

医薬品共結晶のモニタリングおよび粒子設計ワークショップ 2020～2021年度活動報告

Activity Report on Monitoring and Particle Design of Pharmaceutical Cocrystals Workshop, 2020–2021

1. 共結晶ワークショップ (WS) の活動方針と現状

本WSは、医薬品原薬の結晶形態として注目される共結晶の粒子設計や製造プロセスにおけるモニタリング技術に関して理解を深める場として2020年度に設立された。共結晶とは、化学量論比を有する複数成分からなる分子結晶で、非共有結合（水素結合等の分子間力）で結合し、すべての構成成分が室温条件下で固体であるものと定義されている。現状、公表されている知見のほとんどは新規な共結晶の探索およびキャラクターゼーション、あるいはラボスケールでの晶析や粒子設計である。製薬企業でも水面下で検討が進んでいるため、共結晶を原薬とする粒子設計、製剤設計および工業化検討などの実情には潜在的な需要があると考えられる。

そこで本WSでは、「共結晶原薬の製剤化」をキーワードに、医薬品の開発分野における新しい粒子設計と粉体プロセスならびに制御技術の発展および普及を目的と定めた。医薬品の製造工程に関する研究は、主に薬学と化学工学の境界領域であり、分野横断的な学際的研究が必要となる。この構造は本学会の特徴によって充足されると考えられ、製薬を専門とする研究者を中心に、食品などの粉体を取り扱う他業種の研究者にも参加いただき、分野を超えた情報・意見交換を期待している。

2. 2020年度の活動

本WSの設立が新型コロナ感染症の拡大時期と重なっていたことから、実に幸先悪く、活動の停滞を余儀なくされたが、日本粉体工業技術協会の晶析分科会で代表幹事を務める伊藤雅章氏（ノリタケカンパニー）から声をかけていただき、第1回晶析分科会（2020年11月19日（木）14～17時）を共催する機会に恵まれた。折しも国内ではオンラインでの学会運営が普及し始めており、移動・集合が制限される状況であったにもかかわらず、会に先駆けてキックオフの幹事会も開催することができた。

この分科会では、アステラス製薬・岩田健太郎氏より「医薬品開発における共結晶研究の基礎知識」、国立医薬品食品衛生研究所・小出達夫先生より「各極のレギュレーションを踏まえた共結晶の評価手法」、武田薬品工業・辛島正俊氏より「医薬品製剤化を見据えた共結晶原薬の開発」の3演題をご講演いただいたのに加えて、筆者より本WSを紹介させていただく機会も与えていただいた。晶析分科会には医薬品以外の業種の方も多

数いらっしゃるかと伺っているたので、共結晶の技術および本WSの設立を広く伝える上でも有意義な機会となった。

3. 2021年度

前年度に引き続き、新型コロナに活動を阻まれていたが、再度、前出の伊藤氏から相談を受けて、国際粉体工業展 大阪 2021 POWTEX OSAKA 2021の最新情報フォーラム（2021年10月13日（水）10:30～12:30）を共催した。セミナー運営も少々進化し、web配信と現地講演のハイブリッド形式で開催することができた。テーマは「医薬品原料の Cross-cultural exchange」とし、摂南大学薬学部・片岡誠先生より「共結晶の消化管内溶解挙動解析による難水溶性薬物の経口吸収性改善効果の定量的評価」、武田薬品工業・山本克彦氏より「医薬品共結晶の探索および開発、レギュレーション」の2演題でご登壇いただいたのに加え、共結晶の弟分とも言えるコアマルフアスについても、アステラス製薬・溝口亮氏より「Co-amorphousにより期待される医薬品開発への寄与」、味の素・洗洵氏より「アミノ酸コ・アマルフアス (co-amorphous) の特徴、性能」の2演題でご講演をいただき、医薬品原薬あるいは栄養成分と添加剤を分子レベルで混在させた新規な原料形態を主題として、計4演題でプログラムを構成した。オンライン講演（後日オンデマンドにも対応）の利便性と、対面の重要性を再認識する機会となった。

4. 活動の反省と今後の展開

筆者はこれまで本学会での活動実績に乏しく（会員歴はそれなりに長い）、起案から設立までの準備期間が短かった上に新型コロナの影響をまろに・・・というのが言い訳で、この2年間でようやく活動方針が定められてきた。現状、企業から12社、アカデミアから6名がメンバーに連なり、本邦における主要プレイヤーに加入していただけたと考えている。さらなるドリームチームを目指す、その前に、本WSが主催する活動の実施が先決であると自戒している。共結晶の探索スクリーニングや製剤設計といった、製品開発に直結する、実践的な技術と知見の共有を大目標として、この2年間に失われがちな人的交流も加味して、感染対策と密な議論を両立できるセミナーを鋭意検討中である。

（明治薬科大学 深水啓朗）