



日本薬学会学術賞受賞 永井恒司氏の業績

町田 良治
YOSHIHARU MACHIDA

永井恒司教授は昭和46年8月に星薬科大学教授として着任したが、翌昭和47年に、前任校東京大学薬学部において行った「固形薬剤の溶解性に関する速度論的研究」によって日本薬学会奨励賞を受賞した。今回学術賞を受賞した「放出制御型薬物送達システムに関する研究」は、前者の延長とはいえ、すべて本学に着任してからの業績である。筆者個人もその研究に協力したものととして望外の喜びである。

永井教授が、日本薬学会奨励賞を受賞した頃から医薬品の品質保証の中で溶出試験法の重要性が叫ばれるようになったこと、また昨今の製薬研究において薬物送達システムが一種のブームになって来たときに今度の受賞がなされたことは、教授がいかにか先見性に富んだ先端的な研究を展開しているか、を如実に物語っている。

今回受賞の対象となった研究は、一口に言えば、非経口・非注射の薬物局所適用における生物学的利用能を放出制御の面から究明することである。そして数々の論文を発表し、多くの関心呼んだ。とりわけ独創性に富むこととしては、ヒドロキシプロピルセルロース (HPC) にカーボポール (CP) を配合した直接圧縮錠が、局所粘膜に接触すると、体液を吸収して膨潤しながらよく附着し、薬物放出の制御が可能であることを発見した。

それは単に基礎研究にとどまらず、粘膜のように水分の多い部位に物は附着し難い、という既存の概念に反する“粘膜附着性製剤”というユニークな薬物送達システムの新剤形の開発にまで発展させた。つまり、3種の新医薬品（「アフタッチ®」、「リノコート®」および「サルコート®」）の実用化を導き、製品は既に医療に供されている。これに関連し、日本薬学会製剤セミナー委員会製剤技術賞（1982）および全国発明賞（1984）が与えられていることも特記すべきことと思う。医薬品に関する発明の中で新規製剤が全国発明賞の対象になったのは、これが最初である。近年、薬物送達システムの研究が活発に行われるようになってきたが、実製剤の開発にまで結

びついた例はめずらしい。したがって永井教授の研究は基礎と応用のバランスのとれた研究の一例と言えよう。

永井教授のこれらの研究が、国際的にも高く評価され関心をもたれていることは、いくつかの国際誌にレビューとして執筆依頼されていることや、Peppas や Robinson が彼らの論文の中で重要視しながら引用していることからもうかがえる。筆者自身も、彼らが国際学会の特別講演の中で永井教授の研究を丁寧に紹介しているのを実際に聞いている。このような実績により、永井教授は米国ラトガース大学の1986年榮譽講演者にも選ばれ、薬学研究の金賞である国際薬学会賞 HOEST-MADSEN MEDAL 1986を日本人として初めて、世界で17人目に受賞した。また国際薬学連合 (FIP) の副会長や Controlled Release Society の Governor にも選任された。

永井教授のこれら一連の研究は多くの原著論文や総説の中で紹介されているが、まず、冒頭で触れた HPC と CP の2種を配合した新配合添加剤を子宮頸癌適用剤形に応用する検討を開始した。基礎実験を経た後、医師の協力により制癌薬を含む製剤で臨床試験をおこなったところ、薬物放出は24時間以上持続し、癌細胞を消失できることが明らかになった。また局所での副作用が少ないことも確認された。

上述の粘膜附着性の剤形は広範な用途が期待できることから、口腔粘膜への薬物適用に応用することを考え、インシュリンについて試みたところ、吸収されることが確認された。注射に比べて、吸収量は約0.5%であったから、改良すべき点は多々あるが、インシュリンの口腔粘膜吸収を報告した最初のものだと言える。この剤形の発展として、アフタ性口内炎治療用附着性2層錠の実用化研究が進められた。

さらに経鼻投与に関する研究に発展させた。鼻腔は錠剤のような形状の製剤を適用するには不向きである。そこで粉末状で適用することを考え、インシュリンを静脈注射の1/3まで吸収させることに成功した。さらに鼻アレルギーの治療のための鼻粘膜附着性製剤が開発された。

他に、水溶性・イオン性薬物が、イオンペアを形成するカウンターイオンを添加すると経皮吸収されるのを見出したことや、経皮吸収促進剤の開発を目指し一連のシクロヘキサノン誘導体の中でエイゾンに匹敵する吸収促進効果がある物を見つけるなど、実に広範にわたる研究を展開してきたこともつけ加えたい。

星薬科大学助教授