

# 薬物代謝酵素阻害試験

被験物質が薬物代謝酵素に与える影響をヒト肝ミクロソームを用いた *in vitro* 系で評価します。  
 $IC_{50}$  および  $Ki$  値の算出や時間依存的阻害作用の評価を実施します。

## 酵素源

- ヒト肝ミクロソーム

## 測定方法

- LC/MS/MS

## 方法

- Direct inhibition (DI)
- Time-dependent inhibition (TDI)
  - 希釈法 非希釈法

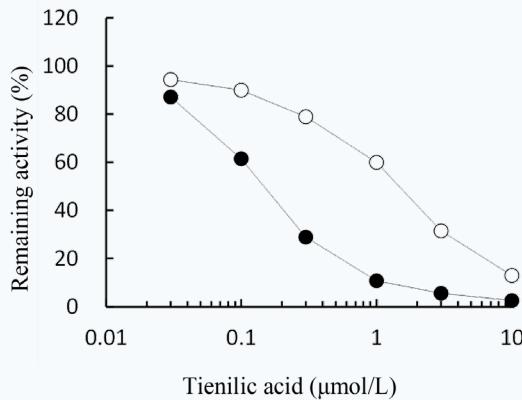
## 評価酵素

Enzyme	Isoform	Marker metabolic reaction
CYP	CYP1A2	Phenacetin O-deethylation
	CYP2B6	Bupropion hydroxylation
	CYP2C8	Paclitaxel 6 $\alpha$ -hydroxylation
	CYP2C9	Diclofenac 4'-hydroxylation
	CYP2C19	(S)-Mephenytoin 4'-hydroxylation
	CYP2D6	Bufuralol 1'-hydroxylation
	CYP3A	Midazolam 1'-hydroxylation Testosterone 6 $\beta$ -hydroxylation
UGT	UGT1A1	Estradiol 3 $\beta$ -glucuronidation
	UGT2B7	Zidovudine 5'-glucuronidation

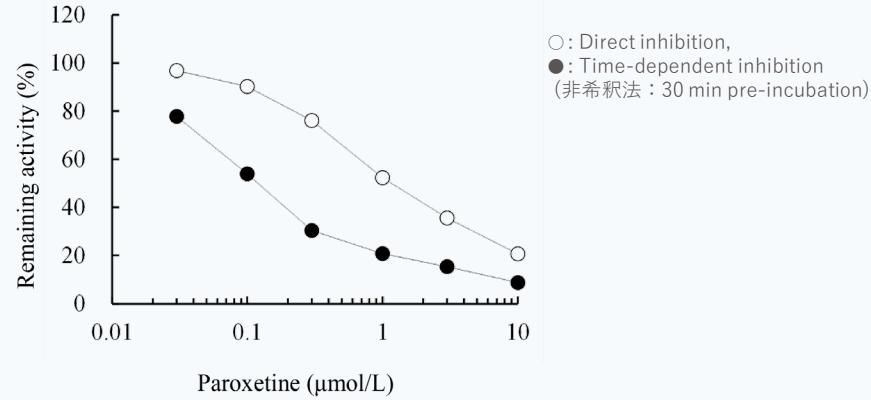
## 結果

### $IC_{50}$

- CYP2C9 (Diclofenac 4'-hydroxylation)

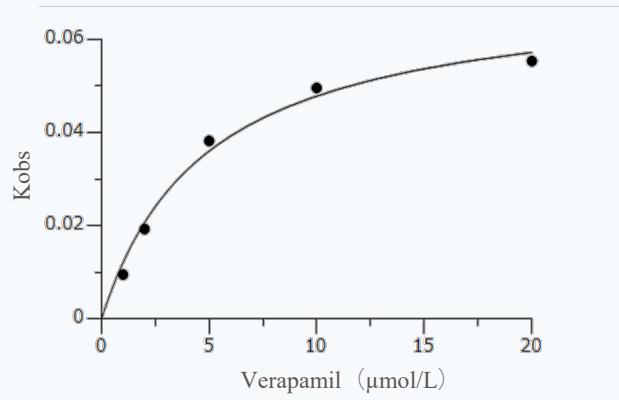
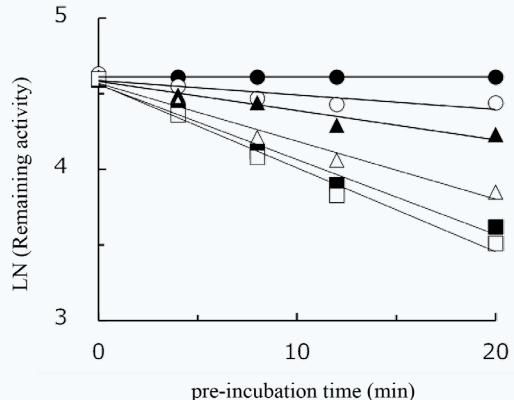


- CYP2D6 (Bufuralol 1'-hydroxylation)



### Inactivation parameters ( $Ki$ , $k_{inact}$ ) – TDI –

- CYP3A (Midazolam 1'-hydroxylation) vs Verapamil (希釈法)



お問い合わせ／資料請求はこちらまで

メディフォード株式会社 [www.mediford.com](http://www.mediford.com)

[東京] 〒174-0053 東京都板橋区清水町36番1号

非臨床事業部 tel. 03-6905-5861



「生きていく」を明るく、前向きにする。

 mediford  
A Member of PHC Group