



Fig 2 Triptolide in aqueous humor sample treated by triptolide(T<sub>10</sub>) ophthalmi solution

2.3 新西兰白兔眼内药代动力学模型拟合及参数计算 采用3P87软件包,对房水药物浓度(C)和时间(t)的数据(见Tab 1)进行拟合计算。结果为:  $T_{max}=0.85\text{ h}$ ;  $C_{max}=0.27\text{ mg}\cdot\text{L}^{-1}$ ;  $AUC=0.31\text{ mg}\cdot\text{h}\cdot\text{L}^{-1}$ ;  $CL/F_5=159.2\text{ ml}\cdot\text{h}^{-1}$ ;  $V/F_e=79.2\text{ ml}$ 。其拟合的动力学方程为  $C(t)=44.62\times\text{Dose}\times(e^{-2.01\times(t-0.43)}-e^{-2.80\times(t-0.43)})$ 。

### 3 讨论

雷公藤原产我国,产量大,价格便宜,具备较强的抗炎和免疫抑制功能,但全身应用对身体多器官、组织有不同程度的毒副作用,雷公藤内酯醇是TWHF的主要活性成分<sup>[2]</sup>。本研究首次应用高效液相色谱法,测定T<sub>10</sub>滴眼液50μl滴兔眼后不同时间点的房水中该药物的浓度,并根据这一药物一时间曲线计算出该滴眼液的药代动力学参数及方程。进一

步提供合理的给药方案。

Tab 1 Concentration changes with the time of triptolide in aqueous humor of rabbits after administration of the triptolide (T<sub>10</sub>) ophthalmic solution (n=4)

T/h	$\bar{x} \pm s$
0.5	0.108±0.0126
1	0.270±0.0245
2	0.055±0.0191
3	0.040±0.0082
4	< 0.03

从计算出的动力学参数可知,该滴眼液滴用后经0.43h的滞后期才进入房水,在房水中达到峰浓度0.27 mg·L<sup>-1</sup>的时间为0.85h,维持最低药物浓度的时间为4h(见药物一时间曲线),据此该药物的合理给药方案为:每天点6次,每次滴药量不少于50μl(即1~2滴)。这亦为今后改进该药物的研制提供方向,即延长该药物在房水中的最低浓度时间,以减少每天的用药次数。目前我们正在进行该药物稳定性方面的研究。

该药物经动物实验已证明能有效的防治角膜移植排斥反应,这不仅能消除雷公藤制剂全身应用所带来的毒副作用,还有潜在的抗眼前段免疫性疾病的功能。

### 参考文献

- Asano K, Yu Y, Kashara T *et al*. Inhibition of murine chronic graft versus-host disease by the chbroform extract of Tripterygium wilfordii Hook F. *Transpl Immunol*, 1997; 5: 315~9
- Mao YP, Tao XL, Lipsky PE. Analysis of the stability and degradation products of triptolide. *J Pharm Pharmacol*, 2000; 52: 3~12
- 丁伟,伍桂军,陈家祺 *et al*. 雷公藤甲素的毒理研究. *眼科研究*, 1999; 17: 343~5

## 《中国药理学通报》入选 2001 年度“CA 千种表”

根据美国化学会出版的《Chemical Abstracts Service Source Index Quarterly No 4》统计结果,2001年度我国(包括台湾地区)有78种科技期刊入选“CA千种表”。《中国药理学通报》位居其中,至此,本刊已连续7年入选“CA千种表”。现将入选期刊列出如下:

序号	CA 名次	刊名	序号	CA 名次	刊名	序号	CA 名次	刊名
1	141	高等学校化学学报	27	563	中国化学(英文版)	53	797	炼油设计
2	215	分析化学	28	593	无机材料学报	54	805	植物学报
3	275	化学学报	29	594	半导体学报	55	806	中国生物化学与分子生物学报
4	283	中国化学快报(英文版)	30	600	光学学报	56	809	腐蚀与防护
5	290	科学通报(英文版)	31	611	石油化工	57	810	广东微量元素科学
6	364	物理学报	32	616	分析试验室	58	811	硅酸盐学报
7	367	功能材料	33	621	高分子学报	59	812	化学试剂
8	370	高分子材料科学与工程	34	625	中草药	60	814	色谱
9	371	中国塑料	35	627	高能物理与核物理	61	822	药物分析杂志
10	374	材料保护	36	637	广西医科大学学报	62	855	食品工业科技
11	377	中国有色金属学报	37	664	中国药理学杂志	63	857	中国药学(英文版)
12	385	应用化学	38	674	中国医院药学杂志	64	871	材料科学与工艺
13	394	金属学报	39	693	中国化学会志(台北)	65	878	材料研究学报
14	419	精细化工	40	704	第三军医大学学报	66	881	环境科学学报
15	434	中国公共卫生	41	706	化工学报	67	882	湖南化工
16	436	食品科学	42	708	中国医药工业杂志	68	889	生物工程学报
17	440	理化检验(化学分册)	43	712	催化学报	69	911	分析测试学报
18	442	第四军医大学学报	44	714	化学通报	70	914	农药
19	458	光谱学与光谱分析	45	719	中国激光	71	919	农药学报
20	478	物理化学学报	46	723	有机化学	72	924	冶金分析
21	520	中国病理生理杂志	47	729	中国药理学通报	73	928	合成树脂与塑料
22	522	材料科学与技术学报(英文版)	48	736	石油炼制与化工	74	934	工业水处理
23	544	工程塑料应用	49	772	无机化学学报	75	936	生物化学与生物物理学报
24	547	矿物岩石地球化学通报	50	781	化学研究与应用	76	951	中国免疫学杂志
25	551	金属热处理	51	790	药学报	77	966	核技术
26	559	光谱实验室	52	793	化学世界	78	984	河南化工

(厦门大学化学化工学院 黄秀菁供稿)