

Фармакокинетическое изучение анастрозола на животных

Эиса Задех Салар Фалахатий, Г.Д.Капанадзе

Московская медицинская академия им. И.М.Сеченова, Москва

Научный центр биомедицинских технологий РАМН, Московская область

Анастрозол – современный лекарственный препарат с противоопухолевой активностью в отношении эстраген-зависимых опухолей молочной железы у женщин в постменопаузе. После приема внутрь всасывается 83-85% принятой дозы, время достижения максимальной концентрации – 2 часа, связь с белками плазмы – 40%, равновесная концентрация в плазме достигается после 7 суток приема препарата. Метаболизм осуществляется в процессе N-деалкилирования, гидроксирования и конъюгации с глюкуроновой кислотой. Основной метаболит – триазол, определяемый в плазме и моче, не обладает аналогичной фармакологической активностью. Метаболиты выводятся преимущественно почками, менее 10% дозы выводится с мочой в неизмененном виде в течение 72 ч. Задачей нашего исследования было изучить фармакокинетические параметры анастрозола у мини-свиней после однократного перорального введения.

Материалы и методы

Динамику концентрации анастрозола изучали на 12 мини-свиньях светлогорской популяции (работа с животными проводилась в Научном центре биомедицинских технологий РАМН) после однократного перорального введения анастрозола в дозе 2 мг. Отбор крови осуществляли до и спустя 1, 1,5, 2, 3, 4, 6, 8, 10, 12, 24, 48 и 72 часа после введения

препарата. Концентрацию анастрозола в плазме крови животных определяли методом высокоэффективной жидкостной хроматографии. Фармакокинетические параметры рассчитывали модельно-независимым методом. Полученные экспериментальные данные были подвержены статистической обработке.

Результаты и их обсуждение

Пик концентрации анастрозола достигался в среднем через 2 часа после введения препарата и составлял 74,8±43,5 нг/мл. Следует отметить, что через 72 часа после приема препарата концентрация анастрозола во всех пробах была ниже предела определения.

Выводы

Изучена динамика концентрации анастрозола у мини-свиней после однократного перорального введения.