

Modificación del perfil enantiomérico del albendazol sulfóxido mediante el uso de inhibidores específicos de los complejos P450 y FMO

Beatriz Fuello Rodríguez

Facultad Farmacia.
b_fuello1990@hotmail.com

Francisco Bolás Fernández. Juan José García Rodríguez.

Facultad Farmacia.
jjgarc01@pdi.ucm.es francisb@farm.ucm.es

Resumen: El albendazol (ABZ) es un fármaco que una vez absorbido sufre efecto de primer paso hepático dando como resultado un metabolito activo (albendazol sulfóxido, ABZSO) al que se le atribuye la actividad terapéutica. La molécula de ABZSO presenta un centro de asimetría, lo que ha permitido identificar dos enantiómeros ABZSO (+) y ABZSO (-). En un segundo paso el albendazol sulfóxido es de nuevo oxidado dando lugar a una molécula inactiva denominada albendazol sulfona. En estos procesos intervienen dos complejos enzimáticos, la flavin monooxigenasa (FMO) y el citocromo P450; ambos cooperan en la primera oxidación, mientras que sólo el P450 generaría el metabolito inactivo. En esta segunda oxidación, aparentemente, albendazol sulfona se genera a expensas del enantiómero (-) ABZSO (Benoit et al., 1992). En el presente trabajo se han utilizado como inhibidores del sistema FMO y del citocromo P450, el metimazol (MTZ) y la metirapona (MTP), respectivamente, a fin de conocer su implicación en el metabolismo del fármaco. En todos los casos la inhibición enzimática supuso un incremento en la concentración plasmática (AUC) del metabolito activo (ABZSO) (25 - 110%), mientras que la distribución de los enantiómeros mostró una escasa variación mediante el uso de la metirapona, siendo acusada con el uso del metimazol, impidiendo éste la seroconversión de la molécula. Estos resultados sugieren que los inhibidores actúan de manera enantioselectiva en el metabolismo del albendazol.

[Póster](#)

Recibido: 11 marzo 2012.
Aceptado: 13 abril 2012.