

初期製剤開発

Drug Product Services





Truder ZE 9

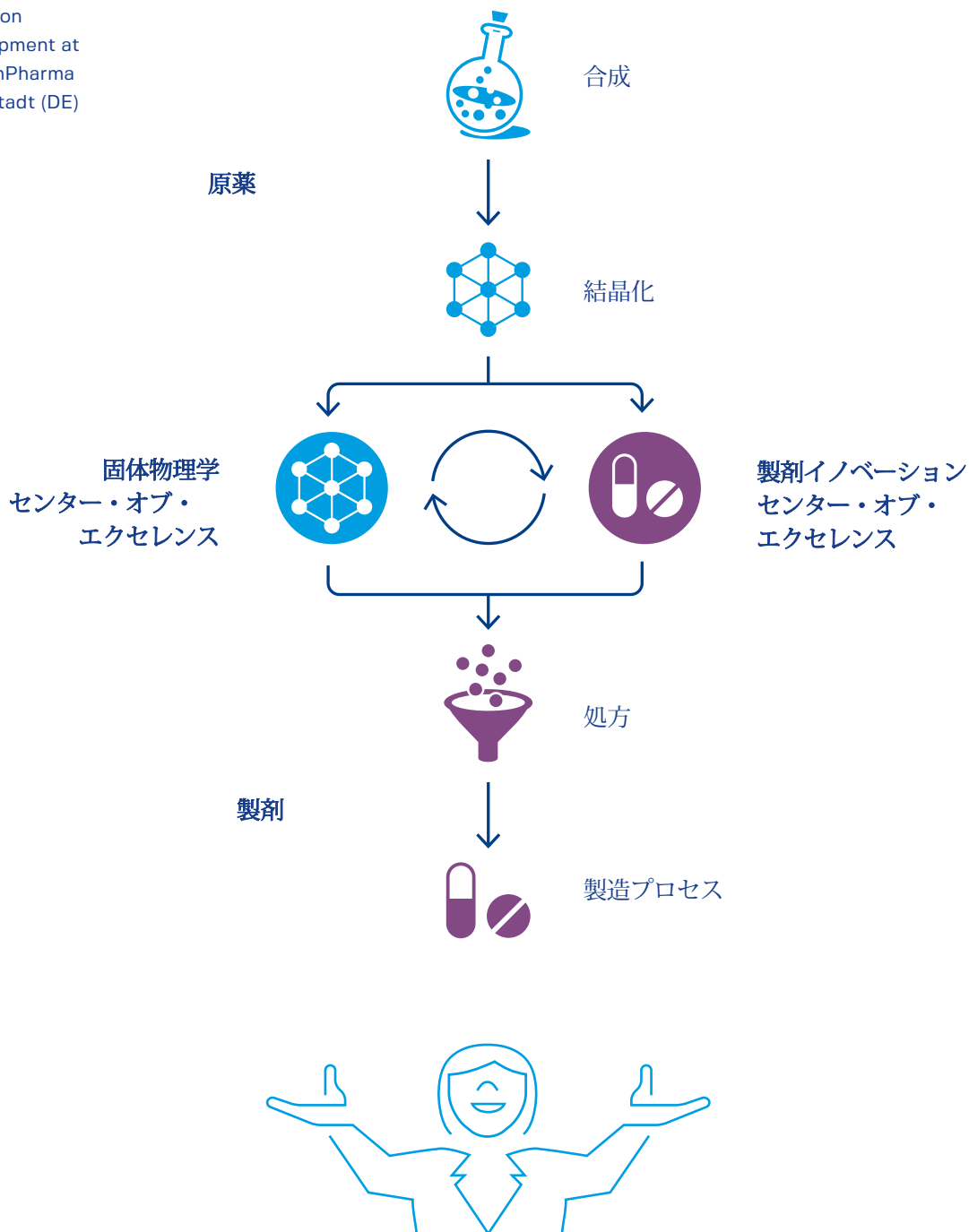
Three-Tec TT

Three-Tec TT

TT

SIEMENS SIMATIC HMI TOUCH

Hot melt
extrusion
development at
CordenPharma
Plankstadt (DE)



CordenPharmaの製剤イノベーションセンター・オブ・エクセレンスは、経口固形製剤（OSD）の初期段階の製剤開発および製造サービスを提供しており、バイオアベイラビリティ向上技術も含まれています。当社の固体物理学センター・オブ・

