

- 2002, **19**(7): 1061-1067.
- [25] Park KM, Lee MK, Hwang KJ, *et al.* Phospholipid-based microemulsions of flurbiprofen by the spontaneous emulsification process[ J] . *Int J pharm*, 1999, **183**: 145-154.
- [26] Lawrence MJ, Rees GD. Microemulsion-based media as novel drug delivery systems[ J] . *Advanced Drug Delivery reviews*, 2000 **45**: 89-121.
- [27] Gupta K, Madan S, Majumdar DK, *et al.* Ketorolac entrapped in polymeric micelles: preparation, characterization and ocular anti-inflammatory studies[ J] . *Int J Pharm*, 2001, **209**: 1-4.
- [28] Brunella C, Claudia C, Maria I, *et al.* Solubilization of tropicamide by hydroxypropyl- $\beta$ -cyclodextrin and water-soluble polymers: in vitro/ in vivo studies[ J] . *Int J Pharm*, 2001, **213**: 75-78.

## Advance on Modern Pharmaceutics

ZHOU Jian-Ping, TU Xi-De

*Department of Pharmaceutics, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009, China*

**【ABSTRACT】** AIM: The purpose is to introduce the advance on modern pharmaceutics. METHOD: The recent papers of research and development of pharmaceutics were analyzed, coordinated and summed up. RESULT: The advance on modern pharmaceutics were reviewed by class. CONCLUSION: A new date of pharmaceutics had landed. The novel preparations and technology of modern pharmaceutics are provided with expansive foreground.

**【KEY WORDS】** Modern pharmaceutics; Novel technology; Novel preparations; Novel dosage-form

°校园信息°

### 《药学有机化学》等 3 门课程被评为“2002 年度国家理科基地创建名牌课程项目”

“2002 年度国家理科基地创建名牌课程项目”评选日前在武汉举行, 我校姚文兵处长作为专家参加了此次评选工作。经过激烈的竞争, 我校陆涛副教授申报的《药学有机化学》、姚其正教授申报的《药物合成原理》和杨静化教授申报的《药学高等数学》等 3 门课程被批准为第四批建设的“创建名牌课程项目”, 其中《药学有机化学》被评为“优秀创建项目”。

### 我校部分国家和省部级科研项目申报工作圆满结束

2003 年度国家自然科学基金、江苏省部分科技计划和霍英东基金申报工作已经圆满结束。经过广大教师、科技处和各部门的共同努力, 今年我校共申报了国家自然科学基金 38 项, 其中杰出青年基金 4 项, 青年科学基金 2 项, 面上项目 32 项。江苏省自然科学基金 30 项, 江苏省“三药”攻关项目 4 项, 省国际合作项目 2 项。另外申报了 6 项霍英东基金。

异黄酮成分的研究[J]. 药学报(Acta Pharm Sin), 1986, 21 (1):125-130.

[3] Dhar KL, Kalla AK. A New isoflavone from *Iris germanica*[J]. Phy-

tochemistry, 1973, 12: 734-735

[4] Kiyoshi Tsukida, Kayoko Saiki, Masayoshi Ito. New Isoflavone glycosides from *Iris florentina*[J]. Phytochemistry, 1973, 12: 2318-2319.

## Studies on the Constituents of *Iris leptophylla*

LI Rong, QIN Min-Jian

Department of Natural Medicinal Resources, China Pharmaceutical University, Nanjing 210038, China

**【ABSTRACT】** AIM: To study the chemical constituents of *Iris leptophylla*. METHOD: Extracted with 80% alcohol, isolated by column chromatography on silica gel, purified by crystallization etc. RESULT: Eight compounds were isolated from *Iris leptophylla*, five of which are isoflavones. On the basis of the physical properties and spectral data, the structures were identified as irisflorentin(I), irilone(II), iridin(III), tectoridin(IV) and irilone-4'-glucoside(V) respectively. The others are daucosterol(VI),  $\beta$ -sitosterol(VII) and eighteen alkyl acid(VIII). CONCLUSION: All of these eight compounds were isolated from this plant for the first time.

