

您现在的位置: 首页 > 新闻中心 > 科研动态

药物所通过构象选择地共晶形成稳定维生素D3

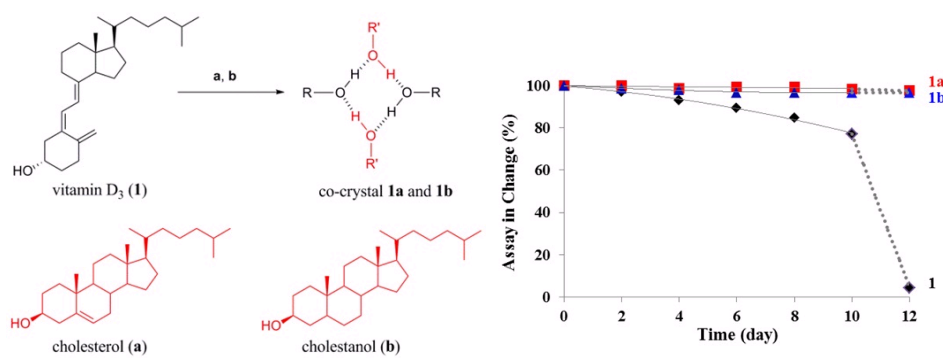
发表日期: 2014-07-23

打印 中 大 关闭 浏览次数:

维生素D₃ (VD₃)可用于治疗骨软化和骨质疏松症,物理和化学性质均不稳定。其结构存在一个不稳定的共轭三烯,易发生局部化学反应。因此,VD₃必须根据USP 34在特定的控制条件下储存和运输,并且由于不理想的固体性质,很少被制备成固体制剂,至今还没有有效的方法能解决其稳定性问题。

上海药物所梅雪锋研究组报道了由氢键相互作用形成的四元方形结构,继而形成的共晶1a和1b,这两个共晶通过一个意想不到的构象选择性的共结晶过程形成,并且与VD₃本身相比表现出了更为优异的理化性质。研究人员基于一组弱氢键相互作用的四元方形结构成功制备了VD₃两个共晶,通过这一构象选择性的共结晶过程得到了局部化学结构唯一并且稳定的固体结构。

获得的两个共晶结构相似,与VD₃本身相比,有更好的物理和化学稳定性。这一发现可能会鼓励运用共晶替代原来的VD₃,用于抗骨质疏松药物的发展,并且可能会进一步促进维生素D₃在食品和营养产业的广泛应用。



图一维生素D3 (1)和配体的化学结构(左图);

在40°C/75% RH条件下储存的维生素D₃的化学稳定性(右图)

(供稿部门:梅雪锋研究组;供稿人:王建荣)

评论