

Герасимова К.В.

Влияние афобазола на функциональную активность P-450 CYP 3A4

Актуальность. Афобазол - это новый селективный анксиолитик, не относящийся к классу агонистов бензодиазепиновых рецепторов. Изучение метаболизма нового препарата является весьма актуальным вопросом, так как препарат применяется не только как монотерапия, но и в комплексе с другими препаратами.

Цель. Изучение изменения функциональной активности изофермента цитохрома P450 3A4 при применении в течение 14 дней 30 мг в сутки лекарственного средства Афобазол .

Материалы и методы. В исследование было включено 15 пациентов, в возрасте от 20 до 65 лет, прошедшие клинико-физиологическое обследование и отвечающие критериям включения и исключения. Для клинической оценки тревожного состояния была использована Шкала тревоги Гамильтона (HARS). Исследование длилось 14 дней, в течение которых пациенты принимали препарат Афобазол в дозе 30 мг в сутки. До начала и после курса терапии проводили MEGX-тест. Тестовое вещество MEGX-теста - раствор для инъекций лидокаина, разведенный в 5 мл физиологического раствора, вводили пациентам в виде болюсной внутривенной инъекции (в течение 1-2 минут) в дозе 1мг/кг. Перед введением лидокаина производились отборы крови из периферической вены в количестве 5-7 мл. На 30 минуте с момента инъекции выполнялись повторные отборы крови из вен, отличных от места введения лидокаина. Отборы крови осуществляли в 8-00 часов утра в сухие центрифужные пробирки. Спустя 40 минут пробы крови центрифугировали 10 минут при 3000 об./мин, сыворотку в объеме 1,5 мл переносили в пластиковые пробирки, замораживали и хранили при температуре не выше -20°C до проведения количественного анализа. Концентрацию метаболита лидокаина (MEGX) определяли методом ВЭЖХ. В анализе использовали обращеннофазную хроматографическую колонку C18 Ultrasphere Beckman (5 мкм, 4,6*250 мм). Предел детектирования 1,7 нг/мл.

Результаты. Изучена динамика концентрации MEGX до и после курсового перорального приема 30 мг Афобазола. Статистический анализ не выявил достоверного различия между средними значениями показателей концентраций. При оценке динамики состояния по шкале Гамильтона наблюдается редукция выраженности клинических симптомов тревоги.

Выводы. Применение лекарственного средства Афобазол в терапевтических дозировках (30 мг) на функциональную активность изофермента цитохрома P450 3A4 практически не оказывает влияния.