

SS02-4 SPring-8利用の医薬品粉末結晶解析例の紹介

○寺田 勝英¹

¹東邦大薬

医薬品化合物において、結晶多形の存在は、その製造工程での安定性や物性変化に重要な影響を及ぼすことから、広く研究対象とされてきた。近年、その多形の結晶情報解析に粉末回折データが直接利用出来るように、測定方法・解析技術も進歩してきた意義は大きい。それまでは、代表的な結晶形についての単結晶を作成した後で結晶構造を得て 多形転移の考察をするしかなかったときとは状況が一変している。 我々は 2005 年より SPring-8 の重点産業利用課題にて BL19B2 の粉末回折実験を実施し、医薬品原薬の結晶多形構造解析をトルブタミド¹⁾、アクリノール²⁾などについて成功してきており、測定温度を変化させることも合わせて、熱分析結果に対応出来る結晶多形解析結果を得ている。

リシノプリルについては、2 水和物結晶を昇温に伴う脱水和過程が予め XRD-DSC 測定により観測されていたため、その連続した温度変化下の放射光粉末回折データを用いることで 1 水和物から無水和物にいたるまでの構造変化の解析に成功し、結晶水のチャンネル構造が観測された。

これらの結果を代表例として、今後とも薬学分野での粉末回折利用の活発化に期待したい。

- 1) G. Hasegawa, T. Komasaka, R. Bando, Y. Yoshihashi, E. Yonemochi, K. Fujii, H. Uekusa and K. Terada, Int. J. Pharm., 369, 12-18 (2009).

- 2) K. Fujii, H. Uekusa, N. Itoda, G. Hasegawa, E. Yonemochi, K. Terada, Z. Pan and K. D. M. Harris *J. Phys. Chem. C*, accepted