**【KEY WORDS】** *Iris leptophylla*; Isoflavone; Irisflorentin; Irilone; Iridin; Tectoridin; Irilone-4'-glucoside; Daucosterol;  $\beta$ -sitosterol; Eighteen alkyl acid

**【FOUNDATION ITEM】** This project was supported by National Natural Science Foundation of China(No.30170103)

°校园信息°

### 吴晓明校长参加澳门科技大学校庆活动

应澳门科技大学校长邀请,吴晓明校长于3月25日赴澳门参加澳门科技大学建校3周年校庆活动,并就两校今后的交流与合作与澳门大学进行了会谈,两校将于近期签署科技合作协议书。在澳门期间,吴晓明校长等人还受到澳门特首何厚铨先生的亲切接见。

参加完校庆活动以后,吴晓明校长还访问了联邦制药有限公司,看望了目前在该公司工作的我校校友和毕业实习生,并与他们进行了座谈。

### 我校生命科学与技术人才培养基地开班

3月21日,2002级“生命科学与技术人才培养基地”开班仪式在燕子矶校区的水上报告厅隆重举行。校领导、老教授以及教务处、基础部的领导、教师与2002级60名入选“生命科学基地”的学生欢聚一堂。

王广基副校长到会并做了讲话,对入选“生命科学基地”的学生表示祝贺,勉励学生要戒骄戒躁,成为具有创新意识、创业胆识、建业本领的高级生物医药技术人才,并对基地班的教师、管理人员和学生提出了殷切希望。吴梧桐、华维一教授分别从基地建设宗旨、建功创业和树立自律自强、团队合作的品质等方面做了精彩的讲话。“生命科学基地”学生就学习、创业以及“基地”的管理和培养方案等同与会领导和专家进行了座谈。

势构象, 为合成更为有效的化合物提供思路。磺酰脲类药物的初始降糖作用是通过它与胰岛  $\beta$ -细胞膜上磺酰脲受体特异地互相作用, 刺激胰岛素释放而引起的, 但是长期用药后, 血中胰岛素浓度恢复到甚至低于给药前水平, 而降血糖作用依然存在。近年来大量研究表明, 磺酰脲类长期治疗的降血糖作用主要有胰外机制参与。此类药物主要用于 2 型轻、中型糖尿病患者。香豆素类对正常和四氧嘧啶糖尿病模型均有降血糖作用, 但机制还不清楚。香豆素磺酰脲类化合物是在香豆素母核上引入磺酰脲类结构, 实验显示其中大部分对正常小鼠具有降糖作用, 关于此类化合物对四氧嘧啶糖尿病模型动物是否有降血糖作用及其降血糖活性的机制还需要进一步研究。

#### 参考文献

[1] 申竹芳(Shen ZF), 陈起明(Chen QM), 刘海帆(Liu HF), 等. 黄

皮素香豆精的降血糖作用[J]. 药学报(Acta Pharm Sin), 1989; 24: 391-392.

[2] Shani J(MISHKINSKY), Goldschemed A, Joseph B et al. Hypoglycaemic effect of trigonella foenum graecum and lupinus temis(Leguminosae) seeds and their major alloxan-diabetic and normal rats. *Arch Int Pharmacodyn*, 1974, 210, 27-37.

[3] 韩莹(Han Y), 屠树滋(Tu SZ), 周卫芬(Zhou WF), 等. 香豆素磺酰脲类化合物的合成及其降血糖活性研究[J]. 中国药科大学学报(J China Pharm Univ), 2002 33(2): 93-97.

[4] 中华人民共和国卫生部医政司编. 全国临床检验操作规程. 南京: 东南大学出版社, 1991, 1.

[5] 李运曼(Li YM), 王秋娟(Wang QJ), 董德利(Dong DL), 等. 复方降糖口服液的药理研究[J]. 中国药科大学学报(J China Pharm Univ), 1995; 26: 41-43.

