

まったく医薬品。JAN品目すべてが、医薬品として認可され流通しているわけではない。

#### ■参考資料

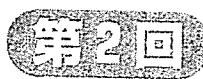
- 1) MedNet Service の利用登録  
<http://158.232.12.18/public/default.aspx?c=1f216b1a-c080-46a1-9a39-c33717387926>
- 2) The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names(INN)for pharmaceutical substance  
<http://www.who.int/medicinedocs/collect/edmweb/pdf/s4895e.pdf>
- 3) pINNおよびrINNのリスト <http://www.who.int/druginform>
- 4) 日本医薬品一般名称データベース <http://moldb.nihs.go.jp/jan/Default.htm>
- 5) 医療用日本医薬品集 じほう
- 6) 医薬品要覧 じほう
- 7) 薬学生・薬剤師のための知っておきたい医薬品選400, じほう
- 8) USP Dictionary of USAN and International Drug Names : U.S. Pharmacopoeia
- 9) ステッドマン医学大辞典 改訂第5版(電子版), メジカルビューエー社
- 10) NEW薬理学 改訂第4版, 南江堂



# 薬の名前

## システムを知れば薬がわかる

Stems used in drug names : For the better understanding of pharmacological actions of drugs



名古屋市立大学大学院薬学研究科

宮田直樹

NAOKI MIYATA

Faculty of Pharmaceutical Sciences, Nagoya City University

### はじめに

第1回(本誌2006年8月号)では、酵素阻害薬を示す「-stat-」を含むシステムとして、  
 「-vastatin」：HMGCoA還元酵素阻害薬  
 「-mastat」：マトリックス分解酵素阻害薬  
 「-restat」：アルドース還元酵素阻害薬  
 「-castat」：ドバミン- $\beta$ -ヒドロキシラーゼ阻害薬  
 「-elestat」：エラスターーゼ阻害薬  
 「-inostat」：ヒストン脱アセチル化酵素阻害薬  
 「-listat」：パンクレアチニリパーゼ阻害薬  
 を紹介した。

今回は、「-stat-」以外の酵素阻害薬を示すシステムを紹介する。

### 「-pril」：アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害薬

「-pril」は、アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害薬を示すシステムである。腎臓にあるアンジオテンシン変換酵素は、アンジオテンシンⅠをアンジオテンシンⅡに変換する(図1)。アンジオテンシンⅡが血管平滑筋にあるアンジオテンシンⅡ受容体に結合すると、血管が収縮し血圧が上昇する。アンジオテンシン変換酵素阻害薬は、

アンジオテンシンⅠ

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-Phe-His-Leu

アンジオテンシンⅡ

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-Phe

アンジオテンシン変換酵素

図1 アンジオテンシン変換酵素が触媒する生体反応

アンジオテンシンⅡの生成を抑制し血圧を下げる。

アンジオテンシン変換酵素の基質結合部位に特異的に結合する化合物の探索研究により、Captopril(カプトプリル)が開発された。システム「-pril」は、アンジオテンシン変換酵素阻害薬として最初に開発されたカプトプリルに由来している。

「-pril」をシステムとする医薬品の例を以下に示す(図2)。

Captopril(カプトプリル)

Alacepril(アラセプリル)

Lisinopril(リシノプリル)

Benazepril(ベナゼプリル)

Cilazapril(シラザプリル)

Delapril(デラプリル)

Enalapril(エナラプリル)

Imidapril(イミダプリル)

Perindopril(ペリンドプリル)

