

Table 5. Re-uptake inhibition and release acceleration of monoamines, and GTPγS binding by various psychoactive drugs¹³⁻¹⁵⁾

Drugs	Re-uptake (IC ₅₀ , M) ^{a)}			Release (EC ₅₀ , M) ^{b)}			G-Protein Binding	
	DA	5-HT	NE	DA	5-HT	NE	EC ₅₀ (M)	% of 5-HT maxima ^{c)}
Phenethylamines								
MDMA	1.4 x 10 ⁻⁶	7.2 x 10 ⁻⁷	6.6 x 10 ⁻⁷	2.0 x 10 ⁻⁷	5.8 x 10 ⁻⁸	8.6 x 10 ⁻⁸	n.e. ^{d)}	- ^{e)}
Methylone	2.9 x 10 ⁻⁶	2.3 x 10 ⁻⁶	7.4 x 10 ⁻⁷	3.8 x 10 ⁻⁷	2.2 x 10 ⁻⁷	9.3 x 10 ⁻⁸	n.e.	-
BDB	7.9 x 10 ⁻⁶	1.6 x 10 ⁻⁶	2.8 x 10 ⁻⁶	2.3 x 10 ⁻⁶	1.8 x 10 ⁻⁷	5.4 x 10 ⁻⁷	n.e.	-
MBDB	6.3 x 10 ⁻⁶	1.8 x 10 ⁻⁶	2.7 x 10 ⁻⁶	n.e.	5.4 x 10 ⁻⁷	3.3 x 10 ⁻⁶	n.e.	-
MDPV	4.3 x 10 ⁻⁸	1.6 x 10 ⁻⁵	1.7 x 10 ⁻⁸	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	-
2C-I	n.e.	7.9 x 10 ⁻⁵	3.7 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	n.e.	n.d. ^{f)}	46
2C-E	n.e.	7.2 x 10 ⁻⁵	8.9 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	n.e.	n.d.	29
2C-C	n.e.	3.1 x 10 ⁻⁵	6.3 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	1.0 x 10 ⁻⁴	n.d.	77
TMA	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	1.6 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	-
TMA-2	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	-
TMA-6	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	-
PMMA	1.4 x 10 ⁻⁵	4.7 x 10 ⁻⁷	2.2 x 10 ⁻⁶	1.6 x 10 ⁻⁶	4.8 x 10 ⁻⁸	9.4 x 10 ⁻⁷	n.e.	-
4FMP	7.7 x 10 ⁻⁷	6.8 x 10 ⁻⁶	4.2 x 10 ⁻⁷	2.0 x 10 ⁻⁷	7.3 x 10 ⁻⁷	3.7 x 10 ⁻⁸	n.e.	-
Tryptamines								
AMT	7.3 x 10 ⁻⁷	3.8 x 10 ⁻⁷	4.0 x 10 ⁻⁷	1.8 x 10 ⁻⁷	6.8 x 10 ⁻⁸	7.9 x 10 ⁻⁸	n.d.	39
5-MeO-AMT	1.8 x 10 ⁻⁵	2.9 x 10 ⁻⁶	3.7 x 10 ⁻⁵	1.5 x 10 ⁻⁶	4.6 x 10 ⁻⁷	8.9 x 10 ⁻⁶	n.d.	67
DPT	2.3 x 10 ⁻⁵	2.9 x 10 ⁻⁶	9.1 x 10 ⁻⁶	n.e.	n.e.	n.e.	n.d.	46
5-MeO-DIPT	6.5 x 10 ⁻⁵	2.2 x 10 ⁻⁶	8.2 x 10 ⁻⁶	n.e.	n.e.	n.e.	2.5 x 10 ⁻⁶	49
5-MeO-MIPT	n.e.	6.4 x 10 ⁻⁶	2.6 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	n.e.	n.d.	68
5-MeO-DMT	n.e.	4.1 x 10 ⁻⁶	3.3 x 10 ⁻⁵	n.e.	n.e.	n.e.	3.8 x 10 ⁻⁷	115
5-MeO-DALT	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	6.6 x 10 ⁻⁷	76
Pyperazines								
BZP	1.9 x 10 ⁻⁶	2.0 x 10 ⁻⁵	6.2 x 10 ⁻⁷	6.0 x 10 ⁻⁷	n.e.	6.8 x 10 ⁻⁸	n.e.	-
3CPP	1.2 x 10 ⁻⁵	3.3 x 10 ⁻⁷	2.5 x 10 ⁻⁶	6.3 x 10 ⁻⁵	2.8 x 10 ⁻⁸	1.4 x 10 ⁻⁶	9.3 x 10 ⁻⁷	37
4MPP	4.8 x 10 ⁻⁵	4.6 x 10 ⁻⁶	6.2 x 10 ⁻⁶	1.1 x 10 ⁻⁵	3.2 x 10 ⁻⁶	1.5 x 10 ⁻⁶	n.d.	17
Positive controls								
Cocaine	8.5 x 10 ⁻⁷	2.1 x 10 ⁻⁶	3.4 x 10 ⁻⁷	n.e.	n.e.	n.e.	n.e.	-
MAP	3.7 x 10 ⁻⁷	4.0 x 10 ⁻⁶	2.0 x 10 ⁻⁷	2.8 x 10 ⁻⁸	7.9 x 10 ⁻⁷	1.1 x 10 ⁻⁸	n.e.	-
DA	-	-	-	-	-	-	n.d.	68
5-HT	-	-	-	-	-	-	4.9 x 10 ⁻⁸	100
NE	-	-	-	-	-	-	3.0 x 10 ⁻⁶	110

a) Drug concentrations giving half-maximal inhibition. b) Drug concentrations giving half-maximal acceleration.

c) The maximal % increase in [³⁵S]GTPγS binding over basal binding is expressed as a percentage of the maximal 5-HT response, which is set to 100 %. d) No effect at 10⁻⁴ M of each drug. e) Not calculated.f) EC₅₀ value not determined because binding was not maximum at 10⁻⁴ M.

DA: Dopamine, 5-HT: Serotonin, NE: Norepinephrine.

MBDB・MDPV・4FMPは、cocaineや同系に属するMAPに匹敵するほど作用が強かった。しかし、PMMAはDAに対する作用のみがMAPのそれより減少し、2C-I・2C-E・2C-CはまずDAへの作用が消失し5-HT・NEに対する作用も弱くなった。さらにTMA・TMA-2・TMA-6には、再取り込み阻害作用を認めなかった。

トリプタミン系では、AMTの作用が最も強く、特に5-HT

に対する作用がcocaineとMAPより強く、DAとNEに対して同程度であった。また、トリプタミン骨格の側鎖が

5-MeO-AMT・DPT・5-MeO-DIPTのように嵩高くなるに従って、DAへの作用が徐々に消失し、5-HT・NEへの作用も弱くなり、5MeO-DALTでは再取り込み阻害作用が消失した。

ピペラジン系の3種類のドラッグの作用は強く、cocaineやMAPと較べると、DAへの作用が弱い、3CPPのように