

# 利用ACQUITY UPC<sup>2</sup>系统 对联二酚萘(BINOL) 对映体进行分离

Acquity UPC<sup>2</sup>

Waters

## 目的

采用沃特世(Waters®)ACQUITY UPC<sup>2</sup>™系统比较正相HPLC和UPC<sup>2</sup>™方法分离联二苯酚对映体的效果。

## 背景

生物体由手性生物分子，如蛋白质、核酸和多糖组成；因此，它们对药物、食品、农药和废弃化合物中的对映体表现出不同的生物反应。因此，分离手性化合物，尤其是具有药物意义的化合物尤为重要。其重要性表现是以单对映体形式获批的手性药物数量不断增加。为符合FDA关于研发立体异构药物的严格指令，制药行业在进行药代动力学、药物代谢、生理学以及毒理学评价之前，已经加强手性纯化合物的制备。

在过去的10年里，超临界流体色谱(SFC)已经显示出其作为分离立体异构体(包括对映体和非对映体)的巨大前景。与传统的手性高效液相色谱(HPLC，主要是正相HPLC)相比，超临界流体色谱(SFC)平均快了3-10倍。超临界流体色谱使用廉价的CO<sub>2</sub>和极性改性剂(如MeOH)作为流动相，减少有机溶剂的消耗和处理，使分析更高效，更环保。

**与正相色谱HPLC相比，超高效合相色谱(UPC<sup>2</sup>)能够实现联二酚萘更快的分离(为正相HPLC的9倍)，且每次分析成本大大降低。**

## 解决方案

联二酚萘是一种轴手性有机物，如图1所示。联二酚萘样品采用正相HPLC和ACQUITY UPC<sup>2</sup>系统进行分离，两种方法的主要参数见表1。

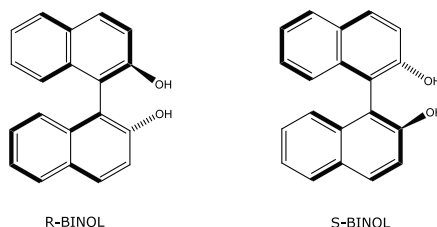


图1. 具有轴手性异构的联二酚萘。

	正相HPLC	UPC <sup>2</sup>
流速 (mL/min)	2	4
流动相	正己烷:异丙醇=98:2	CO <sub>2</sub> :methanol=75:25
背压 (bar)	n/a	120
温度 (°C)	Ambient	40
色谱柱	环境温度 (4.6 x 150 mm, 5 µm)	
样品浓度	2 mg/mL	
进样体积 (µL)	5	

表1. 正相HPLC和UPC<sup>2</sup>的实验参数。

Waters

THE SCIENCE OF WHAT'S POSSIBLE.™

图2给出了采用正相HPLC(A)和UPC<sup>2</sup>(B)分离手性联二酚萘图谱。与正相HPLC中的第二个峰18min的出峰时间相比, UPC<sup>2</sup>的出峰时间为2min, 使用UPC<sup>2</sup>速度增加至正相HPLC的9倍。正相HPLC的分离度(USP)为1.73, 而UPC<sup>2</sup>为2.61。这种情况也说明了使用UPC<sup>2</sup>可以大大地节约每次分析的成本。UPC<sup>2</sup>方法使用2mL的甲醇洗脱化合物, 但正相HPLC需要35.28mL正己烷和0.72mL甲醇。根据有机溶剂的用量计, 使用正相HPLC每次分析大约需要2.85美元, 而使用UPC<sup>2</sup>, 每次分析仅需要0.08美元。

UPC<sup>2</sup>图谱中的峰形比使用正相HPLC色谱得到的峰形性对称更好。正相HPLC的拖尾因子(TSF)分别为1.33和2.18; 而UPC<sup>2</sup>的拖尾因子分别为1.03, 1.03。UPC<sup>2</sup>图谱中的色谱峰比正相HPLC色谱峰更高, 更窄, 意味着更高的灵敏度和峰容量。在UPC<sup>2</sup>中, 由于使用超临界CO<sub>2</sub>作为流动相, 超临界CO<sub>2</sub>固有的高扩散性和低粘度对分离产生巨大的影响。高扩散性减少了由流动相和固定相间的传质造成的色谱峰扩散。低粘度可实现最佳高流速而不产生明显的压降。况且, ACQUITY UPC<sup>2</sup>大大减小的系统体积使柱外的谱带展宽降至最小。

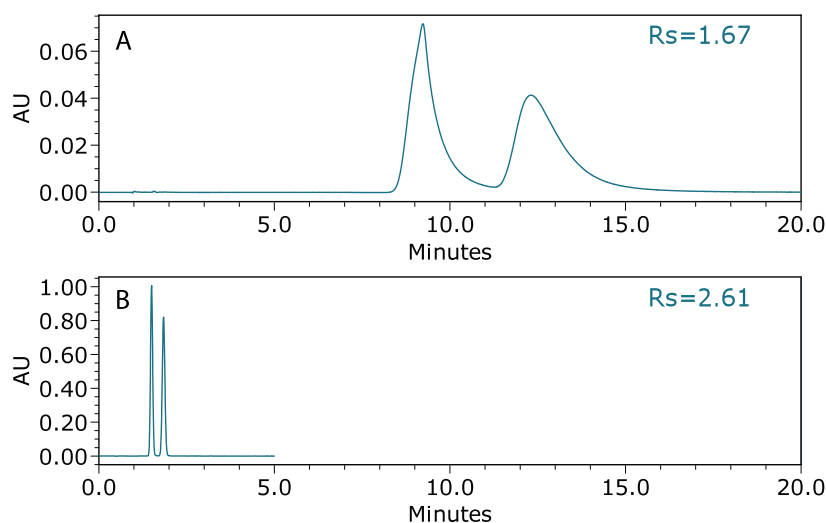


图2. 联二酚萘的正相HPLC色谱图(A)和UPC<sup>2</sup>的色谱图(B)。

## 总结

ACQUITY UPC<sup>2</sup>系统展示了使用UPC<sup>2</sup>在2min内实现联二酚萘对映体的成功分离。与正相HPLC相比, UPC<sup>2</sup>速度快了8倍, 且得到的色谱峰更高, 对称性更好。ACQUITY UPC<sup>2</sup>大大减小的系统体积使柱外的谱带展宽降至最小。速度上的改善以及使用相对廉价的甲醇代替了正己烷可大大节约每次分析的成本(正相HPLC的2.85美元/次分析对比UPC<sup>2</sup>的0.08美元/次分析)。沃特世ACQUITY UPC<sup>2</sup>是实验室常规分离对映体的理想之选。

# Waters

THE SCIENCE OF WHAT'S POSSIBLE.™

Waters 是沃特世公司的注册商标。ACQUITY UPC<sup>2</sup>, UPC<sup>2</sup>, UltraPerformance Convergence Chromatography, 和 The Science of What's Possible 是沃特世公司的商标。所有其他商标属于各自的所有者。

©2012 沃特世公司 中国印刷  
2012年3月 720004238ZH LL-PDF

沃特斯中国有限公司  
沃特世科技(上海)有限公司

北京: 010 - 5209 3866  
上海: 021 - 6156 2666  
广州: 020 - 2829 6555  
成都: 028 - 6554 5999  
香港: 852 - 2964 1800

免费售后服务热线: 800 (400) 820 2676  
www.waters.com