[6] 张惠斌(Zhang HB), 黄海燕(Huang HY), 黄文龙(Huang WL), 等. 磺酰脲类化合物的合成及降血糖活性[J]. 中国药科大学学报(J China Pharm Univ), 1999 30: 243-245.

[7] 孙瑞元主编. 定量药理学. 北京: 人民卫生出版社, 1987. 404-405.

## Hypoglycemic Effect of Coumarin-6-Sulfonylureas

ZHOU Wei-Fen, WANG Qiu-Juan, HAN Ying, TU Shu-Zi

Department of Physiology, China Pharmaceutical University, Nanjing 210009, China

**【ABSTRACT】** AIM: The purpose is to study the effect on serum glucose by giving different coumarin-6-sulfonylurea compounds. **METHOD:** Serum glucose of normal mice were determined after giving coumarin-6-sulfonylurea compounds (50 mg/kg, ig). **RESULT AND CONCLUSION:** Results showed that the drugs including SU-111, SU-118, SU-611, SU-614, SU-615 and SU-616 have the significant hypoglycemic activity on blood glucose level of normal mice. The structure-activity relationship were analyzed by utilize the pharmacodynamic parameters.

**【KEY WORDS】** Coumarin-6-sulfonylureas; Hypoglycemic activity; Structure-activity relationship

·校园信息·

## 中国药科大学被江苏省科技厅列为 4 家科技计划单列高校之一

我校在江苏省科技计划项目申报工作中一直比较规范, 得到了江苏省科技厅的高度信任和重视。从 2003 年起, 江苏省科技厅将我校和南京大学、东南大学、南京农业大学等 4 所部属高校以及省农科院、省植物所、军区总医院共 7 家重点实施单位施行计划单列, 赋予项目组织申报、实施管理的权限和责任, 每年由省科技厅直接对这些项目实施情况进行目标考核。今后中国药科大学申报省科技厅的科技计划项目将不再经过南京市科技局或江苏省教育厅的初筛和限项。

Twinlab E-200 capsules(硬胶囊)  
每片含: *d*- $\alpha$ -生育酚琥珀酸酯: 200 IU  
Vitamin E, *d*-Alpha Tocopheryl Succinate (硬胶囊)  
每片含: *d*- $\alpha$ -生育酚琥珀酸酯: 300 IU, 混合生育酚: 45 mg。  
Child Vitatim(片剂)  
用途: 儿童多维、矿物质和酶咀嚼片  
每片成份:  
视黄醇棕榈酸酯 1.1 mg(相当于 2000 IU 维生素 A)  
维生素 B<sub>1</sub>: 1.05 mg  
维生素 B<sub>2</sub>: 1.2 mg  
维生素 B<sub>3</sub>: 12 mg  
维生素 B<sub>5</sub>: 7.5 mg  
维生素 B<sub>6</sub>: 1.05 mg  
维生素 B<sub>12</sub>: 2.1 mg  
维生素 C: 60 mg  
维生素 D: 100 IU  
天然 *d*- $\alpha$ -生育酚琥珀酸酯: 12.4 mg(相当于 15 IU 维生素 E)  
磷酸氢钙: 43 mg(相当于 10 mg 钙)  
镁: 9 mg  
富尔马铁: 6.1 mg(相当于铁 2 mg)  
Clinical Nutrients<sup>TM</sup> for Women(片剂)  
每 3 片含:  
维生素 A: 17,500IU  
维生素 C: 300mg

