

羟丙基-β-环糊精

产品名称	羟丙基-β-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:128446-35-5 型号:HPBCD 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	128446-35-5	型号	HPBCD
用途	医药中间体	外观性状	白色粉末
含量	98 (%)		

羟丙基倍他环糊精 (hydroxypropyl-beta-cyclodextrin; hp-β-cd) 是β-环状糊精的一种羟烷基化衍生物。它是近几年有关制备方法, 毒理试验, 应用范围研究的比较透彻的β-cd衍生物之一。hp-β-cd不但可以与β-cd一样对许多化合物具有优良的包络作用, 提高被包络物质的稳定性, 而且它还具有水溶性高和在生物体内提高被包络药物的释放速度和生物利用度。因此, hp-β-cd具有一些特殊的优良特性, 应用范围更广, 在医药上最具有应用前途。hp-β-cd是在β-cd的c2、c3和c8位的羟基被羟丙基取代生成的衍生物。由于反应条件不同, 羟丙基取代的位置不同, 因此可以形成2-hp-β-cd、2,3,6-hp-β-cd等几种系物。β-cd中的羟基被丙基取代后, 生成的hp-β-cd除了分子不具有还原性, 在碱性介质中很稳定, 能被强酸分解, 具有分子包络作用以及对人无毒等与β-cd相同之外, 它还有以下特点与β-cd不相同。

例如: 1、hpβcd在常温下, 水溶性很高, 一般都超过50%, 所以它在醇水溶液中不能结晶。
2、hpβcd与βcd对被包络的物质的选择性有所不同, 对某些物质包络的分子比例可能有改变。
3、hpβcd在人体内基本上不被分解代谢, 也不累积, 口服hpβcd绝大部分随大便排出体外, 非肠道给药, 基本上全部随尿液排出体外。
4、hpβcd在生物体内可以促使被包络物质迅速释放。
5、hpβcd比βcd或其他衍生物(如甲基化βcd)的表面活性低, 溶血活性低, 使用更安全。由于hpβcd具有上述特性, 所以它在药物界越来越受到广泛的关注。为了增强人们对hpβcd应用方面的了解, 下面举例说明: 1、在增加难溶性药物的水溶性方面。例如: 双氢青蒿素和蒿甲醚本身不溶于水, 用hpβcd包络后, 其溶解度可以达到粉针剂的要求。狄高辛在50%的hpβcd溶液中比在水中的溶解度由0.07mg/ml, 增加到68mg/ml。
2、在增加药物稳定性方面。例如: 雌二醇用hpβcd包络后, 在室温下放置, 其降解的半衰期可以由1.2年延长到4年。
3、在降低药物毒副作用方面。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。利用hpβcd制成注射剂, 进行肌肉给药, 可以使生物对药物的吸收显著增加, 并能减轻对胃肠或肌肉组织的损伤。
4、在提高药物利用度方面; 例如: 甾体激素被hpβcd包络后, 不但溶解度高, 释放速度快, 而且与未经包络的激素相比, 血液中的药物水平可以高出2倍左右。
5、在hpβcd的安全性方面。根据系统的亚急性和慢性毒性研

究证明，hp cd不会引起小鼠疾病，也不导致死亡。给家兔静脉注射后，hp cd迅速从血液中消除，随尿排出体外，连续注射也无不良症状。对鼠和猴静脉注射给药200mg/kg hp cd不显示临床影响。单纯口服或静脉注射hp cd的剂量分别高达15g/kg或10g/kg，对猴子也不致死。人的临床研究表明hp cd口服，静脉输液，静脉注射，鼻腔、舌下及眼部给药，没有显示不良的反应及对皮肤、眼部和肌肉的刺激性。这说明hp cd对生物是非常安全的。

如果按下表进行hp cd给药是绝对安全的。hp cd对人体给药途径及剂量

1、静脉输液	使用总量：30g	使用方法：5%连续4天
2、静脉注射	使用总量：3g	每次用量：150mg/kg
3、口服（百分比）	使用总量：0.2g/kg	每次用量：0.2mg/kg
4、鼻腔	使用总量：600mg/天	每次用量：40mg/天
5、口腔舌下	使用总量：120mg/kg	每次用量：120mg/kg
6、皮肤	使用总量：45%水溶液	另一方面由于hp cd溶血活性低，表面活性低，对皮肤和肌肉无刺激性，即使hp cd的浓度达到100mg/ml,进行肌肉注射，也无刺激性。在这些方面hp cd大大优于其它助溶剂。

羟丙基-β-环状糊精理化指标：外观：白色结晶粉末
纯度：>98%取代度：4-9旋光度：+120~+145°含水量：<3.0%重金属（以铅计）：<10ppm砷：<5ppm灰分：<0.1%未取代bcd含量：<0.2%cfu/g:<100 由上所述hp cd的确是当前最好的药物载体。