



多層錠剤の特性解析

Agilent 8700 Laser Direct Infrared (LDIR)
ケミカルイメージングシステム

8700 LDIR を多層錠剤の調査に使用する利点

- － **錠剤の成分分布の同定と測定が容易:** 分析対象領域を選択し、適切なイメージピクセルサイズを選択するだけです。Agilent Clarity ソフトウェアによって、ターゲット化合物のスペクトルに基づき、最高のケミカルコントラストを生み出す特定の波長が選択されます。追加の処理やデータ操作をすることなく、結果が直接表示されます。
- － **優れた空間分解能と視野:** 多層錠剤のイメージをさまざまなピクセルサイズで取得できます。光学系の切り替えや機器の調整は不要です。錠剤成分の情報は、バルク錠剤でも、より細かい層の境界面でも取得できます。機器の光学系を変更する必要はありません。減衰全反射 (ATR) モードでは、最小で 0.1 ミクロンのピクセルサイズを選択できます。
- － **高速かつ包括的な分析:** 8700 LDIR は医薬品有効成分と賦形剤のどちらに対しても同様に高い感度を発揮し、ラマンのマイクロイメージングよりも大幅に短い時間で全体の結果を得ることができます。

多層錠剤のケミカルイメージング

多層錠剤は次のような特徴により、多くの薬剤化合物の提供に使用されます。

- － 1 つまたは複数の医薬品有効成分 (API) を異なるタイミングで放出できる。
- － 一緒に製剤できない原材料を分離できる。
- － 即放層と制御放出層を組み合わせ、医薬品の有効濃度を長期間維持できる。

多層錠剤の製剤では、層の分離、層間の汚染、圧力による有効成分の劣化、製剤の複雑化による純度の低下などの問題が発生する場合があります。

Agilent 8700 LDIR ケミカルイメージングシステムは、多層錠剤形の層間および層内の相互作用の評価に適しています。このシステムでは、錠剤の成分分布 (速度制御用ポリマー/化合物が各層に正しく分布しているかなど) がわかります。8700 LDIR は分析速度と空間分解能が優れているため、サンプルが 1 つでも複数でも、層間の境界面を詳しく調べることができます。

8700 LDIR で取得する高解像度イメージによって、これらの種類の錠剤の有効成分と賦形剤の組成に関する重要な情報を得られます。これは、組成と溶出の関係を把握するための製剤研究に役立ちます。また錠剤メーカーが品質管理によって製品の一貫性を維持するためにも有用です。

複数化合物の同定

反射モードや ATR モードでは、分析対象ポイントを選択するだけで、錠剤成分の中赤外スペクトルを簡単に取得できます。このスペクトルをライブラリスペクトルと照合して同定します。

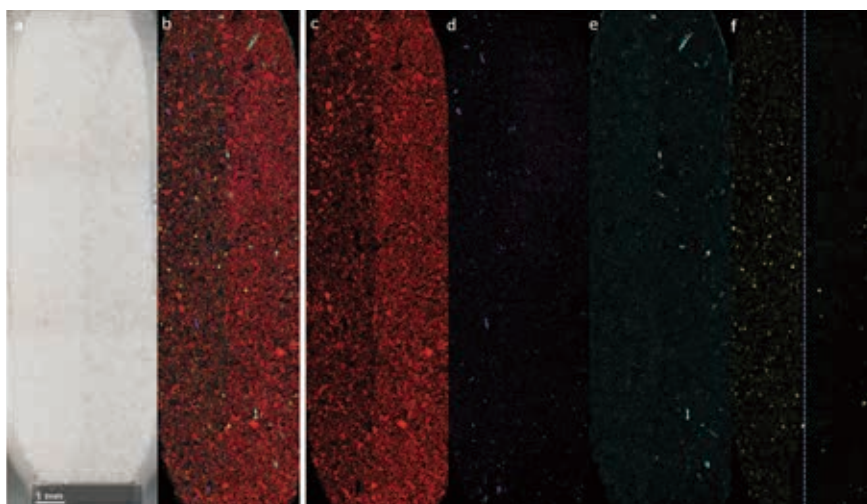


図 1. (a) 2 層錠剤の側面図。印刷されていない面が左、印刷面が右。(b) イメージ c ~ f の複合イメージ。すべての成分を表示。(c ~ f) アセトアミノフェン (c)、セルロース (d)、ヒドロキシエチルセルロース (e)、スターチ (f) の個々のケミカルマップ。(f) 青色の縦の破線は層の分かれ目を示しています。スケールバーは 1 mm です。