## 薬の名前

ステムを知れば薬がわかる

【解説】

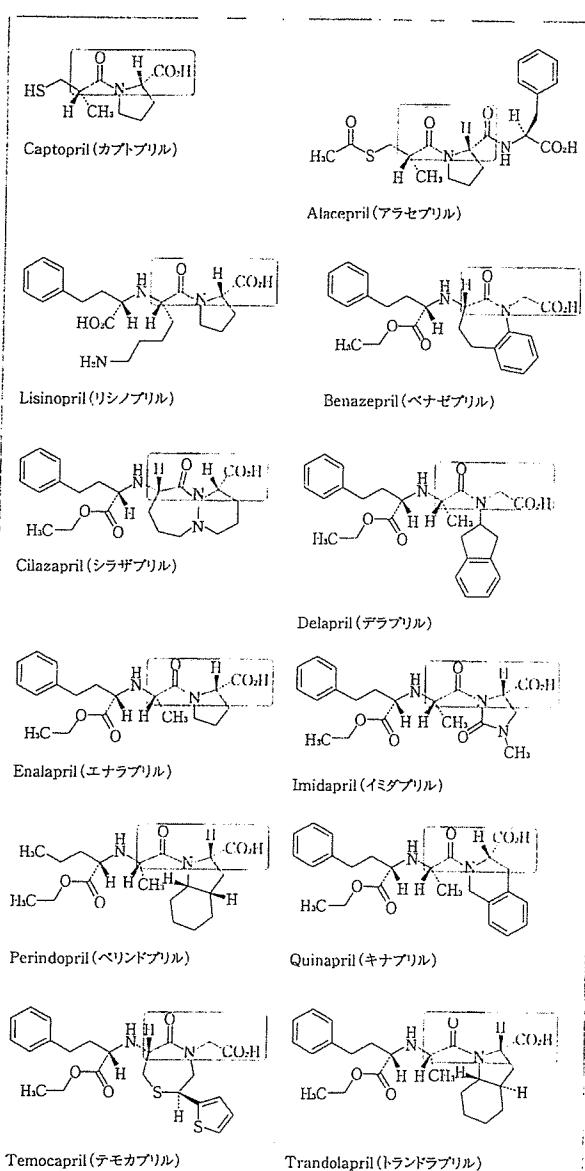


図2 アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害薬を示すシステム「-pril」を持つ医薬品

Quinapril(キナブリル)

Temocapril(テモカブリル)

Trandolapril(トランドラブリル)

このうち、Captopril(カブトブリル)、Alacepril(アラセブリル)、Lisinopril(リシノブリル)は、日本に収載されている。

なお、理解しやすくするために、図には活性本体、すなわち、INNに対応する構造と名前を示した。構造式は、

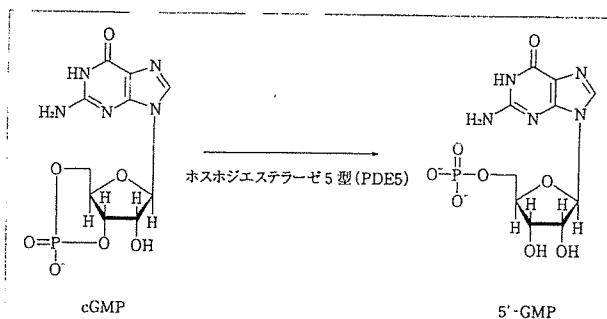


図3 ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)が触媒する生体反応

日局、JAN通知書、INN Database記載の構造式などに基づいて記載したが、構造の類似性を理解しやすくなるため、一部の構造式の表記を変更した。

## 「-afil」：ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)阻害薬

「-afil」は、ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)の選択的阻害薬を示すシステムである。ホスホジエステラーゼ(PDE)は、細胞内のセカンドメッセンジャーであるcAMPとcGMPを分解する酵素で、サイクリックヌクレオチドを介したシグナル伝達の中心的な制御因子として働いている。PDEの1つPDE5は、cGMPの5'-GMPへの加水分解を選択的に触媒する(図3)。種々の病的状態では細胞内cGMPが不足した状態になっていることが多く、PDE5の活性を阻害すると細胞内のcGMP濃度を高めることができる。ヒト海綿体組織でPDE5の活性を阻害しcGMP濃度が高まると勃起力が増強するので、勃起不全治療薬として使用される。

「-afil」をシステムとする医薬品の例を以下に示した(図4)。

Sildenafil(シリデナフィル)

Vardenafil(バルデナフィル)

Tadalafil(日本未承認)

## 「-bactam」：β-ラクタマーゼ阻害薬

「-bactam」は、β-ラクタマーゼを阻害する薬を示すシステムである。ペニシリン、セフロロスピロリンなどのβ-ラクタム系抗生物質は、活性基であるβ-ラクタム環がβ-ラクタマーゼによって加水分解されると活性が消失する。ペニシリン系抗生物質のβ-ラクタム環を加水

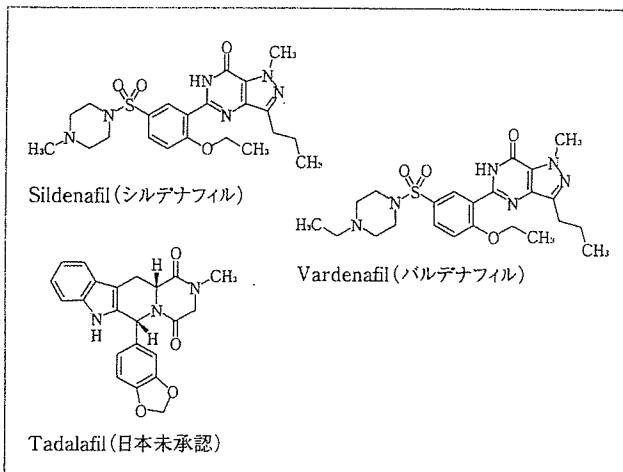


図4 ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)阻害薬を示すシステム「-afil」を持つ医薬品

分解する $\beta$ -ラクタマーゼをペニシリナーゼ、セファロスポリナーゼと呼ぶ(図5)。

$\beta$ -ラクタマーゼを阻害する薬は、それ自体に抗菌活性はないが、 $\beta$ -ラクタマーゼによって不活化される抗生素に配合して使用すると、半薬の抗菌活性を保持することができる。

