phenacetin	N.D.

The rates of hydrolysis were expressed as the relative rate to that obtained using  $\beta$ -naphthyl acetate. N.D.: Not detectable.

\* 東京薬科大学