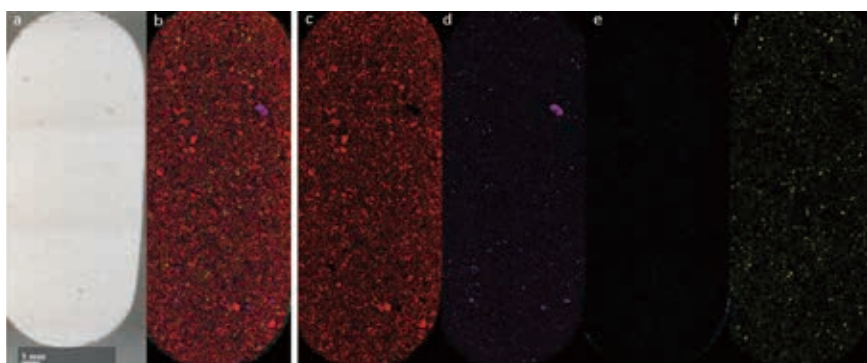


図 2. (a) 錠剤の印刷されていない面を上にしたミクロトーム切片のイメージ。(b) 錠剤の印刷されていない面を上にした全成分の複合イメージ。(c ~ f) アセトアミノフェン (c)、セルロース (d)、ヒドロキシエチルセルロース (e)、スターチ (f) の個々のケミカルマップ。スケールバーは 1 mm です。

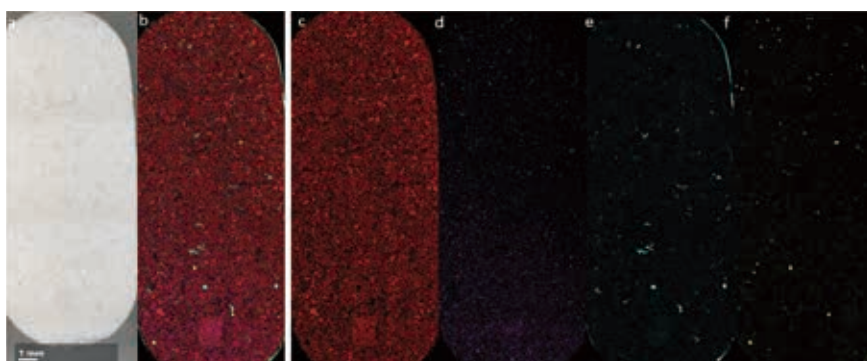


図 3. (a) 錠剤の印刷面を上にしたミクロトーム切片のイメージ。(b) 錠剤の印刷面を上にした全成分の複合イメージ。(c ~ f) アセトアミノフェン (c)、セルロース (d)、ヒドロキシエチルセルロース (e)、スターチ (f) の個々のケミカルマップ。スケールバーは 1 mm です。

高速スクリーニングと詳細分析

8700 LDIR では錠剤全体の表面を高速でイメージングできるため、サンプルを数分間で迅速にスクリーニングできます。また、1 つのサンプルを短時間で詳しく分析することもできます。例えば図 2 と図 3 (左) に示した錠剤は、わずか 29 分で分析できました。各イメージは 10 μ m ピクセルサイズでスキャンした 19.35 mm $\times$ 7.77 mm サイズのもので、4 種類の成分がマッピングされています。

錠剤の分析例

分析対象は市販の徐放性のカプレットです。これらのカプレットには、有効成分としてのアセトアミノフェンと、セルロース、スターチ、ヒドロキシエチルセルロースなどの一般的な賦形剤が含まれています。

カプレットは表面をミクロトームで平滑化してイメージングしました (図 1)。これで成分分布をマッピングできます。分析の結果、錠剤に 2 つの水平の層があることがわかりました。錠剤の 2 層間の境界面は、図 1b で明確にわかります。これらの層では、アセトアミノフェン、スターチ、ヒドロキシエチルセルロースの成分の相対分布を簡単に識別できます。

まず錠剤の印刷されていない面を上にし (図 2)、次に印刷されている面を上にして (図 3)、錠剤をさらにイメージングしました。これらのイメージでは、特にスターチとヒドロキシエチルセルロースについて、成分の分布が異なることがわかります。

ヒドロキシエチルセルロースやスターチグリコール酸ナトリウムなどの成分は、錠剤の溶出速度の制御に使用される場合があります。成分分布のケミカルイメージから、ヒドロキシエチルセルロース (溶解遅延剤) が多く含まれる印刷面の層が制御放出層で、スターチが多く含まれる印刷されていない面が即放層であることがわかります。

ホームページ

www.agilent.com/chem/jp

カスタムコンタクトセンタ

0120-477-111

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 20, 2018

5991-7825JAJP