

# NCE DP 原薬や製剤の少ボリュームの溶出速度と膜透過性測定

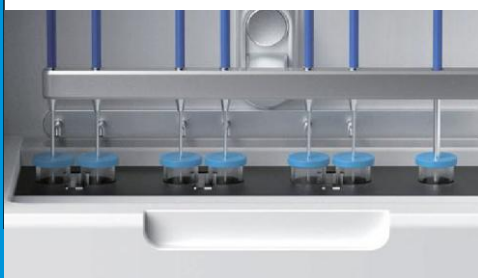


NCE DP 溶出・透過性分析装置は、マイクロ溶出・透過分析プラットフォームとin-situ光ファイバー分光計から構成される新世代の研究開発分析装置です。

本装置はヒト消化管の生理的環境をシミュレートすることができ、生理的条件下における薬剤の溶出・透過の研究に用いられます。以下の研究を効果的にサポートします。

★薬物透過モデルの研究    ★原薬の固有溶解速度の研究    ★pHシフトモデルの研究

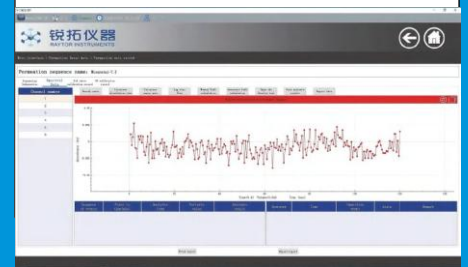
リアルタイムオンライン検出用6ch光ファイバーシステムによる、安定した高信頼性データ



試験液切り替え装置使用で異なる試験液の自動添加が可能



テスト後、データはソフトウェアで直接分析可能



イントリンジック固有溶解速度測定用コンポーネント



独自のバイオフィラックス膜を搭載しており、生体内の膜透過をシミュレート



膜透過性試験用コンポーネント

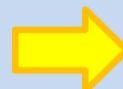
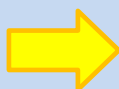


# ■ NCE DP—アプリケーション

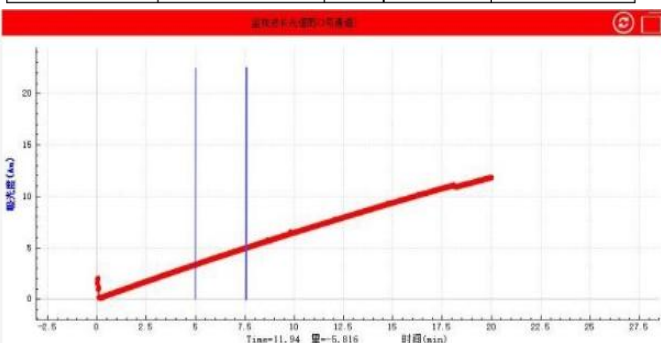
Raytor NCE DP (New Compound Dissolution and Permeation Research System) は、6 チャンネル光ファイバー システム、6 チャンネル精密溶媒注入システム、およびスペクトルアルゴリズムシステムで構成されており、適切なコンポーネントを使用して次の 3 種類の分析を実行できます。

## イントリンジック固有溶解速度測定

APIの結晶と塩の溶解速度の区別や、NCE分子の溶出速度を測定するために使用されます。APIのBCS分類の評価、適切な試験液の選定、APIの最適化（結晶/塩形態）に役立ちます。薬物血中濃度の上昇速度への影響は、溶出速度が速いほど、溶出速度の影響の可能性は低くなります。溶出速度が遅い場合は、溶出速度が律速となります。



Media	Drug name	Setting speed	wavelength
PH6.8 PBS	Carbamazepine	100rpm	285



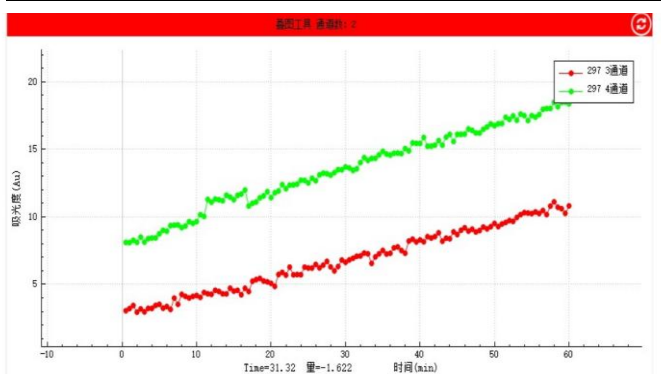
Spectral analysis table

Sequence of events	Point in time(min)	Analyze the project	Variable value	Analysis
1	5.02 - 7.50	Rate of Dissolution	3.36 - 4.92	0.63 Concentration / time