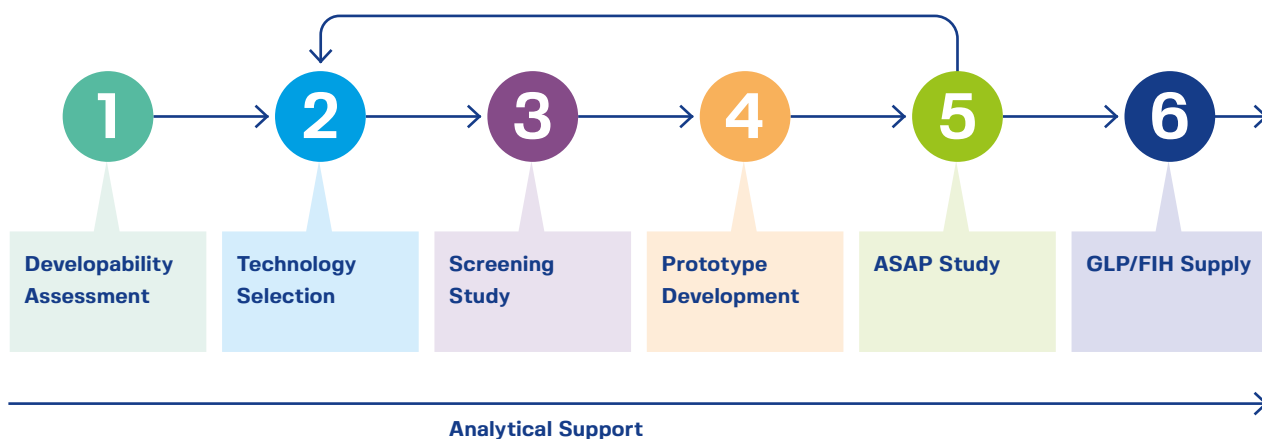
エクセレンスとの連携により、統合された原薬（API）および製剤サービスを提供し、十分な吸収性／溶解性、安定性、加工性を備えた製剤に必要な最適な原薬形態を特定するための継続的なフィードバックループを確保しています。

First-in-Human (FIH) OSD Capabilities

製品を柔軟かつ迅速、効率的に第I相臨床試験（**FIH**）に進めることは重要です。**CordenPharma**は、**API**プロファイリングと技術選定（従来型、バイオアベイラビリティ向上型）を含む初期開発可能性評価、それに続くスクリーニング試験（賦形剤、ポリマーなど）、段階に応じた製剤開発、プロトタイプ調製を提供します。**CordenPharma**は、安定性評価に加速安定性評価プログラム（**ASAP**）を活用することで、製造に最適なプロトタイプを特定し、迅速に**FIH**試験へと進めることができます。

開発初期 FIH 能力

- 統合された原薬及び製剤開発
- 開発可能性評価
- スクリーニング検討
- 処方開発
- GLP品供給
- FIH治験薬供給
- ASAP及び加速安定性プログラム
- 分析サポート





XRPD for solid state analysis at CordenPharma Plankstadt (DE)

Bioavailability Enhancement

溶解性は、医薬品候補の重要な特性の一つであり、医薬品開発における最大の課題の一つです。今日の医薬品開発パイプラインにある新規化合物（NME）の約70～90%は溶解性が低く、そのため送達が困難になり、バイオアベイラビリティが低下します。これらのNMEの大部分はDCSクラスIIa/IIbおよびIVに分類され、溶解性制限による低吸収（IIb）、溶解速度制限による低吸収（IIa）、または透過性制限による低吸収（IV）によりバイオアベイラビリティが低くなっています。

CordenPharmaの開発初期製剤イノベーションセンター・オブ・エクセレンスの一環として、溶解性や透過性に課題のある原薬を含む製剤に対応するためのバイオアベイラビリティ向上技術を提供しています。さらに、溶解性に起因する吸収問題を解決できる基盤技術に加え、SEDDS/SMEDDS、ナノクリスタル、リポソーム製剤向けの脂質添加剤のポートフォリオも提供しており、透過性の問題を解決できます。



