

# 羟丙基 环糊精/羟丙基-倍他环糊精

产品名称	羟丙基 环糊精/羟丙基-倍他环糊精
公司名称	江苏丰园生物技术有限公司
价格	360.00/公斤
规格参数	产品名称:羟丙基 环糊精 含量:98 (%) 用途:医药中间体
公司地址	江苏省宿城经济开发区内南一路南侧
联系电话	0527-84696458 13812302405

## 产品详情

产品名称	羟丙基 环糊精	含量	98 (%)
用途	医药中间体	CAS	128446-35-5

羟丙基-β-环糊精(hydroxypropyl-β-cyclodextrin)是β-环糊精的一种羟烷基衍生物。它不仅与β-环糊精一样,对许多化合物有优良的包络作用,可提高被包络物质的稳定性,而且水溶性高、能提高被包络药物的释放速度和生物利用度。本文对羟丙基-β-环糊精的特性、应用及其包合物的制备方法进行了综述,为其在医药研究中的应用,提供参考。

### 1 羟丙基-β-环糊精的特性?

在《中国药典》《基本药物名录》中难溶、不溶于水的药物约占1/3,增加这些药物在水中溶解度以提高药效,意义重大。利用β-环糊精或其衍生物与药物的配合作用来增加药物的水溶性,是多年来广泛研究的方法。但β-环糊精本身的低溶解度限制了它的应用;而羟丙基-β-环糊精水溶性好,热稳定性高,溶血作用低,是低毒、安全、有效的药物增溶剂,被认为是极有潜力的注射用辅料。它具有以下特性。

1.1 羟丙基-β-环糊精在常温下,水溶性很高,一般都超过50%(在室温下,溶解度为750 mg/ml,而β-cd为18 mg/ml)。

#### 1.2 羟丙基-β-环糊精

β-环糊精与β-环糊精对被包络物的选择性有所不同,对某些物质包络的分子比例可能不同。

1.3 羟丙基-β-环糊精与β-环糊精在人体内基本上不被分解代谢,也不积累。口服羟丙基-β-环糊精基本上全部以完整形态随大便排出体外;非肠道给药,基本上以完整形态随尿液排出体外;但β-环糊精水溶性低,非肠道给药有肾毒性,不能用作注射。

1.4 羟丙基-β-环糊精比β-环糊精或其他衍生物(如甲基化-

—环糊精)的表面活性低，溶血活性低，使用更安全。

2.羟丙基— $\beta$ -环糊精的应用由于羟丙基— $\beta$ -环糊精具有上述特性，受到广泛的关注。它主要应用于以下几方面：

2.1 增加难溶性药物的水溶性由于羟丙基— $\beta$ -环糊精溶解度大，难溶性药物被它包络后能显著增加水溶性。所以它是难溶性药物较理想的增溶剂。邵伟等用羟丙基— $\beta$ -环糊精包合黄芩苷，结果表明，黄芩苷在水中的溶解从0.112 mg/ml增加到2.743 mg/ml，溶解度增加了24.5倍。

2.2 增加药物稳定性羟丙基— $\beta$ -环糊精能更好地增加被包络药物的稳定性。例如：雌二醇用羟丙基— $\beta$ -环糊精包络后，在室温下放置，其降解的半衰期由1.2年延长到4年。

2.3 降低药物毒副作用羟丙基— $\beta$ -环糊精能有效降低药物的毒副作用。例如：血管扩张药物尼莫地平难溶于水，口服易受肝脏的首过作用。0.05 mol/l羟丙基— $\beta$ -环糊精可将其溶解度提高60倍，对肌肉的刺激性减小。

j. 羟丙基— $\beta$ -环糊精还能缓解依托咪酯引起的注射疼痛。

2.4 提高药物利用度将羟丙基— $\beta$ -环糊精与难溶性药物制成包合物后，不仅可增加药物溶解度和溶出速率，还能提高口服生物利用度。例如：熊去氧胆酸被羟丙基— $\beta$ -环糊精包络后，崩解时间与上市产品相同，但溶出快而完全，健康受试者口服生物利用度和峰浓度是市售品的两倍多。

### 3.羟丙基— $\beta$ -环糊精包合物的制备方法

3.1 溶解方法(1)如果被包络的物质为水溶性物质，可以把被包络的物质与羟丙基— $\beta$ -环糊精按一定比例溶于水中。(2)如果被包络的物质难溶于水，可以把被包络物质溶于乙醇、甲醇等溶剂中；把羟丙基— $\beta$ -环糊精溶于水或醇中，两种溶液按一定比例互溶或混溶。

3.2 促进包络反应的方法将上述混合液在室温或低温下进行：

高速搅拌； 超声波处理； 胶体磨研磨； 匀浆机匀浆(高压或低压)，可以促进包络反应。

3.3 包络复合物的干燥包络处理后的样品，可以采用减压烘干然后粉碎，也可以用喷雾干燥法或冷冻干燥法。

### 4.包络复合物的检测

一般可以采用荧光光谱法测定包络物形成常数或荧光各向异性。另外也可以用核磁共振法、高效液相色谱法或薄层层析法，分析羟丙基— $\beta$ -环糊精对某种物质的包络情况。

以上所述各种包络方法，仅供参考。对于不同性质的物质可以选择不同的处理方法。即使是同一处理方法，也会因处理温度、溶液浓度、处理时间长短、处理强度不同，得到不同的包络效果。

羟丙基倍他环糊精具安全剂量大、与血液相溶性好、不改变药效、增加药物的水溶性、稳定性等特点，被认为是比较有前途的药物载体材料。随着科技的发展，羟丙基— $\beta$ -环糊精在中药方面的应用将会越来越广，必将走向医药工业，在大生产中发挥其独特的作用。