维生素 D: 100IU  
维生素 E (*d*- $\alpha$ -生育酚琥珀酸酯): 200 IU  
维生素 K: 60 mg  
维生素 B<sub>1</sub>: 60 mg  
维生素 B<sub>2</sub>: 60 mg  
维生素 B<sub>6</sub>: 95 mg  
叶酸: 800 mg  
维生素 B<sub>12</sub>: 800 mg  
生物素: 600 mg  
4.2 在日本用维生素 E 琥珀酸钙制成片剂的品牌和生产厂家  
E. Rohaku 片剂 100 mg: 明治药品  
E-tap.S 片剂 100 mg: 医圣公司  
Tcocal 片剂 100 mg: 大兴  
Toocvela-S 片剂 100 mg: 大洋药品  
NichivitaE.S 片剂 100 mg: 日本医工  
Vitamin 片剂 50 mg: 东洋药品公司  
V.E. 片剂 100 mg: 东亚药品—纯药  
トコハフS 100 mg: 中野药品  
Juela S 100 mg: 日本卫材  
4.3 国内现状与前景  
维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙在欧美日等发达国家已应用数十年, 安全性非常高, 而在国内的应用则是空白。由浙江医药新昌制药厂生产的维生素 E 琥珀酸酯和琥珀酸钙, 质量等同于国外同类产品, 目前全部用于出口美国和日本等国家。新昌制药厂正致力于国内市场的开发, 多品种的维生素 E 可满足不同食品的加工需要。

。校园信息。

## 我校部署“十五”“211 工程”建设项目的细化论证工作

3 月中旬, 中国药科大学召开了有关部门和“211 工程”各子项目组负责人会议, 校长吴晓明主持了会议, 副校长潘裕坚出席了会议。学校就“十五”“211 工程”建设项目的细化论证工作和拟购仪器设备的细化论证工作进行了部署。目前, 各子项目组正根据教育部“211 工程”办公室要求, 进行细化论证工作。各子项目组瞄准国际前沿领域, 进一步凝炼学科方向, 科学定位建设目标, 制定建设措施, 论证拟购仪器设备, 做到建设任务落实, 人员落实, 经费落实, 规范管理。通过建设, 形成一批具有优势的研究领域, 形成一批创新团队, 形成一批有显示度的标志性成果, 形成一批高水平的科研基地。

## 国外的药物新剂型

✱ **瓦地那非口服制剂** 拜尔公司和葛兰素史克公司的治疗勃起功能障碍新药瓦地那非(Vardenafil)获准上市,商品名:Nuviva。因需补充临床药理学研究数据,故将推迟上市。

✱ **他达拉非口服制剂** 礼来-艾科思(Lilly Icos)公司的新5型磷酸二酯酶(PDE-5)抑制剂他达拉非(Tadalafil, IC351),治疗勃起功能障碍(ED),获欧盟CPMP批准上市,商品名:Cialis。

✱ **溴替唑仑口内崩解片** 日本勃林格殷格翰公司在日本上市了安眠药溴替唑仑(Brotizolam)0.25 mg口内崩解片,商品名:Lendormin。适用于治疗短期失眠者和麻醉前给药。该快速溶解制剂专为老人和吞咽困难的患者设计。

✱ **苯甲酸利扎曲普坦口内崩解片剂** 默沙东公司在英国上市了苯甲酸利扎曲普坦(Rizatriptan Benzoate)口内崩解片剂,商品名:Maxalt-MLT。本品用于治疗偏头痛。

✱ **地氯雷他定片剂剂** 先灵葆雅公司的无镇静作用抗组胺药地氯雷他定片剂(Desloratadine, 5mg), 2002年初上市,商品名:Clarinx。用于治疗成人和12岁以上儿童季节性过敏性鼻炎(SAR)。该药系1日1次无镇痛作用抗组胺药,可24小时解除SAR。

✱ **复方盐酸氨氯地平胶囊剂** 诺华公司上市了新剂量的复方盐酸氨氯地平胶囊剂,商品名:Lotrel。本品已成为美国增长最快的抗高血压药物之一。

✱ **左甲状腺素钠片剂** 首个采用Penwest Pharmaceuticals公司Prosolv技术制备的处方药左甲状腺素钠(Sodium Levothyroxine)片剂,获得美国FDA批准,用于治疗甲状腺功能减退和抑制甲状腺刺激激素。该产品由莫瓦制药公司开发,商品名:Levo-T。