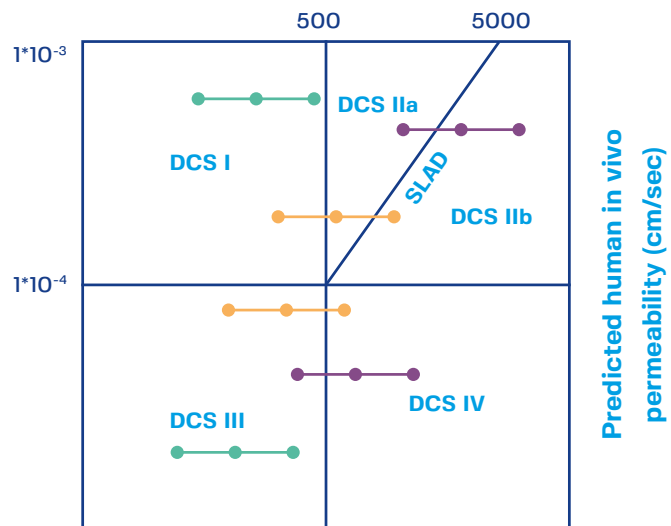


Nanomill development at CordenPharma Plankstadt (DE)



DCS = Developability Classification System
SLAD = Solubility Limited Absorbable Dose
VDAD = Volume to Dissolve Applied Dose

