

## 药物研究

含Cremophor RH40的自微乳化给药系统对大鼠体内CYP3A酶的抑制作用\*

饶子超, 斯陆勤, 关延彬, 徐佳强, 李高

(华中科技大学同济医学院药学院药剂教研室, 武汉430030)

收稿日期 修回日期 网络版发布日期 接受日期

**摘要** [摘要] 目的考察包含表面活性剂Cremophor RH40的自微乳化给药系统(SMEDDS)对大鼠体内细胞色素P450 (CYP3A)活性的影响。方法以咪达唑仑(MDZ)为模型药物, 采用高效液相色谱(HPLC)法测定MDZ及其活性代谢物1'-羟基咪达唑仑在大鼠体内的血药浓度, 并计算其药动学参数, 考察MDZ自乳化微乳对大鼠体内CYP3A活性的影响, 同时采用蛋白免疫印迹法检测上述制剂对大鼠肠黏膜上CYP3A蛋白表达的影响。结果MDZ微乳的口服生物利用度为MDZ片的3.14倍, 且显著降低1'-羟基咪达唑仑与咪达唑仑血浆浓度-时间曲线下面积(AUC)<sub>0-∞</sub>的比值(由0.25减少到0.11, P<0.05); MDZ自微乳化制剂还可显著延长MDZ在体内的平均滞留时间(MRT)及半衰期(t<sub>1/2</sub>) [MRT由(0.63±0.13) h延长至(1.23±0.38) h; t<sub>1/2</sub>由(0.33±0.11) h延长至(0.65±0.25) h, P<0.05]; 相对于MDZ片, SMEDDS口服给药后, 肠道CYP3A的蛋白表达水平显著降低。结论含有Cremophor RH40的SMEDDS能抑制大鼠体内CYP3A的代谢, 从而提高CYP3A底物药物的口服生物利用度。

**关键词** [咪达唑仑](#); [细胞色素 P450 3A](#); [自微乳化给药系统](#); [蛋白免疫印迹法](#)

**分类号** [R971.3](#); [R965](#)

**DOI:** 10.3870/yydb.2010.12.001

对应的英文版文章:[2010-12-1535](#)

通讯作者:

## 扩展功能

本文信息

▶ [Supporting info](#)

▶ [PDF](#) (1288KB)

▶ [\[HTML全文\]](#) (OKB)

▶ [参考文献\[PDF\]](#)

▶ [参考文献](#)

服务与反馈

▶ [把本文推荐给朋友](#)

▶ [加入我的书架](#)

▶ [加入引用管理器](#)

▶ [引用本文](#)

▶ [Email Alert](#)

▶ [文章反馈](#)

▶ [浏览反馈信息](#)

相关信息

▶ 本刊中 包含“[咪达唑仑](#); [细胞色素 P450 3A](#); [自微乳化给药系统](#); [蛋白免疫印迹法](#)”的 相关文章

▶ 本文作者相关文章

- [饶子超](#)
- [斯陆勤](#)
- [关延彬](#)
- [徐佳强](#)
- [李高](#)