✱ **草酸依西普兰片剂** 美国FDA批准了第2个采用Prosolv技术制备的处方药草酸依西普兰(Escitalopram Oxalate)片,商品名:Lexapro,用于治疗严重抑郁症。

✱ **利培酮口内分散片剂** 利培酮(Risperidone)口

服分散速溶新制剂,商品名:Risperdal Quicklet。在口腔内溶解快,为新一代抗精神病药。该药已在德国上市。

✱ **ProClude糊剂** ProClude糊剂是FDA首次批准的降低牙齿敏感性的牙科预防用药。适用于牙科清洁和磨光处理,还可用于脱敏、牙科术后和牙齿矫正。

✱ **复方盐酸利多卡因牙用凝胶剂** Rickitt Benckiser Healthcare公司在英国上市了复方盐酸利多卡因牙用凝胶剂,商品名:Bonjela Teething Gel。用于2个月以上婴幼儿长牙引起的疼痛和不适。

✱ **伊班膦酸即配型输液** 罗氏公司在英国上市了伊班膦酸(Ibandronic Acid)即配型输液(2 mg/2 ml),商品名:Bondronat。本品用于治疗肿瘤引起的高钙血症。

✱ **利培酮长效注射剂** 强生公司的非典型抗精神病药利培酮(Risperidone)长效注射剂获准在英国上市,商品名:Risperdal Consta,今后还将在德国上市。

✱ **复方马来酸罗格列酮/盐酸二甲双胍片剂** 美国FDA批准了葛兰素史克公司的复方马来酸罗格列酮(Rosiglitazone Maleate)片,商品名:Avandamet。用于治疗Ⅱ型糖尿病。有3种剂量规格,每片含:罗格列酮/盐酸二甲双胍1 mg/500 mg;2 mg/500 mg;4 mg/500 mg。

✱ **复方格列吡嗪/盐酸二甲双胍片剂** 美国FDA批准了百时美施贵宝公司的复方格列吡嗪(Glipizide)片剂,商品名:Metaglip。本品结合饮食和运动一线治疗不能单独以控制饮食和运动来控制血糖的Ⅱ型糖尿病。有3种剂量规格,每片含:格列吡嗪/盐酸二甲双胍2.5 mg/250 mg;2.5 mg/500 mg;5 mg/500 mg。

✱ **盐酸丁丙诺啡舌下片剂** FDA批准了Rickitt Benckiser公司的盐酸丁丙诺啡(Buprenorphine)舌下片剂,用于治疗阿片依赖性患者,商品名:Subutex。

✱ **复方盐酸丁丙诺啡/盐酸纳洛酮二水合物舌下片剂** FDA批准了Rickitt Benckiser公司的复方盐酸丁丙诺啡(Buprenorphine)舌下片剂,用于治疗阿片依赖性患者,商品名:Suboxone。有两种剂量规格,每片含:丁丙诺啡/纳洛酮游离碱基2 mg/0.5 mg;8 mg/2 mg。

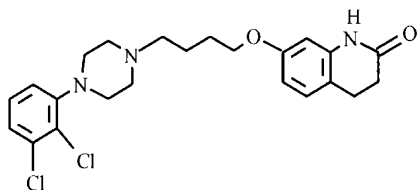
(译自Scrip)

# 2002 年世界上市的新药

2002 年有 30 种新化学物质或新生物制品上市, 和 2001 年(36 种)和 2000 年(43 种)相比, 这是最少的一年。默克公司率先上市了 3 个新药, 此外, 它还和先灵葆雅公司联合研制了胆固醇吸收抑制剂——ezetimibe。辉瑞公司和法玛西亚公司联合研制了 3 个新药。

