

平成 20 年度顕在化ステージ 事後評価報告書

シーズ顕在化プロデューサー所属機関名： 日本理化学薬品株式会社

研究リーダー所属機関名： 帝京大学

課題名： リポソームと超音波照射による薬物導入法を用いた色素沈着症治療法とそのメラニン生成抑制薬物の開発

1. 顕在化ステージの目的

近年、高齢化社会が進むにつれ QOL が重要視されるようになってきた。顔面にしみを形成させる色素沈着症は、外見の若々しさを失わせ、特に女性の QOL を低下させる要因の一つである。色素沈着症の発症原因は、加齢に加え、紫外線、ホルモンバランス、ストレス等、様々であるが、黒色メラニン色素が過剰に発生することは共通している。現在、色素沈着症の治療には、レーザー治療、内服薬、外用剤といくつかあるもののそれぞれに欠点があり、最上の治療法とはなっていない。そこで、本ステージではリポソームと超音波を利用したメラニン生成抑制薬物導入法を用いた新規色素沈着症治療法構築の可能性を検証した。

2. 成果の概要 研究実施者の完了報告書より抜粋

大学の研究成果

当大学で独自に開発した、バブルリポソームと超音波を用いた薬物の新規経皮送達システムの開発を試みた。モデル薬物として蛍光色素を用い、バブルリポソームと共に皮膚表面に適用し超音波照射したところ、皮膚組織を透過した蛍光色素量が増加した。皮膚の組織学的評価を行った結果、無処置群と比較して、蛍光色素が高濃度かつ皮膚下層まで浸透していた。その際、組織学的所見から傷害性は認められなかった。また、本経皮送達システムは、皮膚バリア機能を低下させる新たな作用機序を有することが示唆された。今後、メラニン生成抑制薬物と当大学の本経皮送達システムを併用することで、効果的な色素沈着症治療法の開発が期待できる。

企業の研究成果

抗酸化作用の可能性が認められた二種の新規システイン誘導体を、新たなメラニン産生抑制薬物として選定した。二種薬物は、工業生産可能な手法により 70～80% 台の収率で得られ、品質も各ロット間で一定の数値、結果を示した。また、急性毒性試験等の安全性試験を行い、薬物の安全性を確認した。以上により、二種薬物を安定に供給するに至った。大学機関での研究の結果、二種薬物を含むシステイン化合物群では、目的の効果を示す結果を出すことが出来なかった。従って、効果を示す α -アルブチンを代用として選定し、同薬物の安定性を保証した上で、焦点を絞った治療法の研究用として提供した。市場調査では、各種色素沈着症例の内、老人性色素斑の割合が多いこと、市販されている超音波照射装置の一般的な仕様についてそれぞれ見出し、研究指針の判断材料として活用するに至った。

3. 総合所見

当初の目標に対して期待したほどの成果は得られなかった。マイクロバブルの技術は興味深いですが、計画の遂行に一貫性が欠けている。治療薬候補物質は細胞系での色素沈着に無効であった。