イントリンジック固有溶解速度測定結果の分析  
カルバマゼピンの溶解速度と吸光度-時間曲線から固有溶解速度を計算する方法を示しています。

- 実験結果は、図の曲線の傾きによって分析され、サンプルの固有溶解速度を決定します。
- 装置に付属のソフトウェアは、曲線の傾きを分析できるだけでなく、一定の範囲内での曲線の傾き分析も実行できます。

Media	Drug name	Setting speed	wavelength
FASSIF / PBS	Ciprofloxacin	100rpm	323

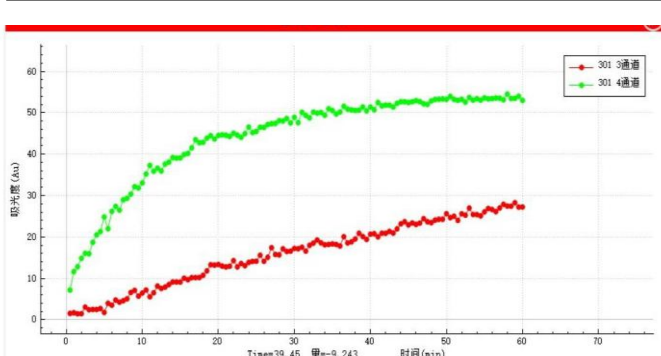


サンプル： シプロフロキサシン

シプロフロキサシンの例では、固有溶解速度試験を実施する場合、試験液の種類によって結果が異なります。

- 生体内の溶出挙動を知るには、バイオリレバント試験液を用いた方法が推奨されます。
- 一般的な試験液とバイオリレバント試験液の条件下での固有溶解速度試験の結果は異なります。
- 試験を完了するのに20~30mlのバイオリレバント試験液で十分なため、貴重なAPIとバイオリレバント試験液の使用量を削減できます。

Media	Drug name	Setting speed	wavelength
PBS PH6.5 / 2.0	indomethacin	300rpm	322



サンプル： インドメタシン

インドメタシンの例では、固有溶解速度試験の結果は、同じ種類の試験液でも pH 値によって異なります。

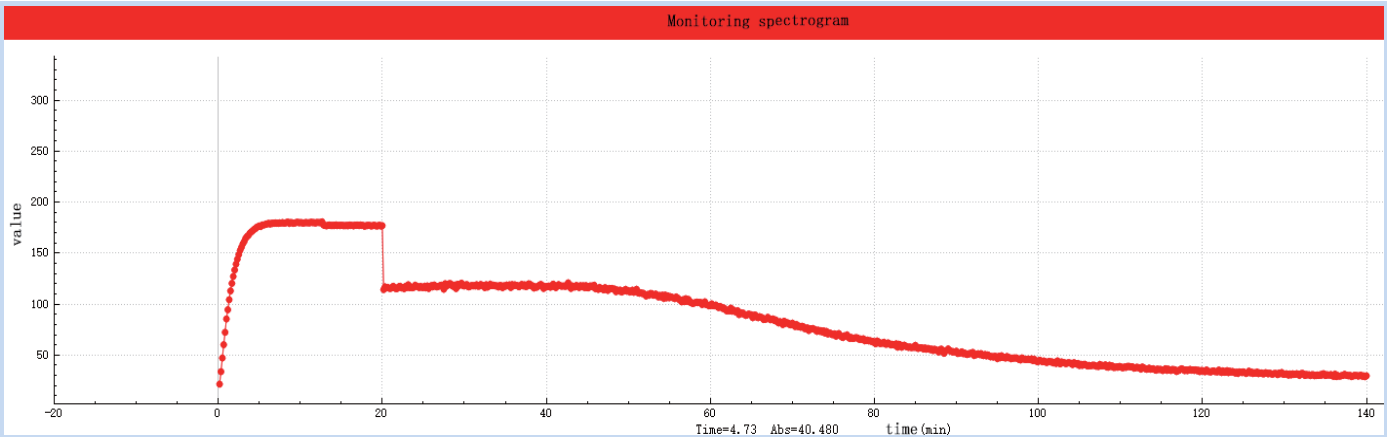
- pH値の違いにより薬物の溶出速度が大きく変動する可能性があり、これは臓器ごとの薬物の溶出速度の違いを反映している可能性があります。
- 6チャンネルのオンラインUVファイバーのみで迅速に試験結果を取得できるため、ハイスループットスクリーニングが容易になります。

