

S15-3 骨粗鬆症治療薬ビスホスホネートの新規経皮吸収型製剤の創製

○勝見 英正¹, 権 英淑², 神山 文男², 山本 昌¹

¹京都薬大, ²コスメディ製薬

ビスホスホネートは、骨粗鬆症や高カルシウム血症など多くの骨・カルシウム代謝疾患に対する第一選択薬であるが、経口投与の bioavailability が 1~2% と極めて低いことに加えて、副作用として消化管障害を惹起する重大な問題がある。ビスホスホネートによる消化管障害を予防するため、服用後 30 分間は座位を保つ必要があるが、座位の保持は骨粗鬆症の約 70% を占める高齢者には大きな負担となり、寝たきりの場合には投与が困難となっている。したがって、利便性と安全性の観点からビスホスホネートの経皮吸収型製剤が開発できれば、患者のコンプライアンス・QOL が著しく改善できると考えられる。しかしながら、ビスホスホネートは、水溶性 (分配係数: 1×10^{-4} 以下) で高い極性を示すことから、一般的には皮膚からの吸収は困難とされる。最近、我々は、ビスホスホネートを皮膚から効率よく吸収させる新たな親水性パッチ製剤を創製することに成功した。本発表では、新規親水性パッチ製剤によるビスホスホネートの皮膚透過性、安全性ならびに各種骨代謝疾患に対する治療効果について紹介する。