**Volume to Dissolve Applied Dose
 VDAD (ml)**



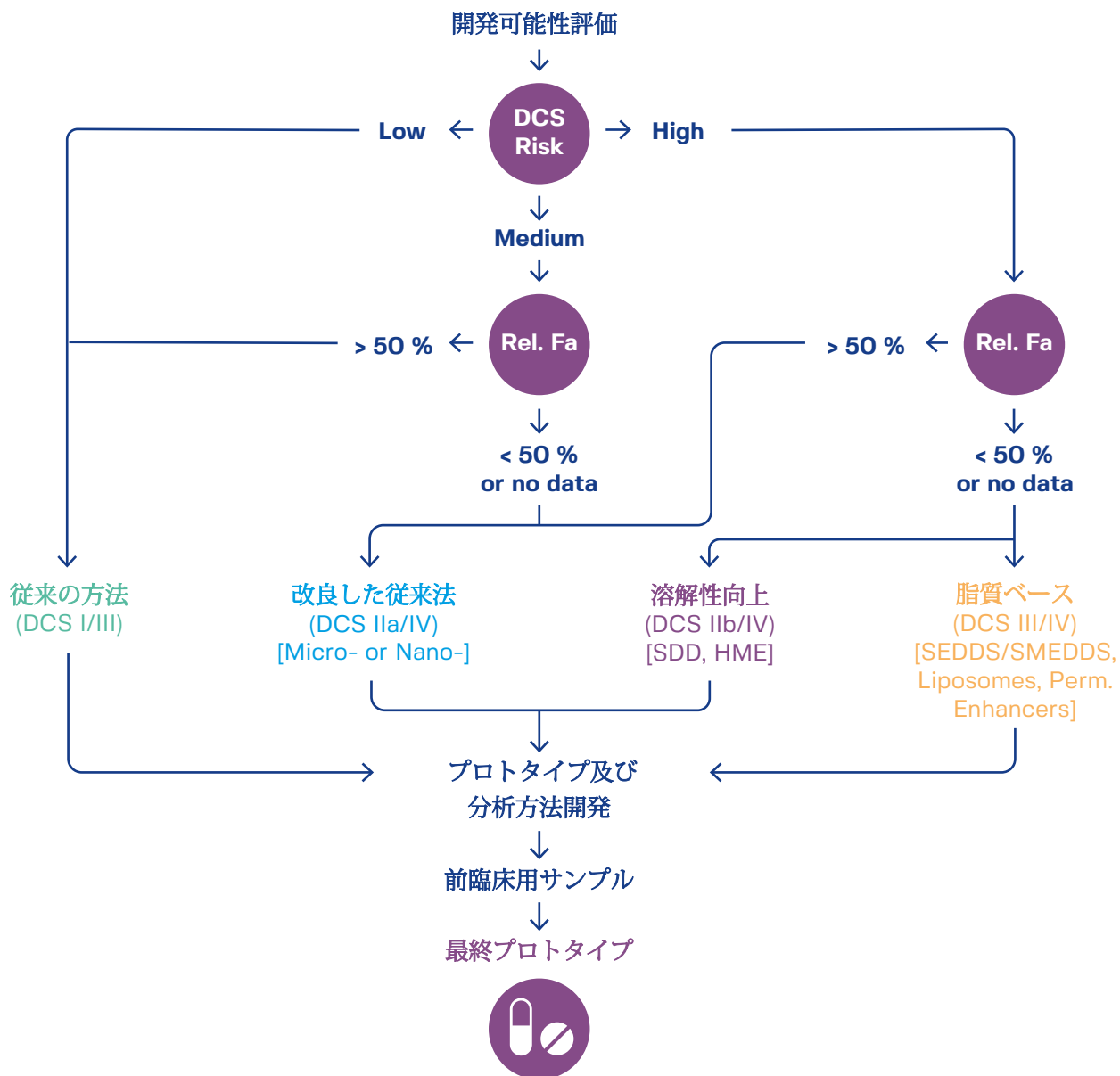
製剤開発技術

- 従来の方法 (湿式造粒、熔融造粒、乾式造粒、直接打錠)
- 打錠シミュレーター
- 微粒子化 (ジェットミル)
- ナノ粒子化 (湿式ボールミル)
- アモルファス固体分散 (スプレードライ、ホットメルト押出、ドラッグレイヤリング、共沈法)
- 脂質ベースシステム (SEDDS/SMEDDS, ナノクリスタル, 透過性促進剤、リポソーム)

Prototype Development Decision Tree

開発可能性評価では、投与量、吸湿性、溶解性、固体状態特性、粒子径分布、透過性などの利用可能なデータを使用してリスク評価を実施します。投与量範囲に基づいて、DCSリスク係数が適用されます。意図する投与量が中程度または高用量の場合は、in vivoリスク係数（Rel. Fa）が適用されます。このリスク係数は、経口投与後に全身循環で吸収される相対分率の決定です。

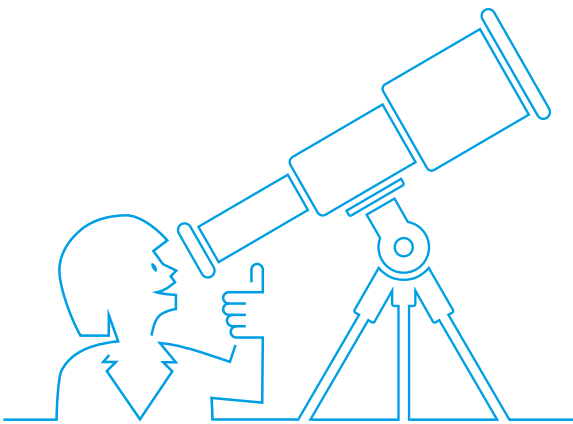
CordenPharmasの初期段階の製剤開発チームは、これら2つのリスク係数と下記のデンジョンツリーを使用して、初期開発中にどのタイプのプロトタイプ製剤戦略をターゲットにすべきかを提案します。効率的なスクリーニング手順により、異なる技術を評価する必要がある場合でも、非常に少量の原薬に基づいて科学的に妥当な製剤選択が可能になります。



Accelerated Stability

原薬または医薬品の安定性を4週間以内に予測することにご興味がありますか？

ASAP安定性試験プログラムは、厳選された少数の加速／高温ストレス試験サンプルから、室温条件下での製品の分解速度を予測できる、時間節約型のソリューションです。



- リスク軽減の意思決定
- 化学的安定性、保存期間を予測
- 剤形および包装形態の選択をサポート
- コスト軽減
- 開発期間の短縮
- 20-35 サンプルで 6-8の条件下、2-3週間の期間
- 結果はほとんどの規制当局に認められています。
- ヒト初回投与（FIH）には正式なICH試験は不要



