

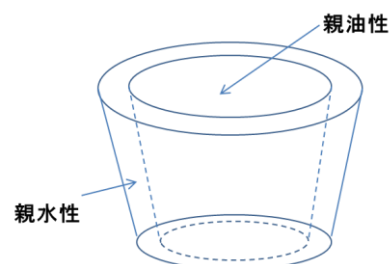
シクロデキストリンによる疎水性分子の可溶化

シクロデキストリン製品選択ガイド

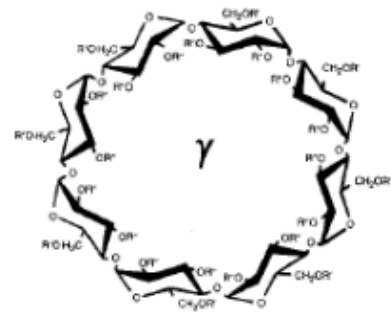
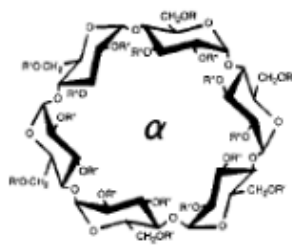
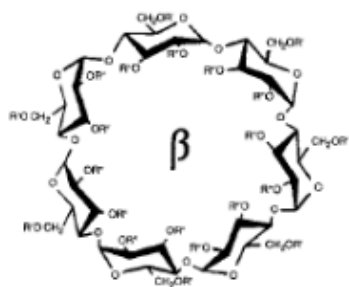
疎水性分子を水や培地に溶解する場合、DMSO やエタノール等で溶解したものを水で希釈する方法が一般的ですが、脂溶性ビタミンおよびホルモンなどの多くの代謝的に重要な化合物は、水溶液中での溶解度が非常に低く、水への希釈段階で析出してしまいます。このような疎水性分子を組織培養・細胞培養または他の水系のアプリケーションにおいて可溶化するために様々な技術が使用されてきました。その中でもシクロデキストリンをこれらの化合物の溶解を促進するためのキャリア分子として使用するアプローチは頻繁に利用されます。

天然のシクロデキストリン（とりわけβ体）は水溶性に乏しく、シクロデキストリンの有効な錯化剤への適用を妨げてきましたが、1960年代後半に、2-、3-および6-ヒドロキシル部位を化学的に置換したシクロデキストリンにおいて溶解度が大きく向上し、50%（w/v）濃度の水溶性を達成しました。

シクロデキストリンの空洞のサイズは錯体化の決定的な要因で、空洞のサイズが取り込まれる分子のサイズに適合していることは良好な取り込み特性を示すのに重要な因子になります。α-シクロデキストリンは空洞が小さくあまり多くの分子の取り込みには適していない一方、γ-シクロデキストリンは取り込まれる多くの分子よりもはるかに大きな空洞を有し、シクロデキストリン内の疎水性電荷は取り込まれる分子と効果的に相互作用することができません。β-シクロデキストリンについては、ホルモンやビタミンその他組織および細胞培養用途に使用される化合物を包接するのにサイズが最も適しており、同用途に広く用いられます。

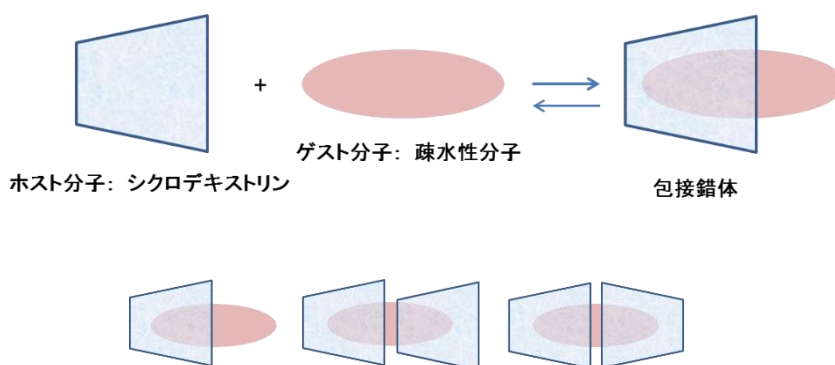


品名	グルコース残基数	空洞サイズ(nm)	包接するゲスト分子(例)	水溶性(g/100ML)
α-CD	6	0.5~0.6	エタノール、メタノール、ベンゼン、アリルイロチオシアナート	13.0
β-CD	7	0.7~0.8	ポリフェノール、コレステロール、メントール、ナフタレン	1.9
γ-CD	8	0.9~1.0	DHA, EPA, コエンザイムQ10	30.0



