

## EPR的制药应用

### V. 顺磁杂质分析

所有药物都含有活性药物成分 (API) 或惰性物质 (辅料) 可能产生的杂质。配方过程、包装和储存期间也可能将杂质引入到药品中。杂质会产生许多有害的影响, 比如:

- 降低治疗效果
- 缩短药品的贮藏寿命
- 诱发毒性

鉴定、量化和控制活性药物成分和药品中的杂质对药物开发至关重要。有机杂质通常是副产物、中间体或降解产物中的自由基。无机杂质包括过渡金属、试剂和配体。

电子顺磁共振 (EPR) 波谱是目前唯一能够直接、非侵入式地检测、鉴定和量化顺磁性杂质 (有机自由基和过渡金属) 的技术。EPR能够检测到含量低至十亿分之一水平的痕量杂质。

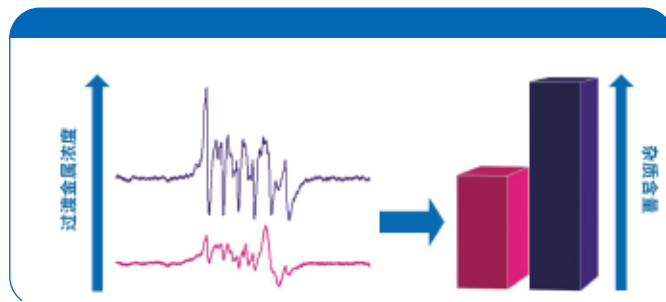
#### 挑战

在药物开发、生产过程和储存期间鉴定和监测杂质对满足监管要求至关重要。

#### 解决方案

Magnettech ESR5000台式EPR波谱仪

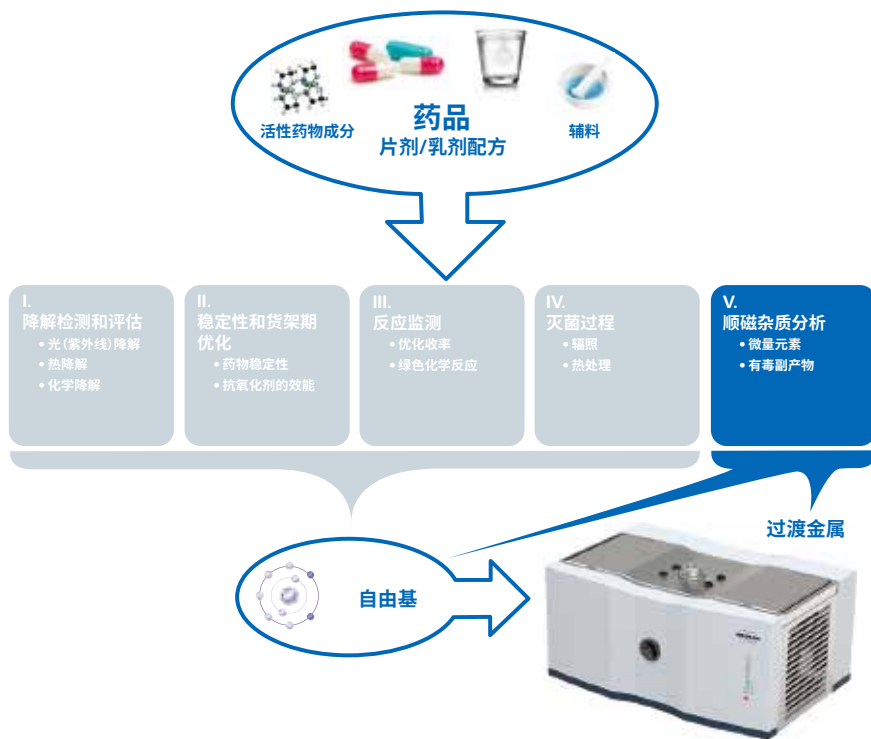
- 检测和鉴定微量过渡金属
- 监测产生和涉及自由基的药物降解过程
- 观测过渡金属或其他杂质催化产生的自由基



