

標 題 : Pharmacokinetics and Metabolism of Hydroxytyrosol,
a Natural Antioxidant from Olive Oil
オリーブ油由来の天然抗酸化物質、ヒドロキシチロソールの薬物動態および代謝

著 者 : S. D'Angelo, et al. (イタリア ナポリ第二大学 医学部 生化学科)

掲 載 誌 : Drug Metabolism and Disposition. 29: 1492-1498 (2001)

要 旨 : 3,4-ジヒドロキシフェニルエタノール(DOPET)は、エクストラバージンオリーブ油中に遊離またはエステル型で検出可能な主要な *o*-フェノールである。
主としてその抗酸化特性と関連する生物学的作用にもかかわらず、その毒性および代謝に関して今までのところ少ないデータしか報告されていない。
DOPET の毒性を評価することおよび ¹⁴C ラベル化ジフェノールを用いてその分子の薬物動態を研究することが、本研究の目的である。
ラットに経口投与するときに、その分子は 2g/kg 体重まで感知できる毒性を示さない。

その代謝物を確認して定量するために、[¹⁴C]を合成してラットに静脈注射した。薬物動態解析で、調べた臓器および組織によるその分子の速やかで大きな取込みが示され、優先的な腎臓の取込みをとまなう。

その上、投与した放射能の 90%は注射後 5 時間までに集めた尿に排泄され、そして約 5%は糞および胃腸の内容物に検出可能である。

臓器および尿から抽出したラベル化代謝物の特性解析を、高圧液体クロマトグラフィー(HPLC)分析で実施した。

調べた全ての臓器で、DOPET は酸化および/またはメチル化した誘導体 4 種類に酵素的に変換する。

その上、総放射能のかなりの割合は硫酸抱合型と結合しており、それはまた主な尿排泄物を示している。

報告された結果に基づいて、カテコール-O-メチルトランスフェラーゼ、アルコールデヒドロゲナーゼ、アルデヒドデヒドロゲナーゼ、およびフェノールスルフトランスフェラーゼの関与をほのめかす、体外から投与された DOPET の細胞内代謝経路が提案される。
