

Sistema Laser Direct Infrared (LDIR) Chemical Imaging Agilent 8700 per l'identificazione e la rivelazione dello scambio salino nelle compresse farmaceutiche

Introduzione

I principi attivi farmaceutici (API) delle compresse devono mantenere il proprio stato chimico (forma acida, basica o salina) e la propria struttura chimica per conseguire gli effetti terapeutici per essi attesi. Gli API spesso si trasformano dalla forma acida o basica a quella salina o viceversa a causa di un confezionamento imperfetto e/o delle condizioni ambientali. Questa conversione indesiderata può avere effetti considerevoli sulla dissoluzione, sulla stabilità e sulla biodisponibilità della compressa.

Il sistema LDIR Chemical Imaging Agilent 8700 è in grado di rilevare e identificare lo scambio salino nelle compresse e rappresenta uno strumento rapido ed efficace per la risoluzione dei problemi e gli studi di sviluppo di formulazioni.

Principali vantaggi del sistema LDIR Chemical Imaging Agilent 8700

- Il sistema LDIR 8700 offre un imaging molecolare rapido utilizzando soltanto poche lunghezze d'onda importanti dal punto di vista diagnostico per visualizzare efficacemente ogni costituente della compressa. Realizzare un'immagine chimica completa di un'intera compressa richiede solo pochi minuti. Ciò consente di analizzare più compresse in maggiore dettaglio e in meno tempo.
- È possibile acquisire un'immagine con qualsiasi risoluzione spaziale senza il bisogno di cambiare gli obiettivi o di ripetere la focalizzazione dello strumento. Ciò è fondamentale, in quanto permette di effettuare una scansione rapida dell'intera compressa per individuare le regioni in cui si è verificato lo scambio salino e quindi di effettuare l'ulteriore imaging ad alta risoluzione della struttura chimica localmente presente nelle aree selezionate.
- Gli spettri infrarossi sono facili da interpretare, mentre estese librerie consentono l'identificazione degli spettri.
- Il sistema LDIR 8700 è ugualmente sensibile agli API e agli eccipienti e non risente degli effetti della fluorescenza, consentendo di realizzare l'imaging completo di tutti i costituenti di un campione.
- Il campionamento ATR (riflettanza totale attenuata, Attenuated Total Reflection) è completamente automatizzato per l'identificazione di composti sconosciuti e la realizzazione di imaging con dimensioni dei pixel ridotte fino a 0,1 micrometri.

- La rapidità dell'analisi riduce al minimo l'esposizione indesiderata delle compresse all'umidità, generando così dati più affidabili e riproducibili.
- Essendo altamente automatizzato e facile da usare, il sistema LDIR 8700 rappresenta un eccellente sistema di imaging multiutente per utilizzatori con un'ampia gamma di livelli di esperienza impegnati nello sviluppo delle formulazioni dei farmaci, nella determinazione della stabilità e nella risoluzione dei problemi.
- I costi di esercizio e di manutenzione sono ridotti grazie al fatto che non è richiesto l'impiego di azoto liquido.

Esempio di analisi: scambio salino in compresse da banco per l'indigestione

Quando una compressa per il sollievo dei sintomi da indigestione è esposta all'umidità, in presenza di bicarbonato di sodio, l'acido citrico si converte nel sale citrato di sodio, producendo acqua e anidride carbonica come prodotti secondari. Questi prodotti secondari possono causare con il tempo lo sbriciolamento e la discolorazione delle compresse, come anche la perdita dei loro effetti terapeutici. Concentrando l'attenzione su lunghezza d'onda automaticamente selezionate che sono ottimali per discriminare tra questi costituenti, la tecnica LDIR è in grado di generare rapidamente un'immagine che ne mostri la distribuzione, come si vede nella Figura 1.

L'imaging LDIR è stato utilizzato per identificare e monitorare lo scambio salino (formazione di citrato di sodio) in una compressa esposta all'umidità ambientale. L'interfaccia in corrispondenza della quale la formazione di sale si verifica e si accresce è evidente nell'immagine della compressa realizzata dopo un'esposizione all'umidità ambientale di qualche ora (Figura 2, in alto) e di un giorno intero (Figura 2, in basso). La formazione è chiaramente segnalata dall'aumento delle dimensioni del dominio del citrato di sodio (colore verde acqua) intorno all'acido citrico (colore giallo).

