

# 索拉非尼有机凝胶胶囊剂的研发

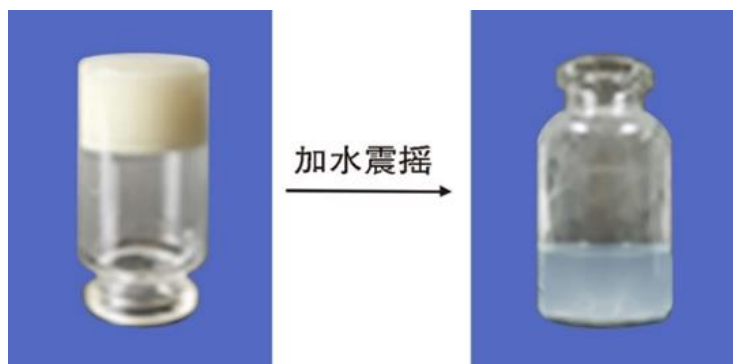
# 一、核心技术： 新型有机凝胶给药系统

(水化胃肠道原位  
纳米化技术)

- 有机凝胶是由自组装有机胶凝剂的三维网络固定有机溶剂组成的无水半固体体系，传统上都是外用。
- 新型有机凝胶给药系统是有机凝胶技术、纳米技术和原位生成技术融合的高科技新技术。
- 特点：能极大地提高难溶性药物的生物利用度，且好于现有提高生物利用度的各种技术。
- 传统凝胶剂只能外用，新型有机凝胶给药系统可分装于胶囊壳内，制成胶囊剂用于口服。
- 全新剂型，国内外均没有同类产品，拥有自主知识产权。辅料均为药用规格，安全性高；工艺简单，收率达到100%。

## \*大幅度提高生物利用度的机理:

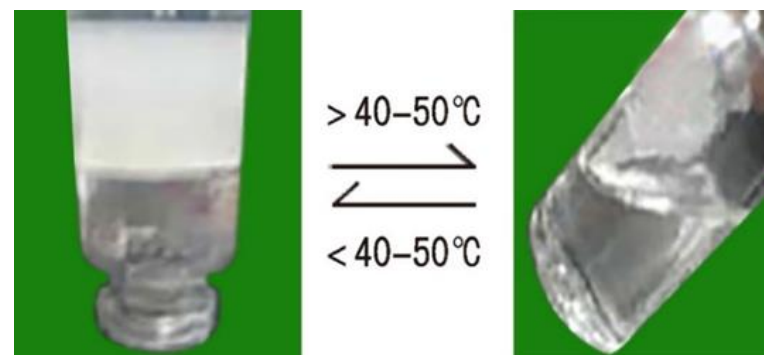
1) 在位纳米化:有机凝胶进入胃肠道后遇水自组装形成纳米粒, 药物更容易吸收;



有机凝胶遇水纳米化照片

右图有机凝胶遇水呈现乳光, 提示为纳米粒

2) 具有生物粘附性: 有机凝胶体温下可液化, 产生生物粘附性, 增加药物胃肠道滞留时间和吸收时间。



有机凝胶温敏现象照片

左图为室温下有机凝胶照片, 右图为加热后有机凝胶呈现熔融态

## 二、新产品：索拉非尼新型有机凝胶胶囊剂

### 1) 索拉非尼介绍

索拉非尼是德国拜耳公司研发的靶向治疗药，具抗肿瘤血管生成和抗肿瘤细胞增殖双重作用，是肝癌、肾癌、甲状腺癌里程碑式药物。

目前原料药索拉非尼专利已于2020年到期，上市产品为普通片剂，一天2次，每次2片，每片200mg。

## 2) 原研药索拉非尼片剂临床治疗痛点:

### ◆生物利用度低

(仅约30% ~ 49%)

影响药物疗效发挥

药动学个体差异大;

### ◆毒副作用多

据报道: 约40%患者因不良事件中断剂;

30%需减少剂量; 近10%患者中断治疗

3) 索拉非尼有机凝胶胶囊剂是利用新型有机凝胶核心技术研发的新产品

为原研药索拉非尼片剂的升级产品

与原研药相比，优势显著

显著提高生物利用  
度，提高药物疗效；



减少用药剂量，降  
低毒副作用；



降低用药成本

## 4) 索拉非尼有机凝胶胶囊剂和原研片剂体内生物利用度试验结果



- 索拉非尼有机凝胶胶囊剂 BEAGLE犬体内相对生物利用度(AUC)是原研片剂的277%，峰浓度C<sub>MAX</sub>是原研片剂2.13倍。



- 有机凝胶胶囊剂在体内外溶出与吸收均显著优于原研片，达到国际领先水平。