

アミノピリンの水酸化：ラットにおける 3位水酸化体の代謝生成に関する研究

井口 定男, 田中 哲郎, 金尾 義治, 五郎丸 毅*

Journal of Pharmacobio-Dynamics, 7 (9), 702–705 (1984)

Biohydroxylation of Aminopyrine: Quantitative Studies of 3-Hydroxymethyl Metabolite in Rats

Sadao IGUCHI, Tetsuro TANAKA, Yoshiharu KANEO,
and Tsuyoshi GOROMARU*

ABSTRACT Significance of the formation of 4-dimethyl-amino-3-hydroxymethyl-2-methyl-1-phenyl-3-pyrazolin-5-one (AM-3-CH₂OH) for the metabolism of aminopyrine (AM) was examined quantitatively in rats. Although urinary excretion of AM-3-CH₂OH accounted for only 0.7% to the dose, incubation of AM in the isolated hepatocyte system resulted in the formation of 9% of AM-3-CH₂OH. Furthermore, metabolic disappearance of AM-3-CH₂OH in the same system was fast, indicating the properties of an intermediate metabolite. These results suggested that the metabolic pathways *via* AM-3-CH₂OH are very important in the metabolism of aminopyrine.

抄録 アミノピリン代謝における3位水酸化体4-dimethylamino-3-hydroxymethyl-2-methyl-1-phenyl-3-pyrazolin-5-one (AM-3-CH₂OH)の意義について検討した。AM-3-CH₂OHはアミノピリン投与後尿中には投与量の僅か0.7%しか排泄されない。ところが遊離肝細胞系を用いたマスバランス実験ではその生成は全体の9%にも上った。遊離肝細胞系において、AM-3-CH₂OHはさらに代謝されて消失する。このことよりアミノピリンの代謝において3位の水酸化体を経由するものは少なく、AM-3-CH₂OHは中間代謝物として極めて重要なものであることが明らかとなった。

* Faculty of Pharmaceutical Sciences, Tokushima University 徳島大学薬学部