

## Agilent 8700 LDIR 激光红外成像系统 用于药物多晶型的快速鉴别和分类



### 前言

同一分子的不同晶型具有不同的物理化学性质（如溶解度、热力学稳定性、生物相容性和疗效），因此，对活性药物成分 (API) 的多晶型表征十分必要。了解多晶型形成的条件和化学性质是保证药物性能一致性和产品质量控制的关键。

红外 (IR) 光谱常用于鉴定不同的药物晶型，Agilent 8700 LDIR 激光红外成像系统可快速鉴定和区分固体制剂中的多种晶型。

## Agilent 8700 LDIR 激光红外成像系统分析多晶型的主要优点

### 快速分类和鉴别

Agilent Clarity 软件允许用户创建方法，以区分混合物中的每种药物晶型和赋形剂。通过仅在重要波长处收集信息，Agilent 8700 LDIR 可大大减少对成分分布进行空间成像所需的时间。

### 快速分析和成像

分析速度对于多晶型的研究而言至关重要，因为晶型的转化在几分钟内即可发生，表征这些转化需要快速的成像方法。Agilent 8700 LDIR 可在达到最终平衡状态之前对这些转化进行实时成像。

### 出色的分辨率

Agilent 8700 LDIR 具有在低至 0.1  $\mu\text{m}$  的像素分辨率下测量百万像素衰减全反射 (ATR) 图像的独特能力。这一能力可轻松实现晶体生长过程的观察。在反射模式下以高分辨率观察更大的区域使多晶型的形成和转化分析更具有统计学准确性。

### 易于使用的仪器和软件

可获得整个片剂或针对小样品区域进行详细研究的高空间分辨率图像，而无需更换任何仪器光学元件或物镜。独特的 Agilent 8700 LDIR 单点扫描模式使您可以在开始数据采集之前确定空间分辨率。

### 相对定量分析

通过 Agilent Clarity 软件还可以确定多晶型药物和其他成分（如赋形剂）的相对含量，无需开发单独的定量方法。

## 分析示例：卡马西平多晶型的 LDIR 成像

卡马西平 (CBZ) 是一种抗惊厥和稳定情绪的药物<sup>[1]</sup>，具有多种晶型。四种晶型 (III > I > IV > II；室温稳定性顺序) 中，只有晶型 III 具有治疗作用<sup>[1,2]</sup>。在开发 CBZ 固体制剂时，检测和了解无治疗效果的晶型 I 的形成尤为重要。LDIR 成像可对晶型 I 和 III 进行快速鉴别和成像。

首先采集样品中的两种晶型和纤维素赋形剂的谱图，然后，Agilent Clarity 软件通过为三种成分分别选择关键特征性波长来创建快速成像方法（图 1）。

然后将此方法用于整个片剂的多晶型成像。

27 分钟内以 10  $\mu\text{m}$  像素分辨率获得的 13 mm 片剂的图像如图 2 所示。对两种配方进行了研究：(1) 5.2% 晶型 I 和 15.4 % 晶型 III 及 (2) 15.3% 晶型 I 和 5.5% 晶型 III，以重量计，其余成分为纤维素。在不考虑不同晶型密度差异的情况下，测得的表面浓度与已知重量百分比呈现良好的相关性。可单独显示三种主要成分的化学分布，如图 3 所示。



