



高い水溶性で用途が広がる 還元型クルクミン誘導体



薬学部 薬学科 講師

瀬戸口 修一



薬学部 薬学科 教授

松永 和久

分野 創薬

キーワード 還元型クルクミン、水溶性

概要

当該還元型クルクミン誘導体は、そのままでは水に溶けない還元型クルクミンに比べ、水によく溶け、組織や細胞中で速やかに還元型クルクミンと無害なアミノ酸に再変換されるプロドラッグとして機能する。還元型クルクミンはクルクミンのような強い黄色の着色がないため、外用など多様な投与形態を採ることができる。

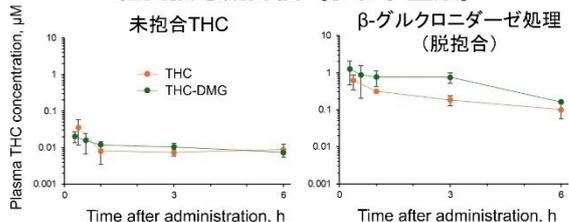
還元型クルクミンはクルクミンに匹敵する薬理作用や独自の薬理作用を持つことが報告されているが、水に溶けない。このため経口投与における腸管吸収性が低く、水に溶解する投与形態では多量の可溶化剤を必要とする。新技術では添加剤を使うことなく水に溶解しただけの投与処方でも同等以上の効果が期待できる。

水溶性改善効果

+ H₂O
1000 9 μ L



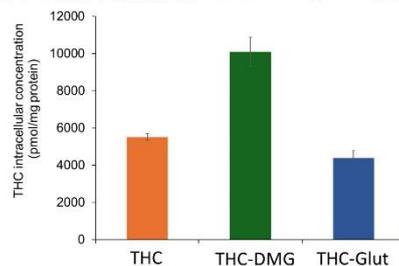
経口投与剤評価 (ラット血漿)



投与化合物	AUC (μ M · h)	
	未抱合体	未抱合体 + 脱抱合体
THC	0.0600 ± 0.0267	1.333 ± 0.3429
THC-DMG	0.0632 ± 0.0116	3.742 ± 1.212

THC-DMGの優れた経口吸収性

ヒト表皮角化細胞株HaCaTへのTHC送達性



エステル誘導体	略号	R ₁ , R ₂
N,N-dimethylglycinate	DMG	-COCH ₂ N(CH ₃) ₂
hemi-glutarate	Glut	-COCH ₂ CH ₂ CH ₂ COOH

THC-DMGの高いTHC細胞内送達性

特徴、効果、独創的な点

- すみやかに水に溶ける還元型クルクミンとして利用できる
- 可溶化剤を使わず還元型クルクミンの経口吸収性を増大できる
- 皮膚外用で用いやすく還元型クルクミンの送達性が高い

適用分野、用途

- 経口投与製剤 (健康食品等を含む)
- 皮膚外用剤 (化粧品、医薬部外品等を含む)
- 水性製剤 (用時溶解注射剤、点眼剤)

論文、知的財産情報等

テトラヒドロクルクミン誘導体 (特願2024-198973)