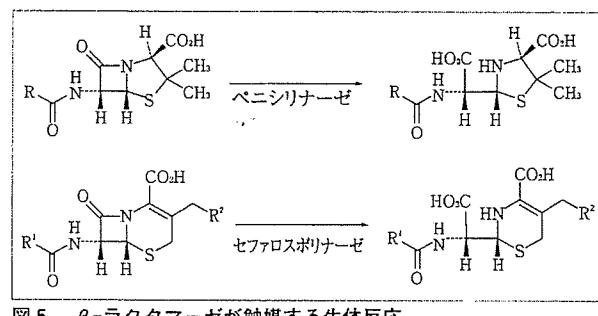


図5  $\beta$ -ラクタマーゼが触媒する生体反応

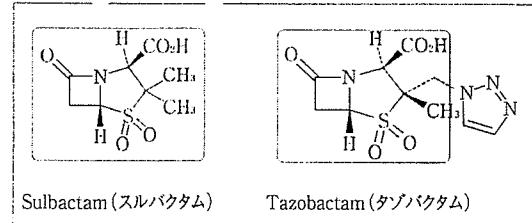


図6  $\beta$ -ラクタマーゼ阻害薬を示すシステム「-bactam」を持つ医薬品

「-bactam」をシステムとする医薬品の例を以下に示した(図6)。

Sulbactam(スルバクタム)

Tazobactam(タゾバクタム)

このうち、スルバクタムのナトリウム塩である

ステムを知れば薬がわかる

[解説]

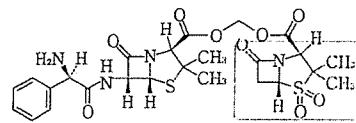


図7  $\beta$ -ラクタマーゼ阻害薬Subactam(スルバクタム)を結合させたプロドラッグ



図8 アセチルコリンエステラーゼが触媒する生体反応

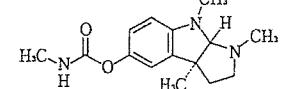
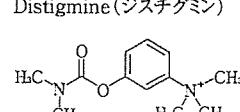
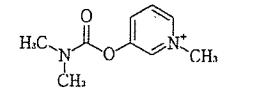
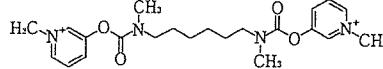


図9 アセチルコリンエステラーゼ阻害薬を示すステム「-stigmine」を持つ医薬品

Sulbactam Sodium(スルバクタム ナトリウム)は、日局に収載されている。

また、日局収載の「Sultamicillin(スルタミシン)」は、ペニシリン系抗生物質「Ampicillin(アンピシリン)」に $\beta$ -ラクタマーゼ阻害薬「Subactam(スルバクタム)」を結合させたプロドラッグであり、「Ampicillin(アンピシリン)」に優る抗菌活性を示す(図7)。

### 「-stigmine」：アセチルコリンエステラーゼ阻害薬

「-stigmine」は、アセチルコリンエステラーゼを阻害する薬を示すシステムである。アセチルコリン(ACh)は神経伝達物質であり、神経末端から放出される。AChがアセチルコリン受容体に結合すると筋収縮を促進する。アセチルコリンエステラーゼは、AChをコリンと酢酸に分解する酵素であり(図8)、神経組織、赤血球、筋肉などに存在し神經の刺激伝達に関係している。アセチルコリンエステラーゼを阻害すると、筋収縮や中枢神経系の亢進が持続する。また、脳内のAChの不足はアルツハイマー病と関連があるとされ、アセチルコリンエステラーゼの阻害剤が治療薬としても用いられている。

「-stigmine」をステムとする医薬品には、以下に示すものがある(図9)。

Distigmine(ジスチグミン)

Neostigmine(ネオスチグミン)

Pyridostigmine(ピリドスチグミン)

Physostigmine(フィゾスチグミン)

日局には、ジスチグミンの臭化物であるDistigmine Bromide(ジスチグミン臭化物)、ネオスチグミンのメチル硫酸塩であるNeostigmine Methylsulfate(ネオスチグミンメチル硫酸塩)、ピリドスチグミンの臭化物であるPyridostigmine Bromide(ピリドスチグミン臭化物)が収載されている。