Agilent 8700 LDIR 激光红外成像系统

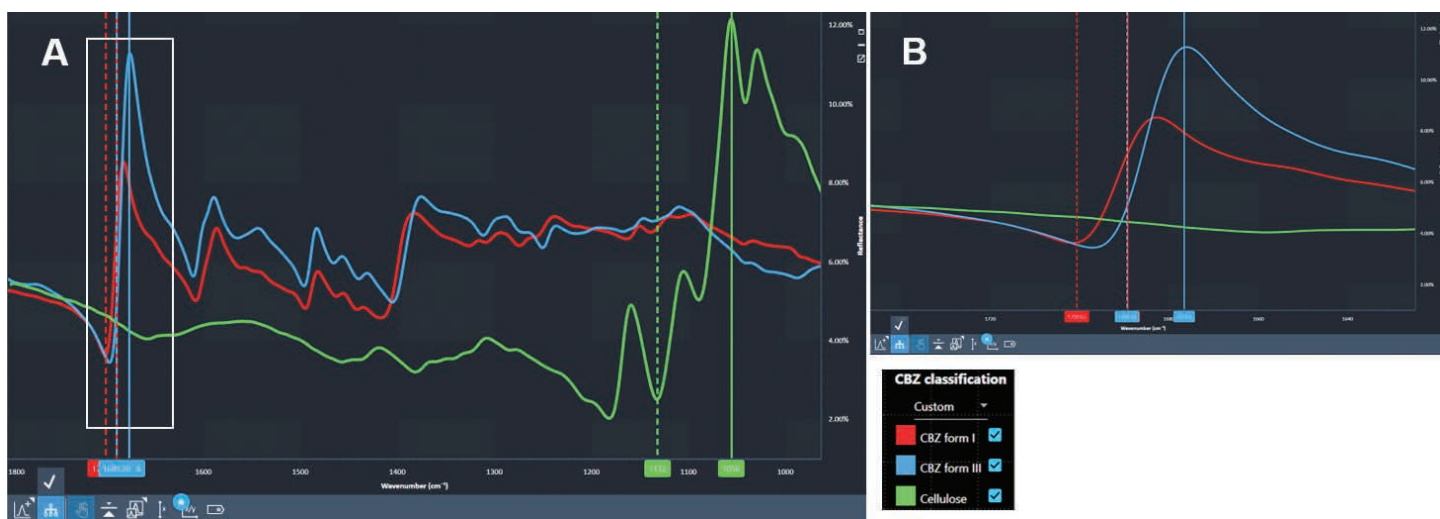


图 1. (A) 纯组分（CBZ 晶型 I、晶型 III 和纤维素）的谱库反射谱图——峰（实线）和基线（虚线）。自动选择每个成分的位置并形成成像基础。(B) 放大图 1A 中的白色插入框区域并显示晶型 I 和 III 分类所选择的波长

