

S01-2 経口内服剤開発におけるトレードオフとその克服

近藤 啓¹, ○迫 和博¹

¹アステラス製薬 製剤研

経口製剤を開発し患者に届けるためには幾つものトレードオフを解決しなければならない。製剤開発では標的製品プロファイル (Quality Target Product Profile, QTPP) を設定し、新製品として期待される目標を明確にして検討を進める。QTPP を達成するための薬物暴露量が十分でない場合には投与量や吸収量の増加が必要となり、吸収改善検討が一つの手段としてクローズアップされる。溶解性に課題がある化合物では可溶化処理を施すことになるが、一般に可溶化は安定性に影響を及ぼすことになる。一方、膜透過性に課題がある場合、吸収促進剤の適応を考えると、消化管障害の懸念が高まる。また、過剰な高性能化、高品質化の追求は、検討に長い時間を要してしまい、どんなに優れた製剤を設計しても、患者に届くのが遅れてしまっただけでは価値が大幅に低減してしまう。大切なことは、許容される時間 (研究開発期間)、経済条件 (開発費・製造原価) の範囲で目標を達成することであり、必要に応じて自社以外の技術を導入し、活用することも考えなければならない。製品としての価値を見出すための多角的な標的をバランスよく満たすことがポイントである。そのためには、開発ステージ毎に目標処方プロファイル (Quality Target Formulation Profile, QTFP) を設定し、臨機応変に開発研究を進めることである。本演題では、製剤開発中に発生するトレードオフの事例を紹介し、その対処法を考察する。