

# Agilent 8700 Laser Direct Infrared (LDIR) ケミカルイメージングシステムによる 医薬品錠剤での塩交換の識別と検出

## はじめに

錠剤中の医薬品有効成分 (API) は、期待される治療効果を達成するために、化学的状態 (酸性、塩基性、塩形態) と構造を維持する必要があります。API は多くの場合、パッケージングの不備や環境の条件が原因となって、酸性または塩基性の形態から塩形態へ、あるいはその逆の変換が行われます。この望ましくない変換は、錠剤の溶解性、安定性、バイオアベイラビリティに重大な影響を与えることがあります。

Agilent 8700 LDIR ケミカルイメージングシステムは、錠剤中の塩交換を検出し同定することができます。トラブルシューティングと製剤開発研究に適した高速かつ効果的なツールです。

## Agilent 8700 LDIR ケミカルイメージングシステムの主な利点

- 8700 LDIR では分子の高速イメージング測定が可能で、解析に必要な特定の波長のみを使用して、各錠剤成分を効率的にイメージ化できます。  
錠剤全体の包括的なケミカルイメージが、わずか数分で得られます。  
そのため、より多くの錠剤をより詳細に、より短い時間で分析できます。
- イメージは任意の空間分解能で取得でき、対物の交換やフォーカス調整は不要です。  
これは、塩交換が起こっている領域を見つけるための錠剤全体の高速スキャンと、選択した領域の局所的な化学特性についてさらに高解像度イメージングを行うことを可能にするために重要です。
- 赤外線スペクトルは解釈が容易で、充実したライブラリによってスペクトル同定が可能です。
- 8700 LDIR は API と賦形剤の両方に対して同等の感度があり、蛍光効果による影響を受けないため、サンプル中のすべての成分の包括的なイメージ化を可能にします。
- 完全に自動化された減衰全反射 (ATR) 法は、未知化合物の同定と最小 0.1 ミクロンピクセルサイズまでのイメージングが可能です。

- 高速な分析により、錠剤の湿気への不要な曝露が最小限に抑えられ、結果の信頼性と再現性が向上します。
- 8700 LDIR は高度に自動化され、使いやすいため、製剤開発、安定性の測定、トラブルシューティングなどに携わる専門知識を持つユーザーにとって、優れたイメージングシステムです。
- 液体窒素が必要ないため、運用コストやメンテナンスを低減できます。

## 分析例：市販の胃腸薬における塩交換

胃腸薬が湿気や水分に曝されると、炭酸水素ナトリウムが存在する場合、クエン酸がクエン酸ナトリウム塩に変化し、副生成物として水と二酸化炭素が生成されます。これらの副生成物が原因で、錠剤は時間とともに割れたり変色し、治療効果を失ったりすることがあります。LDIR は、自動的に選択されたそれぞれの成分を最適に区別する波長に着目することによって、図 1 のような成分分布を示すイメージを短時間で生成します。

LDIR イメージングを用いて、周辺湿度環境下に曝された錠剤中の塩交換（クエン酸ナトリウムの形成）を識別し、モニタリングしました。周辺湿度環境下に数時間曝された後（図 2、上）と丸一日経った後（図 2、下）に取得した錠剤のイメージから、塩の形成が生じて成長する境界面がはっきりとわかります。この形成は、クエン酸（黄色）の周囲に存在するクエン酸ナトリウム（水色）領域の増大によって明らかに示されています。

塩を同定するために、任意のピクセルを選択すると、指紋領域のスペクトルを 1 秒で得ることができます、その後ライブラリスペクトルと照合します。自動化された分類分析を使用して、錠剤表面の成分分布を視覚化できます。こうすることで、湿気に曝された錠剤中成分の変化を迅速に観察することができます。

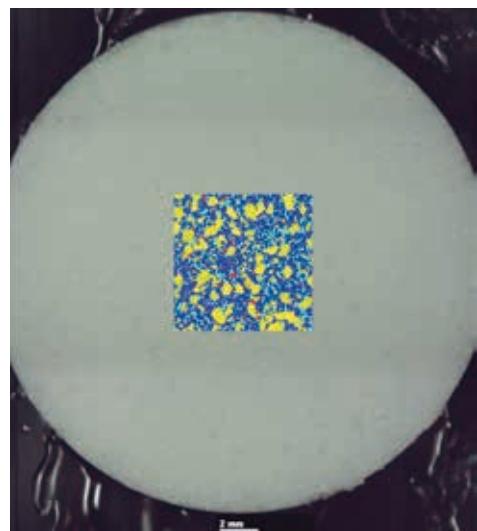


図 1. 医薬品錠剤中に存在する賦形剤と API は、可視光イメージでは識別できません。Laser Direct Infrared イメージングは、錠剤中央 7 mm x 7 mm の領域に示されているような、各化学物質の分布を数分で視覚化できます。

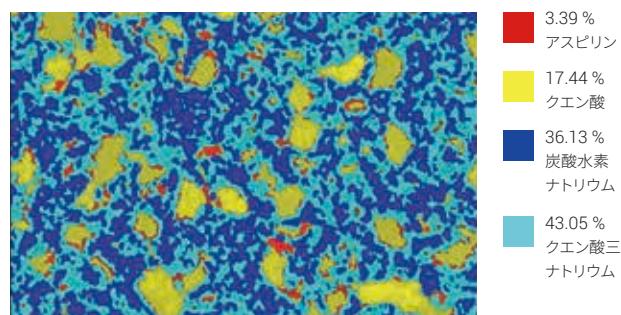
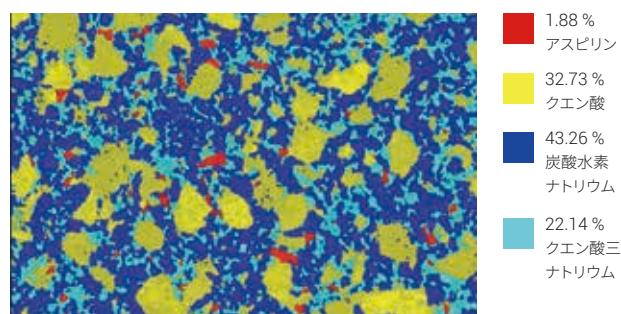


図 2. 上：平面出しを行い周辺湿度環境下に 2 時間曝した後の錠剤中央部の LDIR ケミカルイメージ。  
下：24 時間曝した後の同じ領域。各イメージは 7 × 7 mm で 4 種類の成分を示しています。各イメージは 10 μm ピクセルサイズでわずか 11 分で取得されました。

ホームページ

[www.agilent.com/chem/jp](http://www.agilent.com/chem/jp)

カストマーコンタクトセンタ

0120-477-111

[email\\_japan@agilent.com](mailto:email_japan@agilent.com)

本製品は一般的な実験用途での使用を想定しており、  
医薬品医療機器等法に基づく登録を行っておりません。  
本文書に記載の情報、説明、製品仕様等は予告なしに  
変更されることがあります。

アジレント・テクノロジー株式会社

© Agilent Technologies, Inc. 2018

Printed in Japan, September 19, 2018

5991-7511JAJP