

〔RADIOISOTOPES, 32, 416 (1983)〕

Absorption and Excretion of Suprofen in Both Sexes of Rats, Guinea-Pigs, and Rabbits

YUKIO MORI, FUSAYUKI YOKOYA*, YOSHIYUKI SAKAI*

KAZUMI TOYOSHI, TAKASHI FURUTA**, SHIGEO BABA**

雌雄ラット, モルモットおよび家兎におけるスプロフェンの吸収と排泄

森 幸雄, 横家房志*, 酒井淑行*, 豊吉一美, 古田 隆**, 馬場茂雄**

DL-2-(4-(2-Thienylcarbonyl)phenyl)propionic acid (スプロフェン) の吸収と排泄を雌雄ラット, モルモット, および家兎について検討した。スプロフェンに経口投与すると, 雌雄いずれの動物においても速やかに吸収された。 ^3H -スプロフェンを 2 mg/kg の用量で投与した時の血中濃度は, 全ての動物において 15 分以内に最高値に達した。また, 血中からのその ^3H の消失も速やかであり, その放射能は投与後 24 時間以内に尿および糞中に大部分が排泄された。スプロフェン経口投与後の動物モデルにおける抗炎症作用の消失は, ケトプロフェンおよびインドメタシンのそれに比べて速やかであることが報告されている。本研究から, 3 種動物の尿および糞へのスプロフェンの排泄は, ケトプロフェンおよびインドメタシンのそれと比較すると速やかであることが判明した。従って, スプロフェンのこの薬理効果の持続性の短いことは, 一つにはスプロフェンおよびその代謝産物の排泄が速やかであることに起因していると考えられる。

* 大洋薬品工業(株), ** 東京薬科大学

〔Drug Metab. Dispos., 11, 387 (1983)〕

Absorption and Excretion of Suprofen in Rats

YUKIO MORI, FUSAYUKI YOKOYA*, KAZUMI TOYOSHI,

SHIGEO BABA** YOSHIYUKI SAKAI*

ラットにおけるスプロフェンの吸収と排泄

森 幸雄, 横家房志*, 豊吉一美, 馬場茂雄**, 酒井淑行*

DL-2-(4-(2-Thienylcarbonyl)phenyl)propionic acid (suprofen, S) はラットに経口投与すると速やかに吸収された。 ^3H -S を $2, 10, 50,$ または 100 mg/kg の用量で経口投与した時の血中レベルは 30 分以内に最高値に達し, 用量依存性であった。その薬物の主要吸収部位は小腸上部であり, 一部は胃からも吸収された。ラット血漿中の放射能はほとんどが血漿タンパクと結合していた。S とその代謝産物の血液からの消失は速やかであり, ^3H -S 経口投与後 24 時間以内にその ^3H のほとんどが尿と糞に排泄された。 ^{14}C -S 投与後の呼気中への $^{14}\text{CO}_2$ の排泄は全く認められなかった。ラットの尿にはラット血漿中に検出された S と 4 代謝産物が認められ, それらで尿中放射能の約 60% が説明された。胆管カニューレーションしたラットに 2 mg/kg の用量で ^3H -S を経口投与すると, その用量の 41% が 48 時間の胆汁に排泄され, 更に腸管循環も顕著に認められた。 ^3H -S をラットに単回投与した時と 21 日連続投与した時を比較すると, 連続投与後の血中レベルは単回投与後のそれらに比べ高かったが, ^3H -S の排泄には大きな相異は認められなかった。このことから, S は体内において蓄積性のないことが判明した。

* 大洋薬品工業(株), ** 東京薬科大学