### 「-coxib」：シクロオキシゲナーゼ阻害薬

「-coxib」は、シクロオキシゲナーゼ(COX)阻害薬を示すシステムである。COXは、プロスタグランジン(PG)の生合成に関わる酵素であり、リン脂質から生じたアラキドン酸をPGエンドペーパーオキシド(PGG<sub>2</sub>, PGH<sub>2</sub>)に変換する(図10)。

インドメタシンやアスピリンなどの非ステロイド系抗炎症剤(NSAIDs)は、COXを阻害してPGの生合成を阻止し、解熱、鎮痛、抗炎症作用を示す。

COXには、COX-1とCOX-2の2種がある。COX-1は、生体組織全体に存在し、生産されたPGは血小板凝集、血管拡張、胃粘膜保護などの生理機能調節に関わっているのに対し、COX-2は、炎症部位で产生され炎症反応に関わるPGを生合成することから、炎症を抑える目的でCOX-2を選択的に阻害する薬が開発されている。

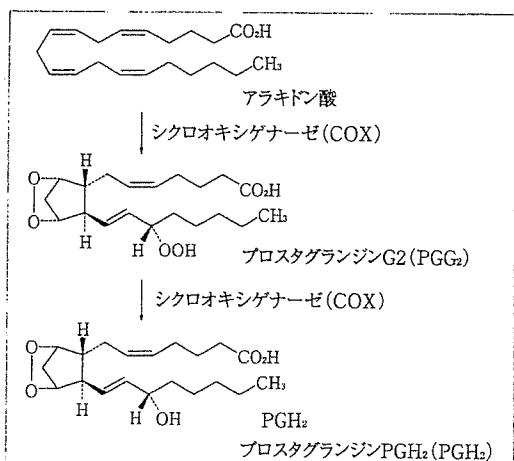


図10 シクロオキシゲナーゼ(COX)が触媒する生体内反応

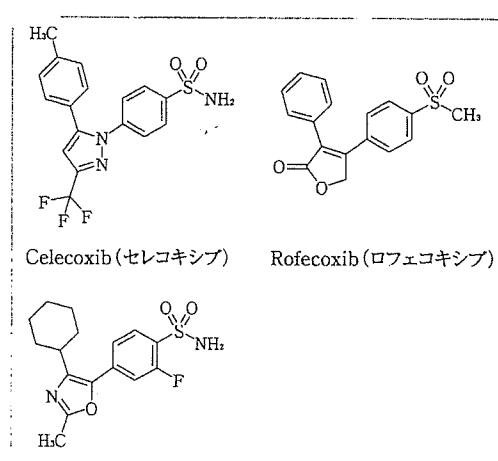


図11 シクロオキシゲナーゼ(COX)阻害薬を示すステム「-coxib」を持つ医薬品

COX阻害作用を示すシステム「-coxib」を持つINN品目には以下のものがある(図11)。

Celecoxib(セレコキシブ)

Rofecoxib(ロフェコキシブ)

Tilmacoxib(チルマコキシブ)

なお、抗炎症作用を示すシステムには、化学構造に基づいて付けられた、「-ac」(イブフェナク誘導体)、「-icam」(インキシカム誘導体)、「-metacin」(インドメタシン誘導体)、「-nixin」(アニリノニコチン酸誘導体)、「-profen」(イブプロフェン誘導体)、「-butazon」(フェニルブタゾン誘導体)、「-femamic acid」(アントラニル酸誘導体)などがある。これらについては別途紹介する。

以上、今回は酵素阻害剤を示すシステム「-pril」、「-afil」、「-bactam」、「-stigmine」、「-coxib」について紹介した。

#### ■参考資料

- 1) MedNet Serviceの利用登録 <http://158.232.12.18/public/default.aspx?c=1f216b1a-c080-46a1-9a39-c33717387926>
- 2) The use of stems in the selection of International Nonproprietary Names(INN) for pharmaceutical substance. <http://www.who.int/medicinedocs/collect edmweb/pdf/s4895e/s4895e.pdf>
- 3) pINNおよびrINNのリスト <http://www.who.int/druginformation/general/innlists.shtml>
- 4) 日本医薬品一般名称データベース <http://moldb.nihs.go.jp/jan/Default.htm>
- 5) 医療用日本医薬品集、じほう
- 6) 医薬品要覧、じほう
- 7) 薬学生・薬剤師のための知っておきたい医薬品選400、じほう
- 8) USP Dictionary of USAN and International Drug Names, U.S.Pharmacopoeia.
- 9) ステッドマン医学大辞典 改訂第5版(電子版), メジカルビューアー社
- 10) NEW薬理学 改訂第4版, 南江堂
- 11) やさしい薬理のメカニズム, 学研