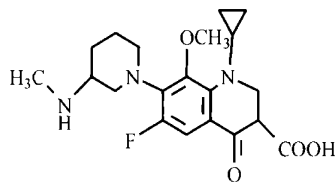
## Apripiprazole

化学式:  $C_{23}H_{27}Cl_2N_3O_2$   
 化学名: 7-[4-[4-(2, 3-Dichlorophenyl)-1-piperazinyl]butoxy]-3, 4-dihydro-2(1H)-quinolione  
 别名: OPC-14597, OPC-31  
 分子量: 448.39  
 类别: 抗精神病药; 选择性多巴胺  $D_2$ -受体拮抗剂  
 性状: 无色, 絮状晶体, mp 139.0 ~ 139.5℃  
 专利: US 5006528(1990, 1991, Otsuka 公司)  
 开发单位: 日本 Otsuka 公司  
 化学结构:



## Balofloxacin

化学式:  $C_{20}H_{24}FN_3O_4$   
 化学名: 1-Cyclopropyl-6-fluoro-1, 4-dihydro-8-methoxy-7-[3-(methylamino)-1-piperidinyl]-4-oxo-3-quinolinecarboxylic acid  
 别名: Q-35, Baloxin  
 分子量: 389.42  
 类别: 抗菌药, 喹诺酮类抗生素  
 性状: 无色针状, mp 134 ~ 135℃  
 专利: US 5051509(1989, 1991, Chugai 公司)  
 开发单位: 韩国 Choongwae 公司  
 化学结构:



## Ertapenem sodium

化学式:  $C_{22}H_{24}N_3NaO_7S$   
 分子量: 497.50  
 类别: 抗菌药  
 开发单位: 美国 Merck 公司

## Ibritumomab Tiuxetan

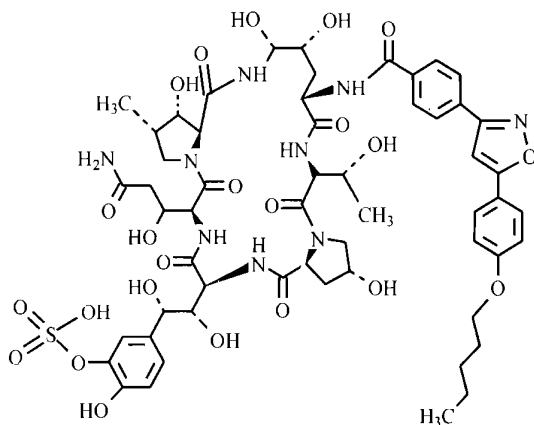
化学名: dimer *N*-[2-[bis(carboxymethyl)-amino]-3-(4-

isothiocyanatopheyl) propyl]-*N*-[2-[bis(carboxymethyl)-amino]propyl]glycine conjugate

类别: 抗肿瘤药  
 专利: US 5736137 (1994, 1998, IDEC 公司)  
 开发单位: 美国 Idex 公司

## Micafungin

化学式:  $C_{56}H_{71}N_9O_{23}S$   
 化学名: 1 - [(4*R*, 5*R*)-4, 5-Dihydroxy- $N^2$ -4-[5-[4-(pentyloxy)phenyl]3-isoxazolyl]benzoyl]-*L*-ornithine]-4-[(4*S*)-hydroxy-4-[4-hydroxy-3-(sulfoxy)phenyl]-*L*-threonine]-pneumocandin  
 分子量: 1270.29  
 类别: 抗真菌药  
 专利: US (1996, 2000 Fujisawa 公司)  
 开发单位: 日本 Fujisawa 公司  
 化学结构:



## Nitisinone

化学式:  $C_{14}H_{10}F_3NO_5$   
 化学名: 2-[2-Nitro-4-(trifluoromethyl)benzoyl]-1, 3-cyclohexanedione  
 别名: NTBC; Orfadin  
 分子量: 329.23  
 类别: 用于 I 型遗传性高酪氨酸血症的治疗。  
 性状: 固态, mp 88 ~ 94℃  
 专利: EP 186118(1986, Stauffer 公司); US 5006158(1991, ICI 公司)  
 开发单位: 美国 Swedish Orphan 公司  
 化学结构:

