

## β-环糊精衍生物（CAVASOL®系列）的复合包接工艺

甲基或羟丙基-β-环糊精（CAVASOL® W7 M 和 CAVASOL® W7 HP）的复合包接物质，绝大多数是水溶性的。工艺上，我们通常使用下列三种方法得到 β-环糊精衍生物（羟丙基-β-环糊精和甲基-β-环糊精等）的固体复合物。

### 方法一：液相复合包接法

在制备 CAVASOL® W7 M 或 CAVASOL® W7 HP 的复合物之前，很重要的工作是先测算被包含的客体在 20%的 CAVASOL® W7 M 或 CAVASOL® W7 HP 水溶液中的溶解度，来确定一个合适的客体对环糊精的比率。

用超过客体溶解度的超额浓度来进行包含，例如如果客体在 20%的 CAVASOL® W7 M 或 CAVASOL® W7 HP 水溶液中的溶解度是 5%，就用 6%的客体被包含物质混入 20%的环糊精水溶液中，并在室温下搅拌 6-8 个小时。将超额的客体物质过滤掉，用冷冻干燥法可得到固体复合物。

### 方法二：膏状混合复合包接法（研磨法）

使用比液相复合包接法更高的客体对环糊精的比率进行复合包接，我们通常提高主客体比例到 1: 1 来研磨。方法如下：①准备 0.5 摩尔的 CAVASOL® W7 HP（700 克）和少量的水（大约 450ml）在研磨机里精细研磨成膏体。②取少量的大约 100 克的膏体加入研磨器中，加入 0.5 摩尔的客体化合物（纯净的或者溶于乙醇中），将混合物膏体连续研磨 3-4 个小时，混合过程中可能要加入适量的水以保持复合工艺过程中膏体的流动性。③取研磨物，提高温度（例如 50 度），在真空中干燥，碾磨可得到粉状的复合物。

### 方法三：有机溶剂复合包接法

在特殊的情况下，环糊精的衍生物同酯溶性客体化合物使用有机溶剂复合包接工艺效果比较好。

取等分子的 CAVASOL® W7 M（或 CAVASOL® W7 HP）和被包接的客体化合物溶于极性有机溶剂（例如乙醇）中，有的时候可能要将环糊精与客体化合物分别溶于不同的溶剂中，再将两种溶液混合搅拌并加入 2-5%的水，在室温中连续搅拌 6-8 个小时。用真空干燥法，将有机溶剂蒸发后碾磨得到粉状的复合物。

工艺技术文件由：**广州市泰龙生化科技有限公司** 提供

广州市东山区寺右南二街 18 号广兴华大厦 305B（邮编：510600）

Tel:86-20-87383772,13113328971

Fax:86-20-87385602

Email:[tiger@maxdragon.com](mailto:tiger@maxdragon.com)