

Prepare for Inclusion Complexes of β -Cyclodextrin and Polyrinyl Alcohol System and Study on Their Thermal Stability

He Hua, Qiu Ningying¹, Zhu Yu¹, Huang Zhi, Chen Yuying

Division of Analytical Chemistry, ¹Analysis and Computer Center, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009

The optimum conditions of preparing inclusion complex were investigated by orthogonal design and differential scanning calorimetry (DSC). Six inclusion complexes including β -cyclodextrin (β -CD)-polyriny alcohol (PVA)-coumarin *et al* were prepared. Their thermal stabilities were also studied. Inclusion complexes were heated at 80 °C for five days. It was found that the release rate of β -CD-coumarin and PVA-coumarin was 100%, but the release rate of β -CD-PVA-coumarin was 39.5%.

Key words Orthogonal design; DSC; β -CD inclusion complex; PVA inclusion complex; Stability

【文摘 009】取代苄基/萘甲基异喹啉类及有关季铵衍生物的合成与生物活性 许国友, 彭司勋, 华维一. 药学学报, 1994, 29(2): 95~106

以具有心血管活性的异喹啉类生物碱为先导物, 结合某些钾通道阻滞剂的结构特征, 设计合成了 28 个 3,4-二氢(I₁₋₄)和 1,2,3,4-四氢苄基/萘甲基异喹啉化合物(I₁₋₁₈)及有关季铵衍生物(I₁₉₋₂₂)。药理试验表明: 除化合物 I₁ 有一定升压作用外, 大多数化合物有不同程度的降压和减慢心率活性, 其中化合物 I₁ 的降压活性最强。分析定量构效关系发现: 化合物母核氮原子电荷愈大(即其绝对值愈小), 降压作用愈强; 反之, 减慢心率作用愈强。异喹啉母核氮原子电荷可能为影响作用于血管或心脏组织的重要因素之一。

【文摘 010】吡啶并色满酮衍生物的合成及其对血小板激活因子的拮抗作用 浦志海, 曹观坤. 中国药物化学杂志, 1994, 4(1): 9~14

根据已知的血小板激活因子(PAF)拮抗剂的结构特点和假设的 PAF 受体构象, 设计并合成了 7 个以吡啶并色满酮为母核, 在苯环氧桥对位用酰胺基

取代的化合物及母核的肟化物。设计新化合物时, 以含氮的三环为基本骨架, 用-O-代替-CH₂CH₂-连接芳环以适应容电子区域的要求, 同时, 用亲脂性较大的苯和卤苯甲酰基作为酰化基团对氨基进行取代。分别合成了对氯及间氯化物、对甲基化合物和一个吡啶并色满酮肟的衍生物。7 个化合物均未见文献报道。初步药理实验显示, 这些化合物对 PAF 诱导的兔血小板聚集都有不同程度的拮抗作用。拮抗活性相差不大, 构效关系不明显。

【文摘 011】13 α -去氢表雄酮的皮质甾类侧链及其 13 β -差向异构体的合成 徐芳, 李芳, 廖清江. 中国药物化学杂志, 1993, 3(12): 170~174

以 13 β 醋酸去氢表雄酮为原料经三步反应转变成 13 α -去氢表雄酮, 经缩合、乙酰化、还原等反应合成了 13 β , 21-二乙酰氧基-13 α -孕甾-5, 16-二烯-20-酮。同时还合成了这些化合物 13 β -差向异构体, 以比较反应性及波谱差异, 去氢表雄酮与硝基甲烷的缩合反应速度比其 13 α -差向异构体慢, 可能 13 β -角甲基对缩合反应有一定位阻影响。并发现乙二胺用量的改变会得到一个副产物, 为 13 α -去氢表雄酮肟。