# 薬の名前

## システムを知れば薬がわかる

Stems used in drug names : For the better understanding of pharmacological actions of drugs



名古屋市立大学大学院薬学研究科

宮田直樹

NAOKI MIYATA

*Faculty of Pharmaceutical Sciences, Nagoya City University*

### はじめに

本連載第2回(本誌2006年9月号)では、酵素阻害薬を示すシステムとして、

「-pril」：アンジオテンシン変換酵素(ACE)阻害薬  
 「-afil」：ホスホジエステラーゼ5型(PDE5)阻害薬  
 「-bactam」： $\beta$ -ラクタマーゼ阻害薬  
 「-stigmine」：アセチルコリンエステラーゼ阻害薬  
 「-coxib」：シクロオキシゲナーゼ阻害薬  
 を紹介した。

今回は、先導的な医薬品の名前の一部がシステムとなつた例を、抗炎症作用薬を中心に紹介する。

### 「-profen」：イブプロフェン系抗炎症薬

「-profen」は、イブプロフェン系抗炎症薬を示すシステムである。Ibuprofen(イブプロフェン)は、1966年にpINNとして、1967年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図1)。日本では1971年に消炎鎮痛解熱薬として承認され、現在日局に収載されている。

その後も、イブプロフェンと同じフェニルプロピオン酸構造を持つ抗炎症薬が開発され、INN委員会は、Ibuprofenの語尾「-profen」をイブプロフェン系抗炎症

薬を示すシステムと決めた。

イブプロフェン系抗炎症薬は、非ステロイド系抗炎症薬の一一種で、本連載の第2回で紹介した「-coxib」をシステムとする医薬品と同様に、シクロオキシゲナーゼに作用し、プロスタグランジンの生合成を阻害して抗炎症作用を示す。

イブプロフェン系抗炎症薬を示すシステム「-profen」を持つ医薬品の例を図1に示す。

これらのうち、Flurbiprofen(フルルビプロフェン)、Ketoprofen(ケトプロフェン)、Loxoprofen(ロキソプロフェン)のナトリウム塩の水和物Loxoprofen Sodium Hydrate(ロキソプロフェンナトリウム水和物)、Pranoprofen(プラノプロフェン)は、日局に収載されている。

また、システム「-profen」を持つプロドラッグとして、図2に示すIbuprofen Piconol(イブプロフェンピコノール)、Flurbiprofen Axetil(フルルビプロフェンアキセチル)がある。