FIH cGMP Manufacturing

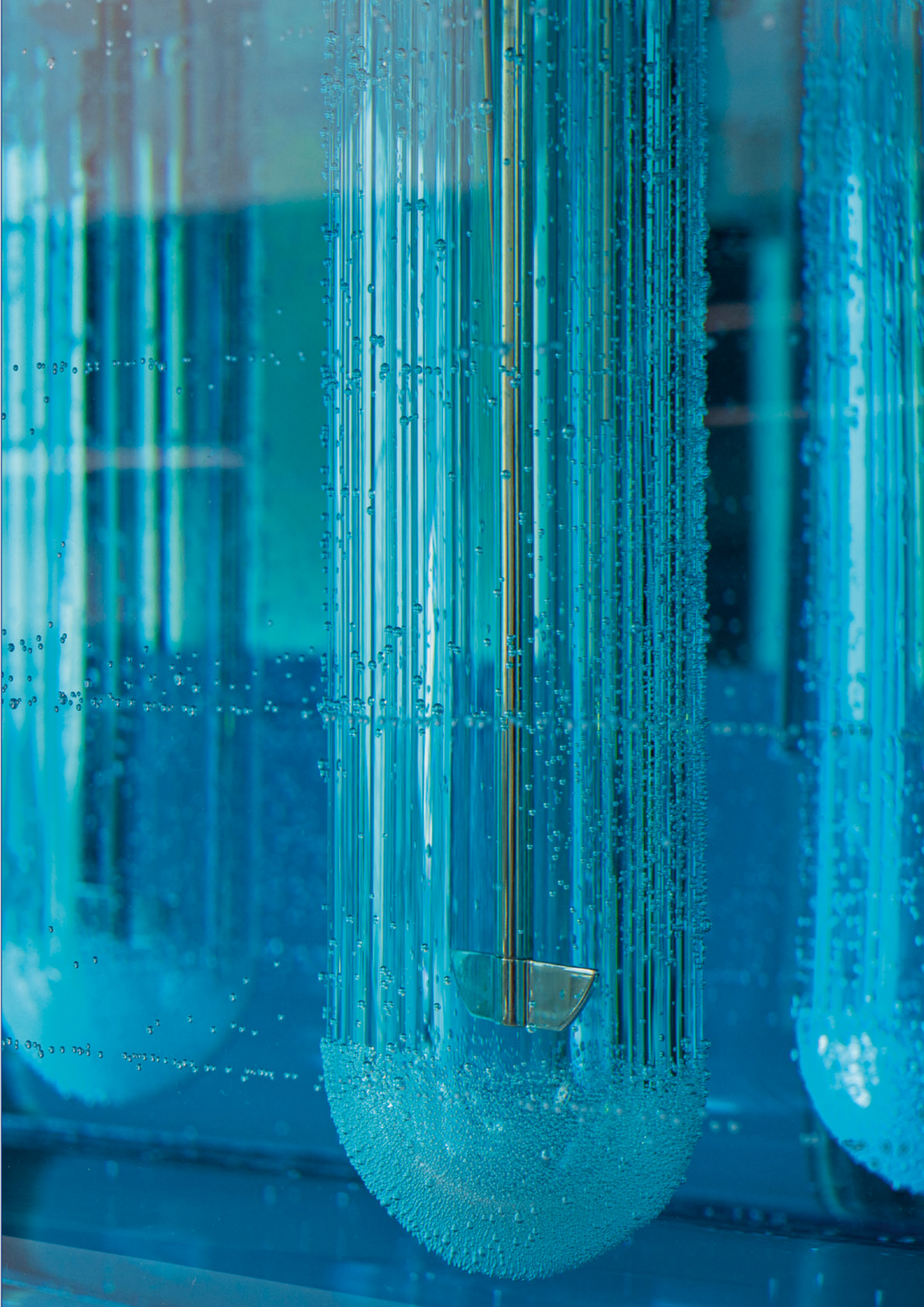
前臨床試験が完了した後、選択されたプロトタイプは、臨床供給を目的とした最終剤形へと開発されます。段階に応じたリスクベースのアプローチにより、選択されたプロトタイプを当社の小規模cGMP施設へ迅速に移管することが可能です。FIH試験における課題の1つは、適切な投与量範囲を特定することです。以下に概説する剤形の中には、最終投与量に関して柔軟性のあるものがあります。カプセルには、原薬、粉末/顆粒、ペレット、またはミニタブレットをさまざまな容量または量で容易に充填できます。CordenPharmaのカプセル充填技術により、臨床試験中にさまざまな投与量を「オンデマンド」で提供できます。並行して、段階に応じて分析法の適格製評価を行い、すべての材料のリリース試験に使用できることが保証されます。

FIH 経口固形製剤

- 原薬 / 粉末 / 顆粒 / ペレット カプセル充填
- 原薬 / 粉末 / 顆粒 ボトル充填 (再溶解用)
- 脂質 / 溶液 / 懸濁液
- タブレット / ミニタブレット



Dissolution
bath at
CordenPharma
Plankstadt (DE)



CordenPharma

International

Aeschenvorstadt 71
4051 Basel
Switzerland

cordenpharma.com



Peptides



Oligonucleotides



Lipids & LNPs



Injectables



Highly Potent
& Oncology



Small Molecules

日本代理店
ピクスケミ株式会社
東京都中央区日本橋馬喰町1-9-9
Tel: 03-6264-9081