コントロールドリリリースの 臨床的価値と新たな方向性

特集によせて

FOREWORD

摂南大学 薬学部 薬物送達学研究室

佐久間信至*

コントロールドリリリースは、製剤からの薬物放出プロファイルを制御することにより、作用部位での最適な濃度-時間プロファイルを実現するドラッグデリバリーシステム(DDS)である。その優れた体内動態特性により服薬回数が減るだけでなく、薬物放出が制御されていない通常の製剤で見られる急速な血中薬物濃度の立ち上がり、血中薬物濃度の大きな変動、治療域を超えた血中薬物濃度に起因する副作用の発現リスクが軽減される。その結果、服薬アドヒアランスや治療継続率が改善され、長期の治療成績が向上する。

コントロールドリリリースは、実用的に最も成功している DDS である。その実用化の歴史を語るうえにおいて、まず、Ocusart® に触れなくてはならない。Ocusart® は、緑内障治療薬ピロカルピンを徐放するコンタクトレンズ様の眼内留置製剤であり、DDS の概念が産声をあげてまもない 1969 年、DDS ベンチャー企業のアルザ社(現在はジョンソン・エンド・ジョンソンの一部門)により、DDS の実用化第 1 号として上市された。薬物貯留部を覆った高分子膜を通して薬物放出をコントロールすることにより、1 週間にわたって眼内局所におけるピロカルピン濃度を有効域に保つことができる。薬剤学、製剤学、薬物送達学のどの教科書にも取りあげられている膜透過システムを用いたコントロールドリリリース製剤であり、まさに DDS のレジェンドである。その上市からおよそ半世紀が経過した現在、局所作用から全身作用まで、さまざまな部位に適用するコントロールドリリリース製剤が臨床で用いられている。

コントロールドリリリースの考え方自体は新しいものではなく、既存のコントロールドリリリース技術の完成度も高い。薬物の物性や疾患の特性を考慮した最適化は必要であるものの、優れた体内動態特性を得るための薬物放出プロファイルは、既存の技術を単独あるいは組み合わせることにより、多くは具現化できる。物づくり的な好奇心が失われがちな面はあるものの、コントロールドリリリース技術が導く体内動態の安定化は、さまざまな疾患の薬物治療にインパクトを与え続けている。さらに、新しい製品価値が創造され、コントロールドリリリース技術の重要性はますます高まっている。

本特集において、波多野正和先生らの研究グループ、仲瀬裕志先生らの研究グループには、近年上市されたコントロールドリリリース製剤を題材に、色あせることのないコントロールドリリリース技術の臨床的価値を紹介していただいた。杉林堅次先生には、とかく皮膚の透過促進に関心が集まりがちな経皮吸収製剤について、製剤からの薬物放出制御の意義をまとめていただいた。近藤啓先生と迫和博先生には、顧客価値 / 機能的価値の高い製品を創造するという視点で、経口コントロールドリリリース技術に対する企業のこれからの取り組みを紹介していただいた。田畑泰彦先生には、コントロールドリリリースの今後の方向性の 1 つとして、再生医療の現場でのコントロールドリリリースの必要性をまとめていただいた。技術自体の新鮮さや複雑さは別として、今後も、斬新な目的を持つコントロールドリリリース製剤・製品が実用化されることを期待している。

* Shinji Sakuma : Controlled release-driven clinical benefits and next orientation

Department of Drug Delivery System, Faculty of Pharmaceutical Sciences, Setsunan University