これらのプロフェン系医薬品はすべてラセミ体である。

### 「-metacin」：インドメタシン系抗炎症薬

「-metacin」は、インドメタシン系抗炎症薬を示すシステムである。Indometacin(インドメタシン)は、1963年



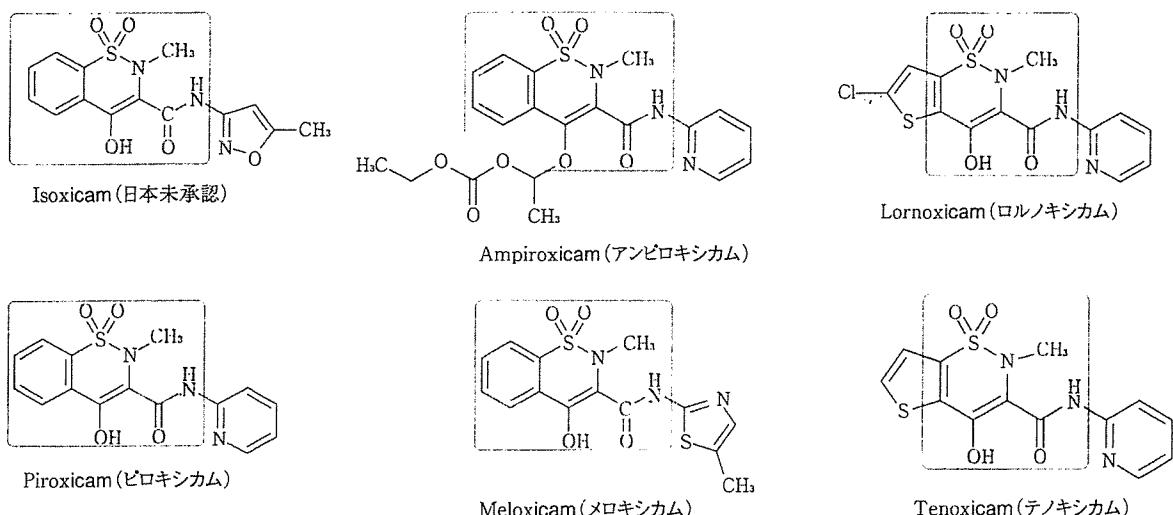


図4 イソキシカム系抗炎症薬を示すステム「-icam」を持つ医薬品

ログルメタシン)のマレイン酸塩であるProglumetacin Maleate(プログルメタシンマレイン酸塩)はJAN品目である。

### 「-nixin」:アニリノニコチン酸系抗炎症薬



### 「-icam」:イソキシカム系抗炎症薬

「-icam」は、イソキシカム系抗炎症薬を示すステムである。Isoxicamは、1973年にpINNとして、1974年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図4)。Isoxicamは、欧米では医薬品として使用されているが、日本では認可されていない。

その後、Isoxicamと構造類似のオキシカム系の抗炎症薬が開発され、Isoxicamの語尾「-icam」が、イソキシカム系抗炎症薬を示すステムと決められた。

イソキシカム系抗炎症薬も、非ステロイド系抗炎症薬の一種で、シクロオキシゲナーゼに作用しプロスタグランジンの生合成を阻害して抗炎症作用を示す。

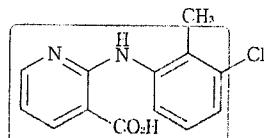
イソキシカム系抗炎症薬を示すステム「-icam」を持つ医薬品を図4に示す。

Piroxicam(ピロキシカム)は、日局に収載されている。また、Ampiroxicam(アンピロキシカム)は、ピロキシカムのプロドラッグである。これらの医薬品は、基本的にCOX-1とCOX-2の両方を阻害するが、Meloxicam(メロキシカム)は比較的COX-2選択的である。

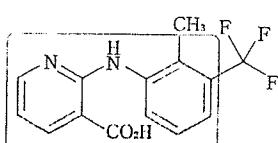
## 薬の名前

ステムを知れば薬がわかる

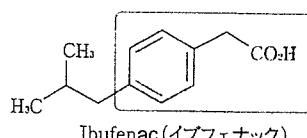
第3回



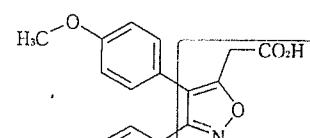
Clonixin(日本未承認)



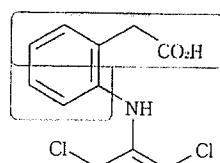
Flunixin(日本未承認)



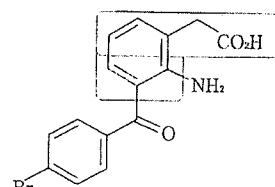
Ibufenac(イブフェナック)



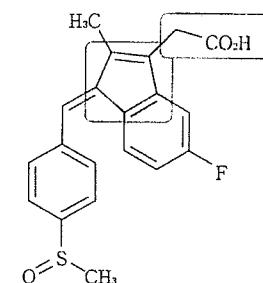
Mofezolac(モフェゾラク)



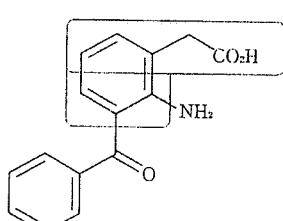
Diclofenac(ジクロフェナク)



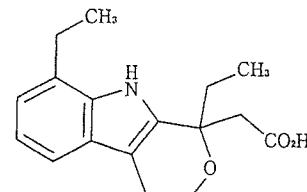
Bromfenac(ブロムフェナク)



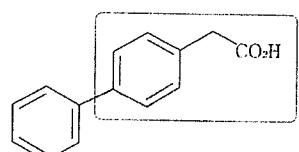
Sulindac(スリンダク)



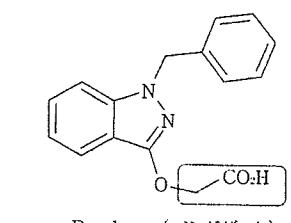
Amfenac(アンフェナク)



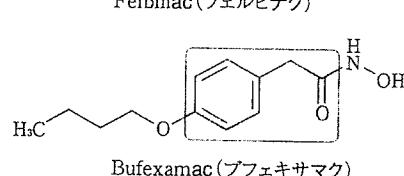
Etodolac(エトドラク)



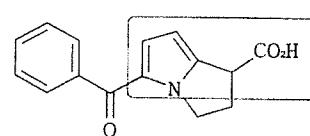
Felbinac(フェルビナク)



Bendazac(ベンダザック)



