

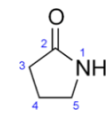


頭の良くなる薬 (nootropic) , スマートドラッグ

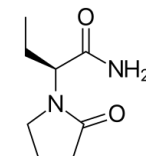
ピラセタム (nootropil) とイーケプラ

<https://l-hospitalier.github.io>

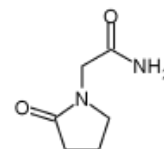
2020.7



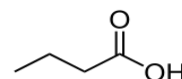
ピロリドン



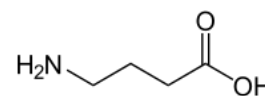
レベチラセタム
(イーケプラ)



ピラセタム
(ヌートロピル)



酪酸
butyric acid



γ-アミノ酪酸 GABA.
γ-Amino Bbutyric Acid

感染対策の基礎知識

#248

【UCB と Dr Giurgea】レベチラセタム (イーケプラ) は抗てんかん薬で L-エナンチオマー (左旋性光学異性体)。生理活性を持つのは L-異性体のみでラセミ体 (左右異性体の混合物) はエチラセタム。抗てんかん作用の機序は不明。ベルギーの UCB (union chimique belge) が開発した頭の良くなる薬 **ピラセタム** の誘導体。UCB はベルギーのエマニュエル・ヤンセンが設立、向精神薬のポール・ヤンセンのヤンセンファーマチカ (現在はジョンソン&ジョンソンの一員) とは別。UCB は抗ヒスタミン剤 Atarax を開発、1964 年に UCB の Corneliu E. Giurgea 博士は精神機能を強化する物質 **ピラセタム** (ヌートロピル) を合成。ヌートロピック (nootropic) というのは知性を向上させる **向知性薬** という意味で Giurgea 博士の造語 (1975 年)。ピラセタムはヌートロピル名で 1970 年に UCB が参入して以来、ヨーロッパにおける重要な製品 (アニラセタム、オキシラセタムはより強力だが FDA 不認可)。英では処方箋なしに購入でき、米では栄養補助食品として販売 (Goodman & Gilman 12 版には非収載)。米の学生の間では知的能力を高める薬として有名でしばしばバルクで粉末を購入、ジュースで飲む。化学名 2-オキシ-ピロリドン。抗血小板作用や血液抗凝固作用もあるとされ酪酸 (ブタン酸、butyric acid) の一種で GABA (γ-アミノ酪酸) の誘導体。酪酸の COOH と同じ炭素 (1 位) に NH₂ が付くのが α アミノ酸、一番遠い γ 位 (4 番目) にアミノ基が付くのが **γ アミノ酪酸 (GABA)** で (右図) で哺乳類の主要な抑制性神経伝達物質。ピラセタムは GABA の環状誘導体で、神経伝達に関与すると予想される。ベンゾジアゼピンは GABA 受容体に結合、受容体共役の Cl⁻ チャンネルを活性化。ピラセタムが脳の一部の血流量と酸素消費を増すことはわかっているが、記憶や認知機能を向上させる作用機序は不明。一般に **酸性アミノ酸** の **グルタミン酸** と **アスパラギン酸** は **興奮性** に、**中性アミノ酸** の GABA と **グリシン** は **抑制性** に作用*1。アミン類は 1. **カテコールアミン** は **チロシン** から、インドールアミンの 2. **セロトニン** は **トリプトファン** から、3. **ヒスタミン** は **ヒスチジン** から合成される。ピラセタムはムスカリン性アセチルコリン受容体や NMDA グルタミン酸受容体 (n メチル d アスパラギン酸-グルタミン酸受容体) に作用するといわれ、腎排泄。**【スマートドラッグ】** は英語圏ではヌートロピックや (コグニティブ/インテリジェンス/メモリー/ニューロ) エンハンサーと同義に使用。人間の脳の機能や能力、認知能力、記憶力を高める薬品をいう。

- A 神経伝達物質を調節する薬物** ① **コリン作動性**: コリン、レシチン、ピラセタム、コリンエステラーゼ阻害、パントテン酸 (VB₅) ② **ドパミン作動性**: L-DOPA、フェニラルアニン、チロシン ③ **セロトニン作動性**: トリプトファン*1、5-ハイドロオキシトリプトファン ④ **ヒスタミン作動性**: ベタヒスチン (メリスロン) 他
- B 抗鬱剤、精神安定** セレギリン、セントジョンズワート、**GABA**、バゾプレッシン 他
- C 脳の栄養、酸素供給を増加** ユビキノン (CoQ10)、イノシトール、ピラセタム 他
- D 中枢神経刺激薬** カフェイン、ニセルゴリン、ニコチン、メチルフェニデート (リタリン)、コカイン、アンフェタミン 他
- E 神経の成長促進、細胞保護** ヒデルギン、イノシトール 他
- F 麻薬** アンフェタミン、大麻、LSD、メスカリン、セレギリン 他
- G その他** ガランタミン、フェニトイン、オندانセトロン 他

がある。2017 年 6 月厚労省は「医師の指導がないと乱用や健康被害につながる」として医師の **処方箋が無ければスマートドラッグの個人輸入を原則認めない** (しかしサプリをやるのは普通でない医師)。サプリメント (栄養食品) についても厚労省は **オキシエートプロ、アガリスク、白いんげん豆、ウコン、クロレラ、プロポリス、にがり、コンフリー、カヴァ、アマメシバ、イチョウの葉エキス、メリロート (セイヨウエビラハギ)** などによる健康被害について注意を喚起。(CoQ10 にも好酸球増加あり)

*1 DE Golan 「臨床薬理学」 p82-3 *2 米国人はサプリ好き。トリプトファン事件は 1988-9 年昭和電工の遺伝子組み換え大腸菌で産生するアミノ酸サプリで好酸球増加筋痛症候群 **EMS (Eosinophilic Myalgia Syndrome)** が起き 38 名死亡。グルタミン酸 (味の素) による? 中華料理店症候群 **CRS Chinese Restaurant Syndrome** は有名。