包接が起こる際にはゲスト分子全体がシクロデキストリンの空洞に取り込まれる必要はなく、疎水性が高い分子の一部が空洞にフィットすれば錯体形成が観察される場合があります。

シクロデキストリン包接現象は化学平衡に立脚しており、1:1の包接化合物以外にも、1:2、2:2、2:1など種々の化学量論比が存在します。



シクロデキストリンと疎水性化合物を一定の比率（1:1錯体であれば1:1）で混合・攪拌することで疎水分子は包接錯体を形成し水に溶解します。攪拌後、静置・冷却することで結晶化を促し、析出した結晶のろ過回収によって錯体（粉体）が得られます。汎用の化合物については既製品で販売しております。

疎水性分子のシクロデキストリン内への取り込みは、水の反発力を受けることによって起こりますが、この反応は可逆的で、こうしてできた水溶性のシクロデキストリン錯体をさらに多量の水溶性溶媒で希釈すると、逆のプロセスが進行し疎水性分子が水溶液中に放出されます。一定濃度で少しずつ有効成分を放出する特性を生かし、徐放用途にも使用されます。

シクロデキストリンにはその他以下のような応用例が知られています。

紫外線や熱などに弱い物質や、酸化、加水分解されやすい不安定な物質を安定化し保存性を高めます。

（シクロデキストリンの熱安定性：220°C程度）

苦みや異臭の矯味、矯臭・消臭（マスキング）、コレステロールの除去など気体や液体を包接することで安定な粉末にします。

Product Name	Formula	Mol Wt.	Assay (%)	Application	Solubility	Cat. No.
α -Cyclodextrin	$C_{36}H_{60}O_{30}$	972.84	≥ 98	-	H ₂ O 50 mg/mL	C4642
α -Cyclodextrin	$C_{36}H_{60}O_{30}$	972.84	≥ 98	cell culture tested	H ₂ O 50 mg/mL	C4680
β -Cyclodextrin	$C_{42}H_{70}O_{35}$	1134.98	≥ 98	-	1 M NH ₄ OH 50 mg/mL	C4767
β -Cyclodextrin	$C_{42}H_{70}O_{35}$	1134.98	≥ 98	cell culture tested	1 M NaOH 50 mg/mL	C4805
γ -Cyclodextrin	$C_{48}H_{80}O_{40}$	1297.12	≥ 99	-	1 M NH ₄ OH 50 mg/mL	C4892
γ -Cyclodextrin	$C_{48}H_{80}O_{40}$	1297.12	≥ 98	cell culture tested	1 M NaOH 25 mg/mL, may be clear to slightly hazy	C4930
(2-Hydroxypropyl)- β -cyclodextrin	-	-	-	-	H ₂ O 45 % (w/v)	H107
(2-Hydroxypropyl)- β -cyclodextrin extent of labeling 4 - 10 (determined by NMR)	-	-	-	cell culture tested	H ₂ O 100 mg/mL	C0926
(2-Hydroxypropyl)- β -cyclodextrin 45 % (w/v) in H ₂ O	$(C_6H_9O_5)_7$ $(C_3H_7O)_4.5$	1393.82	-	-	-	H5784
(2-Hydroxypropyl)- γ -cyclodextrin	-	-	-	-	H ₂ O 450 mg/mL	H125
Methyl- β -cyclodextrin extent of labeling 1.5 - 2.1 methyl per 1 mol	-	-	-	cell culture tested	H ₂ O 50 mg/mL	C4555

上記他、置換度の異なる(2-ヒドロキシプロピル)- β -シクロデキストリンなどもご用意しております。

カタログ品につきましては、試験研究用のみを目的として販売されております。ヒトまたは動物用の体外診断薬、食品、医薬品、医療用機器、化粧品その他の試験研究以外の用途に用いることはできませんので予めご了承ください。

シグマ アルドリッチ ジャパン

ライフサイエンス サイエンス & ラボソリューションズ事業本部 〒153-8927 東京都目黒区下目黒 1-8-1 アルコタワー 5F

シグマ アルドリッチ ジャパン合同会社はメルクのグループ会社です。

E-mail: jpts@merckgroup.com Tel: 03-6756-8245

本紙記載の製品は試験・研究用です。ヒト、動物への治療、もしくは診断目的として使用しないようご注意ください。なお、品目、製品情報、価格等は予告なく変更される場合がございます。予めご了承ください。記載内容は2022年9月時点の情報です。©2022 Merck KGaA, Darmstadt, Germany. All rights reserved. Merck, the vibrant M, and Sigma-Aldrich are trademarks of Merck KGaA, Darmstadt, Germany or its affiliates. All other trademarks are the property of their respective owners. Detailed information on trademarks is available via publicly accessible resources.

Lit. No. TSM034A-2209-M