金属浓度与EPR信号的相关性

#### Magnettech ESR5000的主要特点:

- 无需拥有EPR经验
- 结果精确
- 卓越的灵敏度
- 易用性
- 测定、分析和量化自由基的完整工作流程
- 尺寸紧凑
- 持有成本低

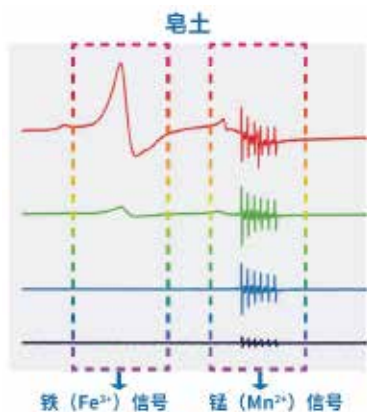


## 小结

杂质检测、表征以及监测杂质及其对药物稳定性的影响至关重要，也是一项强制性要求。Magnettech ESR5000波谱仪是您应对活性药物成分、辅料和配方中活性杂质挑战的解决方案。通过使用EPR，用户可以深入了解药物的稳定性“软点”，这对于开发可靠的药品十分重要。

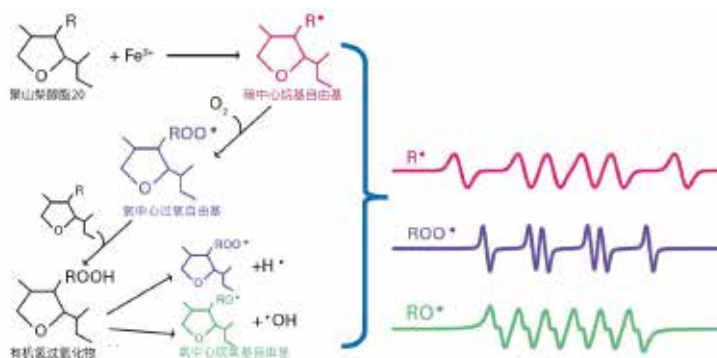
## 参考文献

1. Lam X.E. et al.(Genentech Inc.), Site-specific tryptophan oxidation induced by autocatalytic reaction of polysorbate 20 in protein formulation, *Pharm. Res.* (2011) 28 2543
2. Wu Y. et al. (Bristol-Myers Squibb Co.), Understanding drug-excipient compatibility: Oxidation of compound A in a solid dosage form, *Pharm. Dev. Technol.* (2009) 14 556
3. Williams H. (AstraZeneca), Claybourn M., The power of electron paramagnetic resonance spectroscopy in pharmaceutical analysis, *Spectroscopy Europe* (2006) 18(1)



### 微量元素分析: 杂质鉴定与控制

- 辅料皂土中存在微量锰 ( $Mn^{2+}$ ) 和铁 ( $Fe^{3+}$ )。皂土通常用作片剂填充剂。
- 使用Magnettech ESR5000可以测定杂质浓度。
- 金属含量增加会加快活性药物成分和辅料的降解速度。



- 在药物配方中用作稳定剂的聚山梨醇酯20发生自氧化反应。
- 自氧化反应由过渡金属催化，导致侧链断裂和自由基形成。
- Magnettech ESR5000可以检测、鉴定和量化自由基杂质。



布鲁克磁共振微信公众号

### ● 布鲁克 (北京) 科技有限公司

网址: [www.bruker.com](http://www.bruker.com)  
E-mail: [sales.bbco@bruker.com](mailto:sales.bbco@bruker.com)  
布鲁克应用技术咨询:  
400-898-5858  
布鲁克售后技术支持:  
400-898-1088

布鲁克 (北京) 科技有限公司  
北京市海淀区西小口路66号  
中关村东升科技园B-6号楼C座8层  
邮编: 100192  
电话: (010) 58333000  
传真: (010) 58333299

上海办公室  
上海市闵行区合川路  
2570号1号楼9楼  
邮编: 200233  
电话: (021) 51720800  
传真: (021) 51720810

广州办公室  
广州市海珠区新港东路  
618号南丰汇6楼A12单元  
电话: (020) 22365885/  
(020) 22365886