

## ● X線 CT 及び TOF-SIMS による錠剤内部イメージング

TN369

Inner observation and chemical mapping of tablet by X-ray CT and TOF-SIMS

### [序 論]

当社では、医薬品、サプリメント及び農薬等の錠剤内部の情報を可視化するサービスを用意致しました。錠剤内部の情報を取得することで、錠剤がコンセプトどおりに製剤化されているかどうかを可視化することができます。錠崩壊状態の予測や溶解性・分散性を目的とした製剤開発等の製剤処方検討をより効率的に進める上で有効な解析手段と考えております。

### [サービス]

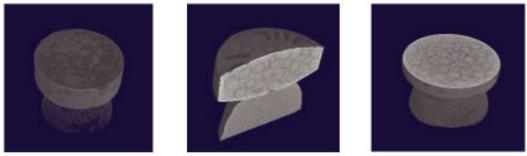
今回 2 種の錠剤を使用し、以下の 2 手法を用いて錠剤内部を可視化した事例を示します。

- ◆ X線 CT 観察 (X-ray CT/非破壊分析) : 試料を破壊することなく内部構造が確認できます
- ◆ 飛行時間型 2 次イオン質量分析法 (TOF-SIMS/断面分析) : 無機・有機物成分のマッピング像が取得できます

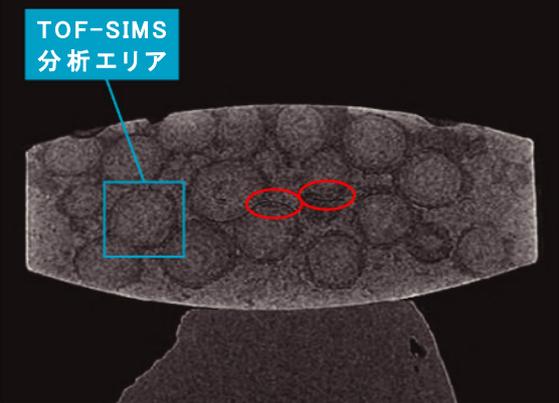
### [事例 ①]

放出制御の為に 1) 錠剤内部に小核を複数作製し 2) 小核に有効成分を含ませて表面積を増大させた錠剤の内部構造を可視化しました。

### X線 CT 観察

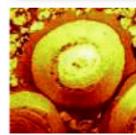


**TOF-SIMS 分析エリア**

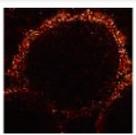


錠剤内部に層構造を有する小核が均一に存在していることが確認されました。一方、小核の一部に亀裂(赤丸)が入っている様子も確認されました。これが意図せぬ亀裂であった場合、錠剤崩壊を促進している可能性が懸念されます。バインダーや打錠圧力の改良について検討する際に有用な知見を与えるものと考えられます。

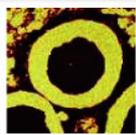
### TOF-SIMS



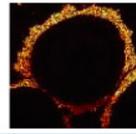
Total ion



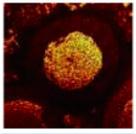
ラウリル硫酸 Na  
(湿潤剤由来)



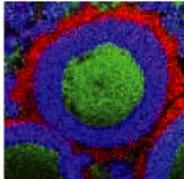
化合物 A  
(有効成分由来)



ステアリン酸グリセリン  
(乳化剤由来)



セルロース  
(賦形剤由来)



- ラウリル硫酸 Na  
..... 湿潤剤由来
- 化合物 A  
..... 有効成分由来
- セルロース  
..... 賦形剤由来

小核が賦形剤を核とし、その周囲に有効成分の層があることが確認されました。さらに有効成分の周囲に湿潤剤が存在していることから、溶出速度を早める為の構造を有していることが確認されました。

このことから、速放性制御の目的に対して今回の錠剤では、設計通りに製剤化されていることを確認することができました。処方成分の添加量調整による厚みなどの構造変化が、視覚的に確認できます。

## [事例 ②]

放出制御の為に 1) 多層コートを構成し、2) 錠剤内部の中心では有効成分と添加剤を均一に分散させた錠剤を可視化しました。



X線CT観察とTOF-SIMSを用いることにより、錠剤内部における放出制御の為に構造や薬剤成分を可視化し、製剤化コンセプトとテストサンプルとの比較等、効果的な製剤開発サポートする為の解析手段を提供致します。

## [キーワード]

MS イメージング、分子イメージング