# ■ NCE DP—アプリケーション

## pH シフトモデル

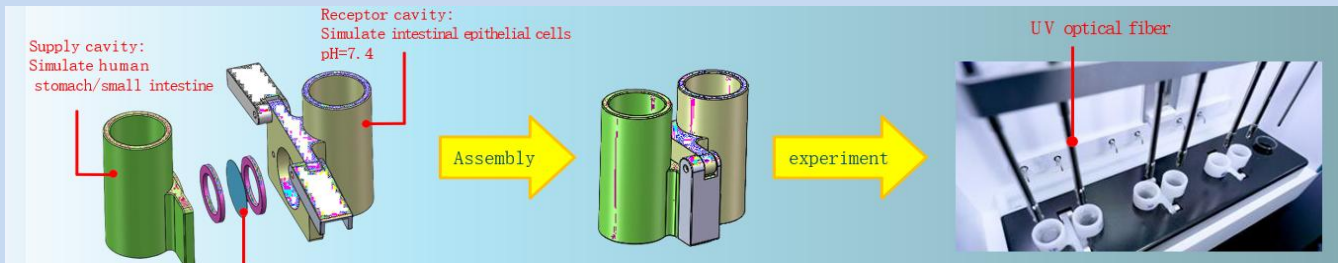
人体内の環境は静的ではありません。異なる臓器、あるいは同じ臓器でも異なる段階では、pH値が大きく異なります。これらの変化は、製剤の溶出、さらには吸収にも影響を与えます。したがって、異なるpH環境下における薬物の溶出を理解することは、生体内における製剤の溶出挙動を予測する上で役立ちます。

NCE DPは、試験液を自動的に切り替えることで、試験液中の薬物の溶解と沈殿を検出します。ここでは、NCE DPを用いて、試験液を切り替えた条件下におけるケトコナゾールの溶解と沈殿を、吸光度-時間曲線によるリアルタイム応答で検出した事例を示します。



## 透過モデル

製剤は溶出に加えて、体内での透過段階も経ます。薬物の透過性は、薬効の強さに直接影響を与えます。薬物が人体に取り込まれる一般的な経路は、腸管上皮細胞を経由することです。Raytor NCE DPは、Bio-Flux膜を用いて、体内における受動輸送をシミュレートするin vitro透過モデルを構築し、透過性を評価します。



PAMPA法を用いて、受容側と供給側の薬剤濃度変化を同時に検出することで、有効膜透過係数 ( $P_{eff}$ ) を決定します。この方法は、優れた感度と精度を持ち、オーバーレイ解析に対応しているため、サンプル間の差異を検出するのに役立ちます。



# NCE DP Dissolution & Permeation Analyzer

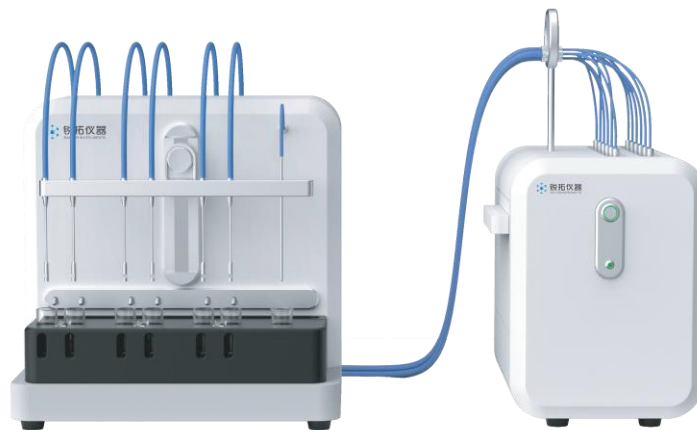
## 適用例

- 化合物の見かけの溶出速度を迅速に測定し、化合物の透過性を評価し、薬剤の律速段階を判定します。
- pHシフトモデルを用いて薬剤の過飽和容量を理解し、添加剤の適合性を検討します。
- 透過モデルを用いて添加剤や生理的条件が薬剤透過に及ぼす影響を検討し、薬剤の生理学的特性の理解を深めます。
- 薬剤に関する理解を深めることで、薬剤の生物学的関連性を向上させ、新薬の適合性評価や臨床承認の可能性を高めます。

## Technical parameters

攪拌速度: 100~1000 rpm  
UV測定波長: 200~600 nm  
重水素ランプ寿命: > 1000 h  
液体添加量: 2~20mL

温度制御: 室温 +5 °C~40 °C  
波長正確さ: 1 nm  
測定チャンネル: 6 or 3 (透過試験)  
添加液量正確さ: < 1 %



## NCE DP6

溶出試験器などに挿入して製剤の溶出速度をリアルタイムで測定する場合は、UVファイバーオプティクス検出器をNCE DP6として発売しております。

- 検出間隔は柔軟に変更可能で、高速溶出サンプルでは5秒以内に試験液中の溶出動態を正確に捉え、リアルタイムで薬物溶出挙動を反映可能。
- 複雑な前処理不要 – 試験液中の吸光度を直接測定でき、完全自動化24時間無人運転が可能。



## Technical parameters

UV測定波長: 200~600 nm  
重水素ランプ寿命: > 1000 h  
ベースライン平坦度:  $\leq 0.002$  AU

波長正確さ: 1 nm  
測定チャンネル: 6  
最小検出間隔: 2 秒



輸入代理店

株式会社アイビック・リサーチ

〒300-1222 茨城県牛久市南2-7-67

TEL:029-875-4739

<https://www.ivicres.com/>