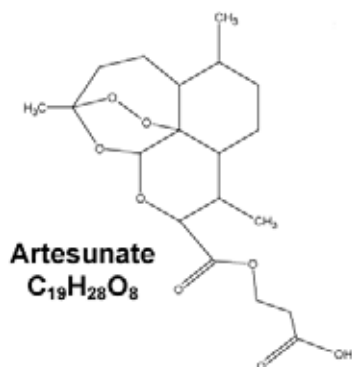


～Application Note for DART～

前処理不要の不正医薬品の迅速スクリーニング

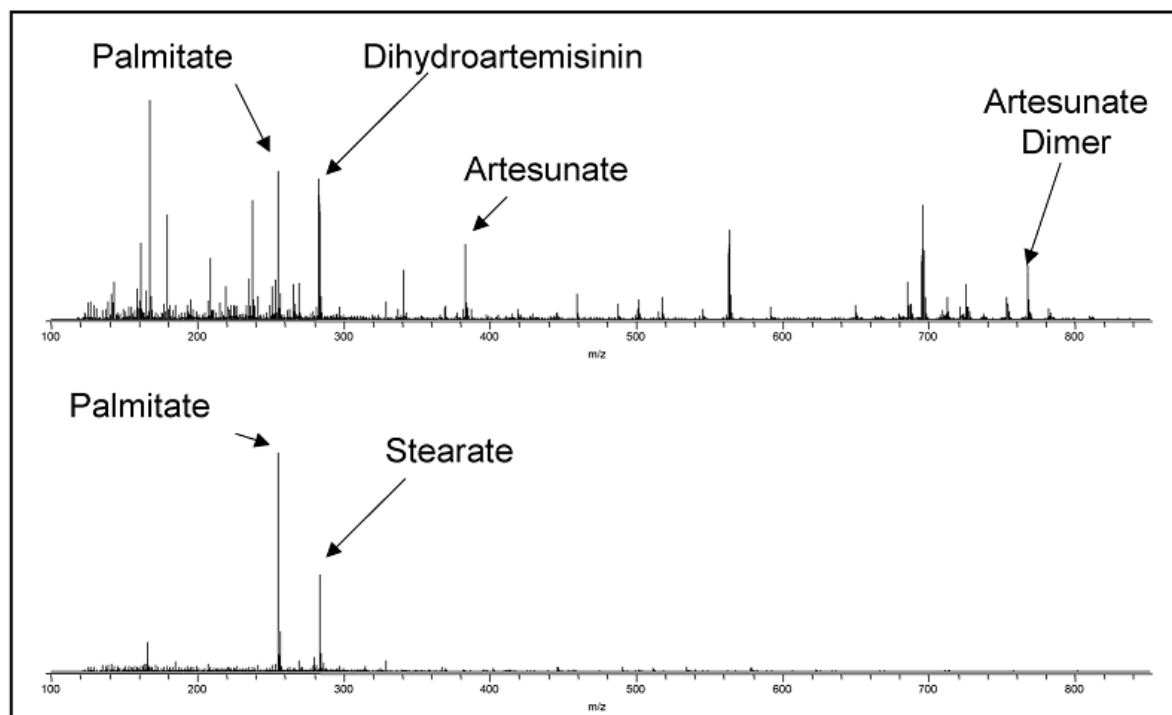
不正医薬品は公衆衛生上の深刻な問題となってきた。不正医薬品に関する米国FDAによる公開捜査の数は 2000 年から 2001 年にかけて急増しており、最近でもその数は多く推移している¹⁾。不正医薬品は違法であるだけでなく、危険である。というのも、不正医薬品には本来の薬成分が少ししか含有されていない、あるいはまったく含有されていないものや、さらには毒性を持つ可能性のある、まったく異なる成分が含有されているものがあることに起因する。この問題は世界的なものとなっており、たとえば、アフリカにおけるすべての抗マラリア薬の 50% 近くが不正医薬品であると報告されている¹⁾。

DART (Direct Analysis in Real Time) イオン化法は不正医薬品のスクリーニングのための簡易的な解決方法である。DART イオン源を用いることにより、錠剤あるいは薬剤を質量分析計の前にかざすことで数秒以内に薬剤中の薬成分の有無を検出可能である。DART イオン源と飛行時間質量分析計 JMS-T100LC “AccuTOF” と組み合わせることにより、既知および未知物質の精密質量と正確な同位対比が得られ、それらの元素組成を得ることが可能である。



上段のスペクトルはArtesunateを含む抗マラリア剤“Guillin B”の真正薬、下段のスペクトルはまったく有効成分を含まず、単に結合剤（ステアリン酸とパルミチン酸）だけの不正薬の分析結果である²⁾。前処理していない分析対象をDARTイオン源前にかざすだけで、数秒以内でマスペクトルが得られた。

ここで、真正薬で検出された m/z 283.15476 のイオンの組成は $C_{15}H_{23}O_5$ （DihydroartemisininあるいはArtesunateの分解物）であると同定された。このイオンの測定値は得られた組成式の計算値と0.2mmuの質量差であり、不正薬で検出された m/z 283.26405 ($C_{18}H_{35}O_2$ 、はステアリン酸)とは精密質量によって区別することが容易に行なえる。このことは、同じ整数質量の化合物を正しく同定する上で、AccuTOFによる精密質量測定的重要性を示している。



真正抗マラリア剤 (上段) と偽抗マラリア剤 (下段) の分析

1. http://www.fda.gov/oc/initiatives/counterfeit/report02_04.htm#scope
2. 試料提供: Prof. Facundo Fernandez, Georgia Institute of Technology