Per identificare un sale, è possibile selezionare un qualsiasi pixel di interesse e realizzare uno spettro dell'impronta digitale chimica della regione in un secondo prima del confronto con gli spettri della libreria. Mediante l'analisi di classificazione automatizzata, è possibile visualizzare la distribuzione dei costituenti sulla superficie della compressa. Ciò fornisce un sistema rapido per osservare le variazioni dei costituenti sulla superficie di una compressa esposta all'umidità.

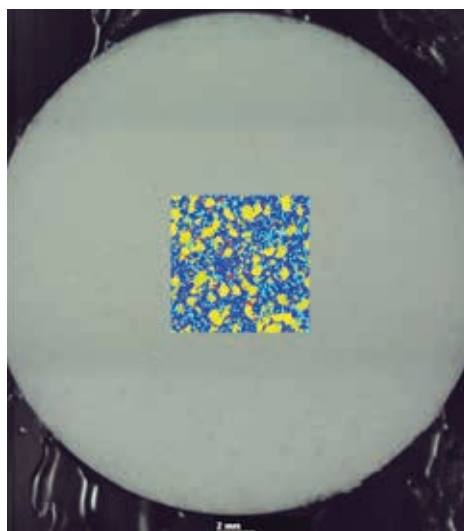


Figura 1. Non è possibile distinguere gli eccipienti e gli API di una compressa farmaceutica in un'immagine ottenuta con luce visibile. L'imaging LDIR (Laser Direct Infrared) rivela la distribuzione di ogni specie chimica in pochi minuti, come mostrato qui per un riquadro di 7 mm x 7 mm al centro della compressa.

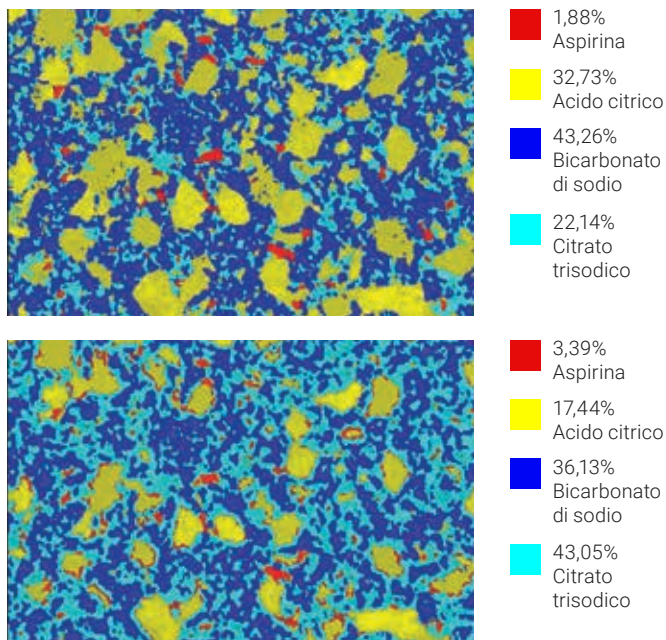


Figura 2. In alto: l'immagine chimica LDIR della regione centrale della compressa dopo che questa è stata tagliata mediante microtomo ed esposta all'umidità ambientale per due ore. In basso: la stessa regione dopo un'esposizione di 24 ore. Ciascuna immagine ha dimensioni 7 x 7 mm e mostra quattro costituenti. Ciascuna immagine è stata acquisita in un tempo di soli 11 minuti con una dimensione dei pixel di 10 µm.

www.agilent.com/chem/8700-ldir

Solo per scopi di ricerca. Non utilizzabili per procedure diagnostiche.

Le informazioni fornite possono variare senza preavviso.

© Agilent Technologies, Inc. 2018
Stampato negli Stati Uniti, 19 settembre 2018
5991-7511ITE

 **Agilent**
Trusted Answers