

キシラジンの代謝について

【ラット】

- ・ラットの肝ミクロソームによる *in vitro* 代謝物は A~D。[B 社資料, 1992 年]
- ・ラットの経口投与では、投与後 24 時間尿に 68.3~78.4 %排泄された。尿中代謝物は E~I (牛で見られたものと同じ)。[B 社資料, 1998 年]
- ・ラットを用いたキシラジンの単回強制経口投与試験において、血漿中キシラジン及び 2,6-キシリジン濃度を測定しているが、投与 3 及び 6 時間後の血漿から 2,6-キシリジンが検出 (0.04 及び 0.03 µg/mL) された。(薬物動態試験として行われた試験ではないことに注意。) [B 参考資料(公表文献), 2000 年]
- ・ラットを用いたキシラジンの 4 週間混餌投与毒性試験において、血漿中キシラジン及び 2,6-キシリジン濃度を測定しているが、投与群からは 2,6-キシリジンは検出限界 (0.02 µg/mL) 未満であった。(薬物動態試験として行われた試験ではないことに注意。) [B 参考資料(公表文献), 2000 年]
- ・ラットを用いたキシラジンの 52 週間混餌投与毒性試験において、血漿中キシラジン及び 2,6-キシリジン濃度を測定しているが、DHPN+キシラジン投与群の 2/20 例に検出限界 (0.02 µg/mL) 以上の 2,6-キシリジンが検出されている。(薬物動態試験として行われた試験ではないことに注意。) [B 参考資料(公表文献), 1999 年]

【牛】

- ・牛の筋肉内投与では、尿中に 2,6-キシリジンが排泄された。[B 社資料, 1973 年]
- ・牛の筋肉内投与では、投与後 24 時間尿に 85 %TAR 排泄された。尿中代謝物は E~I。未変化体キシラジン、2,6-キシリジンは尿中に存在しなかった。組織中代謝物パターンは尿中と同様であった。[B 社資料, 1998 年]
- ・牛の筋肉内投与では、乳汁中代謝物は E、G 及び H。未変化体キシラジンが投与日の午後の乳汁中でみられた (高泌乳牛群及び低泌乳牛群でそれぞれ 0.0095 及び 0.0183 µg eq/mL)。[B 社資料, 2001 年]

【馬】

- ・馬の投与 (投与経路不明) では、尿中代謝物は A 及び B。代謝経路はラット (*in vitro*) と定性的に同じ。[B 社資料, 1992 年]
- ・馬の静脈内投与では、尿中にキシラジンが 0.5~1.5 µg/mL。尿中代謝物 K が最も長く検出された。2,6-キシリジンも検出された。[公表文献, 2004 年]