Bufexamac(ブフェキサマク)



Ketorolac(日本未承認)

図5 アニリノニコチニ酸系抗炎症薬を示すシステム「-nixin」を持つ医薬品

システムである。「-nixin」をシステムとする医薬品としては、図5に示すClonixinとFlunixinがあり、欧米では販売されているが、日本では認可されていない。

### 「-ac」: イブフェナック系 抗炎症薬

「-ac」は、イブフェナック系抗炎症薬を示すシステムである。解熱鎮痛消炎薬 Ibufenac(イブフェナック)は、1964年にpINNとして、1967年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図6)。しかし、医薬品としては使用されていない。

その後、イブフェナック系解熱鎮痛消炎薬を示すシステムとして「-ac」が決められた。

イブフェナック系抗炎症薬も、他の非ステロイド系抗炎症薬と同様に、シクロオキシゲナーゼに作用し、プロスタグランジンの生合成を阻害して抗炎症作用を示す。

イブフェナック系抗炎症薬を示すシステム「-ac」を持つ医薬品を図6に示す。このうち、Diclofenac(ジクロフェナク)のナトリウム塩Diclofenac Sodium(ジクロフ

ン酸ナトリウム)およびBufexamac(ブフェキサマク)は、日局収載品である。

イブフェナック系抗炎症薬の大部分は、イブフェナックと同様にフェニル酢酸構造を持つ抗炎症薬である。しかし、Bufexamacのようにフェニル酢酸のカルボン

図6 イブフェナック系抗炎症薬を示すシステム「-ac」を持つ医薬品

酸が生物学的等価体であるヒドロキサム酸に変換されている場合、また、Mofezolac(モフェゾラク)やSulindac(スリンダク)のようにフェニル酢酸のフェニル基が他の芳香環系に置換された場合、さらには、Etodolac(エトドラク)やBendazac(ベンダザック)のように単純な酢酸系抗炎症薬の場合にもステム「-ac」が拡張使用される。Ketorolacは、米国薬局方(USP)収載品であるが、わが国では未承認である。

なお、字訳基準に従えば、「-ac」の日本語訳は「アック」ではなく「アク」が正しい。Ibufenacは「イブフェナック」と誤訳されて日本語名になってしまったと思われる。

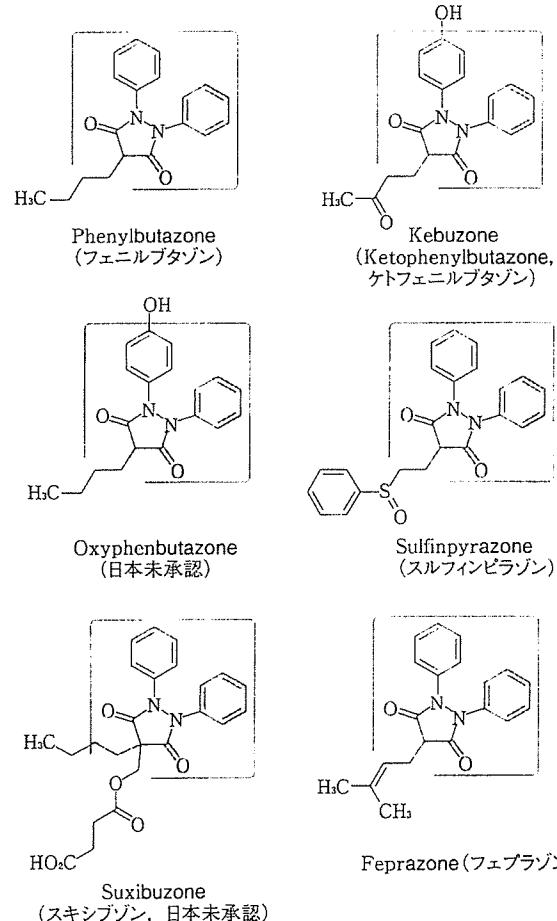


図7 フェニルブタゾン系抗炎症薬を示すシステム「-butazone, -buzone, (-azone)」を持つ医薬品

## 「-butazone, -buzone, (-azone)」: フェニルブタゾン系抗炎症薬

「-butazone, -buzone, (-azone)」は、フェニルブタゾン系抗炎症薬を示すシステムである。解熱鎮痛消炎薬として日局にも収載されているPhenylbutazone(フェニルブタゾン)は、1953年にpINNとして、1954年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図7)。

その後、フェニルブタゾンと同様にピラゾリジン誘導体を母核とする抗炎症薬が開発され、フェニルブタゾン系解熱鎮痛消炎薬を示すシステムとして「-butazone, -buzone, (-azone)」を使うようになった。

