

原料トピック

シクロデキストリンの有用性⑥

CoQ10包接体の生体利用能向上に関するメカニズムを解明

シクロケム

CoQ10は凝集性の脂溶性物質であるために、経口摂取してもその生体利用能は極めて低い。そこで、一般的には油脂系乳化剤を用いて水に乳化させた「水溶性CoQ10」が、吸収性を向上させた製剤として知られている。この水溶性CoQ10と、「CoQ10-γCD包接体」の生体利用能を健康人男女72人への経口摂取による比較検討するとγCD包接体による生体利用能の方が有意に高いことが示され、学術論文に報告されている。し

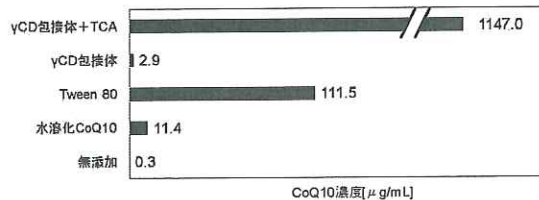
かし、水への溶解度については、水溶性CoQ10の方が高いため、なぜCoQ10-γCD包接体の生体利用能が高まるか、メカニズムは明らかではなかった。

この度シクロケム(東京都中央区、www.coq10.jp 614-7147)は、腸管内に存在する「胆汁酸」による乳化作用がこの吸収性改善メカニズムの鍵を握っていることを明らかにした。

実験では通常のCoQ10に各種添加剤を一定量混合し水を加えて懸濁液

を得た。その結果、γCD包接体のCoQ10の溶解度はCoQ10原本よりも高いものの、乳化剤や界面活性剤を添加した際の溶解度に比べて低い。しかし、γCD包接体に胆汁酸の成分であるタウロコール酸(TCA)やグルチルリン酸シカリウム(GZK2)を添加したところ『水溶性CoQ10』の溶解度に比べて約100倍の極めて高い溶解度を示した。(図参

各種添加剤によるCoQ10溶解度変化



照) 腸まで到達して胆汁酸と出会うと、CoQ10よりも高い結合定数を持つ胆汁酸とのゲスト分子入れ替えが行われる。γCDから飛び出したCoQ10は分子の一つ一つは胆汁酸に囲まれ、外側は親水性、内側は親油性のミセルと呼ばれる状態を形成し、分子レベルで腸管から容易に吸収される。これが『水溶性CoQ10』などの分子集合体のミセル化と大きく異なるところで、吸収性が大幅に向上した理由である。

性、内側は親油性のミセルと呼ばれる状態を形成し、分子レベルで腸管から容易に吸収される。これが『水溶性CoQ10』などの分子集合体のミセル化と大きく異なるところで、吸収性が大幅に向上した理由である。

結論として、CoQ10-γCD包接体は経口摂取後、不溶性で安定な状態で腸管内まで到達する。そこでγCD包接体は胆汁酸とのゲスト分子入れ替えが行われ、分離したCoQ10は分子レベルで胆汁酸によって乳化可溶性され、効率よく腸管吸収されたものと考えられる。シクロケムはこの結果について、8月28日からオーストラリアで開催されるAsian Cyclohextrin Conference 2011年6月19日から台北で開催される国際シンポジウム IUMRS-ICAZ2011において招待講演で発表する予定だ。

肌への浸透も34倍強に向上

製剤化の工程で通常のCoQ10をγCDで包接する際、γCDはCoQ10の分子一つ一つを包み込む。こうしてCoQ10-γCD包接体は出来上

る。これが体内に入り、腸まで到達して胆汁酸と出会うと、CoQ10よりも高い結合定数を持つ胆汁酸とのゲスト分子入れ替えが行われる。γCDから飛び出したCoQ10は分子の一つ一つは胆汁酸に囲まれ、外側は親水性、内側は親油性のミセルと呼ばれる状態を形成し、分子レベルで腸管から容易に吸収される。これが『水溶性CoQ10』などの分子集合体のミセル化と大きく異なるところで、吸収性が大幅に向上した理由である。

そこで、CaCO₂膜やヒト3次元培養表皮を用いてCoQ10の透過性や取り込み量を測定したところCoQ10-γCD包接体はTCAやGZK2の組合せで極めて高い数値を得た。もちろん胆汁酸であるTCAを肌に塗ることは難しいが、CoQ10を肌塗布した後、TCAと同様の働きを持つGZK2を肌に塗

布することで、無添加のCoQ10と比較して34倍強表皮組織へCoQ10が取り込まれることが分かった。