

代謝酵素誘導試験・阻害試験

薬物相互作用についての *in vitro* 評価系として、被験物質の各CYP分子種に対する誘導能や薬物代謝酵素に対する阻害能を評価いたします。

I

代謝酵素誘導試験

◆ 評価分子種: CYP1A2, CYP2B6, CYP3A4

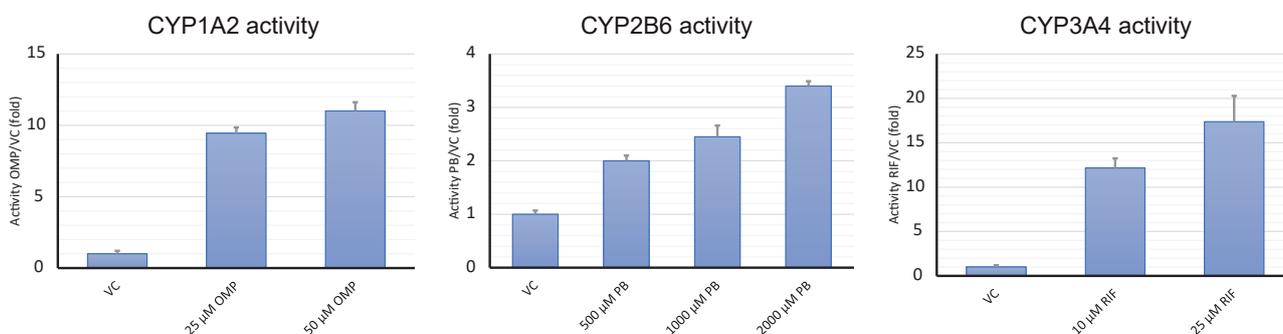
◆ 評価方法

- ヒト凍結肝細胞以外に、ヒト非凍結肝細胞にも対応いたします。
- mRNA発現量または酵素活性のいずれでも測定・評価を実施できます。

CYP2Cにつきましても
ご相談を承ります

◆ 評価項目

- CYP分子種の溶媒対照に対する誘導倍率(Fold Induction), % of positive control, Emax, EC₅₀の算出
- 肝細胞ロットのRIS(Relative inductive Score)の算出(CYP3A4, mRNA)



VC : vehicle control OMP:omeprazole PB:phenobarbital RIF:rifampicin

II

代謝酵素阻害試験

◆ 評価酵素: CYP1A2, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6, CYP2E1, CYP3A4/5

- バリデートされた測定条件にて評価いたします。

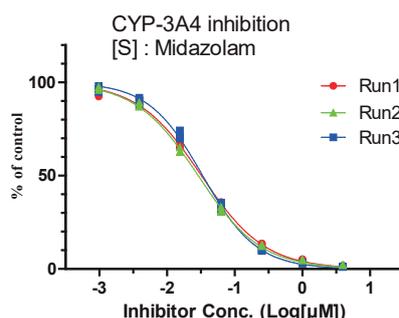
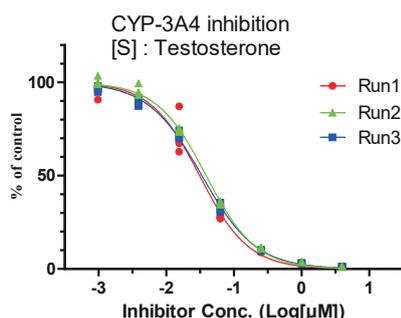
◆ 評価方法

- 基質代謝物の定量による代謝活性の測定

その他の分子種にも
対応いたします

◆ 評価項目

- 阻害効果の評価(残存活性, IC₅₀の算出)
- 阻害様式の評価(Pre-incubationによるMBIの検討, TDI 評価(IC₅₀シフト))
- ご希望の試験デザイン(時点, n 数)などで実施いたします。



Human Liver microsome:
0.2 mg-protein/mL,
Substrate: Testosterone, 50 μM
Midazolam, 8 μM
Incubation: 10 min (Testosterone)
5 min (Midazolam)
at 37 °C
Inhibitor: Ketoconazole