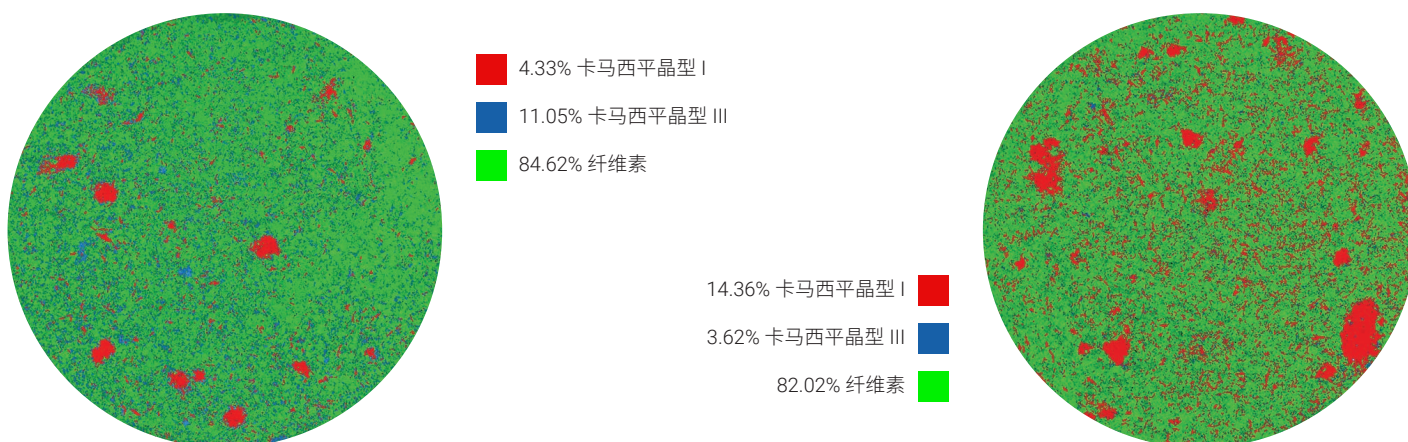


图 2. 13 mm 片剂的化学成像显示了 10  $\mu\text{m}$  像素分辨率下卡马西平晶型 I、晶型 III 和纤维素的分布。在 10  $\mu\text{m}$  像素分辨率下，13 mm 直径的片剂样品仅需要 27 分钟即可完成化学成像

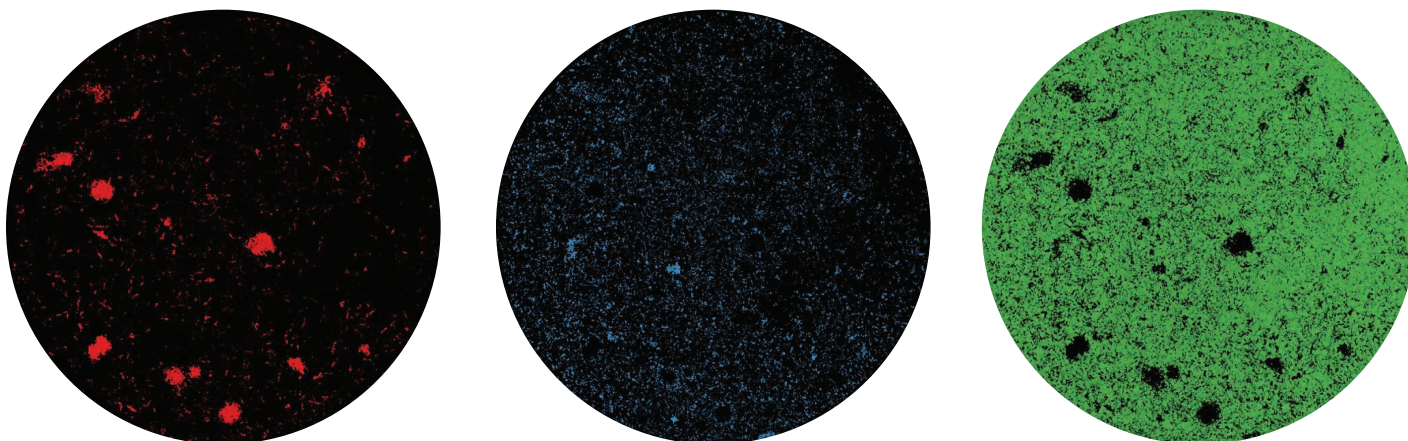


图 3. 从左到右：片剂中 CBZ 晶型 I、晶型 III 和纤维素的单独化学成像

## 参考文献

1. Czernicki, W; Baranska, M. Carbamazepine polymorphs: Theoretical and experimental vibrational spectroscopy studies. *Vibrational Spectroscopy*. **2013**, Vol (65) 12-23
2. Grzesiak, AL; Lang, M; Kim K; Matzger, AJ. Comparison of the four anhydrous polymorphs of carbamazepine and the crystal structure of form I. *J. Pharm. Sci.* **2003**, Vol. (92) 2260-2271

查找当地的安捷伦客户中心：

[www.agilent.com/chem/contactus-cn](http://www.agilent.com/chem/contactus-cn)

免费专线：

800-820-3278, 400-820-3278 (手机用户)

联系我们：

[LSCA-China\\_800@agilent.com](mailto:LSCA-China_800@agilent.com)

在线询价：

[www.agilent.com/chem/erfq-cn](http://www.agilent.com/chem/erfq-cn)

[www.agilent.com/chem/8700-ldir](http://www.agilent.com/chem/8700-ldir)

仅限研究使用。不可用于诊断目的。

本文中的信息、说明和指标如有变更，恕不另行通知。