

28M-pm24S

脂質異常症治療薬であるフェノフィブラートのBGL化と活性評価

○松下 剛史¹, 渡邊 勝志², 宮本 理人¹, 土屋 浩一郎¹, 根本 尚夫¹ (¹徳島大院薬, ²徳島大薬)

【目的】当研究室で開発された対称分岐型オリゴグリセロール(BGL)は難水溶性化合物の水溶性を高めることを目的とした機能分子である。我々はこの BGL を様々な化合物へ応用し、水溶性の向上のみならず、消化管吸収性や、熱安定性、血管滞留性、細胞内移行性などの改善が見られたことを報告している。今回我々は難水溶性の脂質異常症治療薬であるフェノフィブラート(1)に対しBGLを導入し、その評価を行った。

【結果】フェノフィブラート-BGL 修飾体(2)はフェノフィブラート(1)よりも高い水溶性が観察された。また BGL 修飾体 2 は高脂肪食負荷マウスにおいて、フェノフィブラートより強力な血中トリグリセライド(TG)低下作用を示した。

【考察】難水溶性の医薬品に対して BGL 修飾を行うことで活性を維持したままで水溶性が増強されることを確認した。本薬剤に加え他の様々な難水溶性薬剤に対しても BGL 誘導体を検討し、新たな医薬品の創製を目指したいと考えている。

