

講義内容

科目名

製剤設計学特論

概要

新薬の素材である低分子化合物では、水に難溶性の分子量の大きな化合物が近年増加しており、溶解性の向上や吸収促進の製剤技術が必要となる。化合物が医薬品として治療効果を示すためには、吸収性、活性発現部位への体内分布、作用点への標的化のための製剤設計技術が必須である。創薬を支える製剤設計とその技術に関わる動向について学び、医薬品製剤に対する理論的知識を深める。

実施日時	講義内容	
平成29年 11月25日(土)	1限	製剤設計する上で、どのような剤形を選択するかは最も重要なポイントの一つである。薬物の性質のみでなく、病態、患者のQOLを含めた製剤設計の基本について概説し、目的に合わせた剤形選択および製剤設計について考える。
	2限	薬物を医薬品とするためには、医薬品添加物を加え、製剤化する必要がある。医薬品添加物の備えるべき条件を踏まえたうえで、代表的な医薬品添加物について、その物性や機能と製剤との関係を考察する。
	3限	薬物や製剤の安定化は、製剤設計をする上で最も重要な課題の一つである。シクロデキストリン、界面活性剤などの機能性分子は、包接錯体、ミセル、エマルジョンなどのコロイド分散系を形成し、安定性や溶解性を向上させる。本講義では、これらの機能性分子の基本的な特性について理解を深め、新たなコロイド分散系による製剤化について考える。
	4限	外用製剤の使用感を評価する方法として官能評価試験が一般的であるが、客観的かつ定量的な評価を行うのは非常に難しい。近年、製品のレオロジー特性と対応する人間の感覚を関連づける、サイコロژی的なアプローチが注目されている。レオロジー測定法について概説し、外用製剤に求められる使用感・感触との関係について考える。

平成29年 12月2日(土)	1 限	脳には脳関門が存在し、循環血液から脳組織への薬物分布が制限されている。中枢神経系 (CNS) 用薬の創薬開発に必要な、血液脳関門 (BBB) の機能特性、脳への薬物輸送機構、脳への薬物移行性の評価法について概説し、脳への薬物送達に必要な製剤設計戦略について考える。
	2 限	現在の薬物投与経路のうち経口投与は約 60%を占め、最も汎用されている投与経路である。しかしながら、経口投与では十分な吸収性や安定性が期待できないペプチド・タンパク性高分子医薬品が最近増加している。将来的にはさらに分子量の大きな遺伝子・核酸医薬の臨床への応用が期待されており、経鼻投与経路を利用した新規投与製剤の開発が望まれている。薬物の経鼻吸収性と鼻腔内投与型製剤の開発の現状と展望について概説し、鼻から脳への薬物送達の可能性について考える。
	3 限	難水溶性薬物は創薬研究において開発候補となることが多い。製剤化が困難な難水溶性薬物であっても、開発に与えられる期間は限られており、理論に裏付けされた製剤技術をもって迅速に開発しなければならない。製剤化困難な難水溶性薬物の溶解性改善手法とその物性評価法について概説し、鼻粘膜投与製剤の開発に必要な製剤特性について考える。
	4 限	製薬業界では創薬標的の枯渇が問題視されている。抗体に次ぐ、次世代医薬品として“核酸医薬”の研究が活発化している。“核酸医薬”は従来の低分子医薬や抗体医薬ではターゲットにすることが不可能であった生体内分子に対して作用させることができるため、次世代のバイオ医薬として大いに期待されている。近年進展がめざましい核酸・バイオ医薬の DDS 技術について紹介し、BBB を回避する CNS への薬物送達を例に、鼻から脳へのバイオ医薬の送達と製剤設計の最新動向について講義する。

(1 時限 9 時 00 分～10 時 30 分, 2 時限 10 時 40 分～12 時 10 分, 3 時限 13 時 00 分～14 時 30 分, 4 時限 14 時 40 分～16 時 10 分)