

30【P1】Ⅱ-223

界面活性剤との分子錯体形成を利用したハイドロキノン含有安定型色素沈着治療薬の開発

○飯村 菜穂子¹, 北河 修治¹, 大橋 裕二²(¹新潟薬大薬,²東工大院理工)

【目的】ハイドロキノン (HQ) は、色素沈着症治療として専門医の間で大変注目されているが、酸素、光等に対しての不安定性、皮膚刺激性の高さ等の問題が未だ改善されていないこともあり日本での浸透率はあまり高くない。今回我々は、そのようなハイドロキノンの持つ問題点を界面活性剤と分子錯体を作ることにより改善することに成功した。更に、その界面活性剤/HQ 分子錯体のメラニン合成阻害、皮膚刺激性についても皮膚モデル細胞、小動物を用いて検討を行ったので報告する。

【方法】人体に適用可能な界面活性剤を選択し、界面活性剤と HQ との分子錯体生成を試みた。得られた分子錯体の結晶構造は X 線を用いて決定した。酸素の影響は HQ 単体と界面活性剤/HQ 分子錯体を 37°C、遮光下に放置し、時間経過による HQ の劣化を UV スペクトルを用いて検討した。また耐光性試験は、粒子径を揃えた分子錯体を vacuum sealer で脱気、密閉した後、キセノンランプを用いて照射を行い、経時的 HQ の劣化を UV スペクトルを用いて調べた。更に、界面活性剤/HQ 分子錯体のメラニン合成阻害についてヒト皮膚 3 次元モデル細胞で検討し、皮膚刺激性についてはヘアレスラットでのパッチテストにより観察を行った。

【結果・考察】酸素、光に対して界面活性剤と分子錯体形成した HQ は、それ単体に比べて耐久性が増しているが明らかになった。また分子錯体化された HQ は本来のメラニン合成阻害効果を損なうことなく機能し、低刺激性物質であることも分かった。以上の結果より、HQ は界面活性剤と分子錯体化することにより安定性、安全性を高めることができ、界面活性剤/HQ 分子錯体が色素沈着症等の治療薬として有効に働くことが大いに期待できると考える。