



# 複合体安定度定数



## 1) 複合体形成による溶解度への影響

溶解性の低い薬物に溶解補助剤を用いて、複合体形成を行うことで溶解度を高めることができる。

### ・溶解補助剤の例

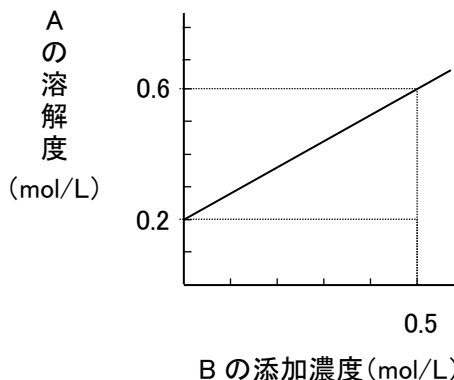
難溶性医薬品 (A)	溶解補助剤 (B)
カフェイン	安息香酸ナトリウム
ヨウ素	ヨウ化カリウム
テオフィリン	エチレンジアミン
プロスタグランジン E <sub>1</sub>	α-シクロデキストリン
イトラコナゾール	ヒドロキシプロピル-β-シクロデキストリン

二つの化合物 A と B が反応して複合体安定度定数 ( $K_c$ ) が用いられ、以下の式で表される。



例) 固体医薬品 A に対する溶解補助剤 B の効果が図に示すような直線になった。B の添加濃度の増加に伴う A の溶解度の増加分を可溶性複合体の生成によるものとして複合体安定度定数 (K) は次式により求めるとき、得られる数値はいくらか。(国家試験改変問題)

$$K = \frac{[AB]}{[A][B]}$$



【練習問題】

問1 ある受容体 (R) に結合するリガンド (L) があり、L は R と 1 : 1 で結合する。この平衡反応の結合定数 ( $K$ ) を  $0.5 \mu\text{M}^{-1}$  とする。1  $\mu\text{M}$  の R が存在しているところに L の濃度が   $\mu\text{M}$  となるように添加したとき、平衡状態において全受容体のうち L が結合した受容体の割合は 60% となった。 にあてはまる数値に最も近いのはどれか。1 つ選べ。ただし、系の体積変化は無視できるものとする。(102 回問 95 改)

- 1 2.40      2 2.80      3 3.00      4 3.20      5 3.60      6 4.00

問2 注射用アルプロスタジルアルファデクス中の  $\alpha$ -シクロデキストリンは、プロスタグランジン  $E_1$  をモル比 1 : 1 で包接する。注射用アルプロスタジルアルファデクス (20  $\mu\text{g}$ ) を  $25^\circ\text{C}$ 、1 mL 注射用水に溶解した。この時、60% のプロスタグランジン  $E_1$  が  $\alpha$ -シクロデキストリンから解離していた。プロスタグランジン  $E_1$  と  $\alpha$ -シクロデキストリンの解離定数 ( $\text{mol} \cdot \text{L}^{-1}$ ) として最も近いのはどれか。1 つ選べ。ただし、この注射用粉末にはプロスタグランジン  $E_1$  が 56.4 nmol、 $\alpha$ -シクロデキストリンが 685 nmol 含まれるとする。(100 回問 198 改)

- 1  $4.8 \times 10^4$       2  $4.8 \times 10^5$       3  $4.8 \times 10^{-4}$   
4  $9.9 \times 10^4$       5  $9.9 \times 10^{-4}$