

[Drug Metab. Dispos., 12, 795 (1984)]

Metabolism of Suprofen in the Dog

YOSHIYUKI SAKAI*, YUKIO MORI, KAZUMI TOYOSHI,
MASANOBU HORIE**, SHIGEO BABA**

イヌにおけるスプロフェンの代謝

酒井淑行*, 森 幸雄, 豊吉一美, 堀江正信**, 馬場茂雄**

RS-2-(4-(2-Thienylcarbonyl)phenyl)propionic acid (suprofen, S) の代謝を雄性ビーグル犬において検討した。 ^{14}C -S を 10mg/kg の用量で経口投与すると、 ^{14}C の血中濃度は 2 時間後に最高値 5.56 $\mu\text{g}\cdot\text{eq}/\text{ml}$ に達した。血漿中の ^{14}C の大部分 (86%) は、未変化体 S であった。投与した ^{14}C の大部分は、24 時間以内に、48% が尿中に、47% が糞中に排泄された。Radio-TLC と radio-HPLC による尿の分析の結果、排泄放射活性の以下の%が 24 時間尿について認められた: S, 約 4%; S の抱合体, 4%; 2-(4-(2-thienylhydroxymethyl)phenyl)propionic acid (S-OH), 35%; S-OH の抱合体, 2%; S のタウリン抱合体, 10%; S-OH のタウリン抱合体, 26%; 未知代謝産物, 18%。タウリン抱合体は、非ステロイド性抗炎症剤の代謝において知られているが、マウスとラットの尿中には S の代謝産物としては検出されていない。したがって、本報告は、タウリン抱合体がイヌの尿中において S の主要代謝産物であることを示した最初の例である。

* 大洋薬品工業㈱ ** 東京薬科大学

[Chem. Pharm. Bull., 32, 1106 (1984)]

Absorption, Distribution, and Excretion of Suprofen in Mice of Both Sexes

YUKIO MORI, FUSAYUKI YOKOYA*, YOSHIYUKI SAKAI*,
KAZUMI TOYOSHI, SHIGEO BABA**

雌雄マウスにおけるスプロフェンの吸収, 分布および排泄

森 幸雄, 横家房志*, 酒井淑行*, 豊吉一美, 馬場茂雄**

RS-2-(4-(2-Thienylcarbonyl)propionic acid (suprofen, S) の雌雄マウスにおける体内動態と代謝を検討した。 ^3H -S の 2mg/kg を経口投与するとその放射活性の吸収, 分布及び排泄は、雌雄マウスにおいて同様のパターンを示した。S は雌雄マウスにおいて速やかに吸収され、2mg/kg の ^3H -S を 1 回経口投与した時の血中濃度は、7.5 分以内に最高値に達した。血中放射能の大部分は、未変化体 S によって説明された。 ^3H -S の血中からの消失も速く、24 時間以内に放射活性の大部分は尿中にそして一部は糞中に排泄された。血漿レベルと同等かそれ以上の濃度が認められた臓器は代謝と排泄に関与する臓器 (肝と腎) であった。胃を除くその他の臓器レベルは、非常に低く、そしてどの組織においても蓄積は認められなかった。雄性マウスの尿からは S, 2-(4-thienylhydroxymethyl)phenyl-propionic acid, 2-(4-carboxyphenyl)propionic acid が検出された。

* 大洋薬品工業㈱ ** 東京薬科大学