フェニルブタゾン系抗炎症薬も、他の非ステロイド系抗炎症薬と同様に、シクロオキシゲナーゼに作用し、プロスタグランジンの生合成を阻害して抗炎症作用を示す。

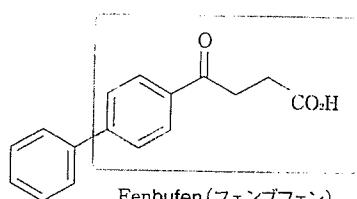
フェニルブタゾン系抗炎症薬を示すシステム「-butazone, -buzone, (-azone)」を持つ医薬品の例を図7に示す。

「-butazone」をシステムとする医薬品には、フェニルブタゾン以外に、例えばOxyphenbutazone(日本未承認)

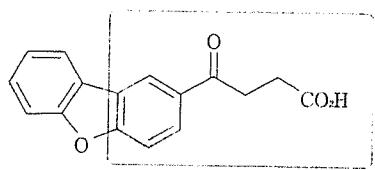
## 薬の名前

ステムを知れば薬がわかる

第3回



Fenbufen (フェンブフェン)



Furobufen (日本未承認)

図8 アリールブタン酸系抗炎症薬を示すシステム「-bufen」を持つ医薬品

があり、これはかつてUSPに収載されていたが、現在は収載されていない。

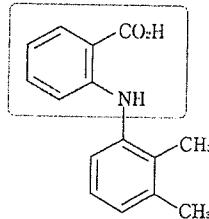
「-buzone」をシステムとする医薬品には、Suxibuzone(スキシブゾン)やKebuzoneがある。なお、KebuzoneのJANはKetophenylbutazone(ケトフェニルブタゾン)である。これらは、すべて日本では承認されていない。

また、INN委員会は正式には認めていないようであるが、「-azone」もフェニルブタゾン系抗炎症薬を示すシステムとして使われており、「-azone」を使用する医薬品には、Sulfinpyrazone(スルフィンピラゾン)やFeprazone(フェプラゾン)がある。スルフィンピラゾンは、日局に収載されている。

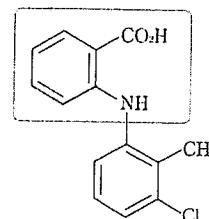


### 「-bufen」：アリールブタン酸系抗炎症薬

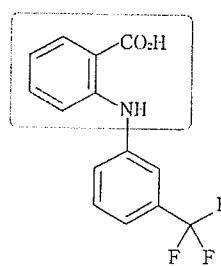
「-bufen」は、アリールブタン酸系抗炎症薬を示すシステムである。Fenbufen(フェンブフェン)およびFurobufen(日本未承認)は、ともに1973年にpINNとして、1974年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図8)。フェンブフェンは、日局収載品目である。



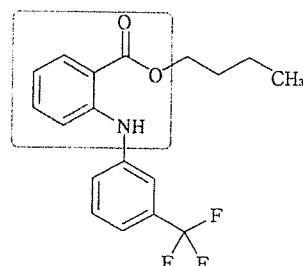
Mefenamic Acid (メフェナム酸)



Tolfenamic Acid (トルフェナム酸)



Flufenamic Acid (フルフェナム酸)



Ufenamate (ウフェナマート)

図9 アントラニル酸系抗炎症薬を示すシステム「-fenamic acid, -fenamate」を持つ医薬品

### 「-fenamic acid, -fenamate」：アントラニル酸系抗炎症薬

「-fenamic acid, -fenamate」は、アントラニル酸系抗炎症薬を示すシステムである。Mefenamic Acid(メフェナム酸)は、1963年にpINNとして、1974年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された(図9)。メフェナム酸は、日局収載品目である。同じく「-fenamic acid」をシステムとする医薬品に、Flufenamic Acid(フルフェナム酸), Tolfenamic Acid(トルフェナム酸)がある。また、「-fenamate」をシステムとする医薬品にUfenamate(ウフェナマート)がある。

以上、今回は、抗炎症薬を示すシステム「-profen」、「-metacin」、「-icam」、「-nixin」、「-ac」、「-butazone」、「-buzone」、「-azone」、「-bufen」、「-fenamic acid」、「-fenamate」について紹介した。

なお、本稿作成に際して、第1回(本誌2006年8月号)および第2回に記載した参考資料を使用した。



## スステムを知れば薬がわかる

Stems used in drug names : For the better understanding of pharmacological actions of drugs



名古屋市立大学大学院薬学研究科

宮田直樹

NAOKI MIYATA

*Faculty of Pharmaceutical Sciences, Nagoya City University*

### はじめに

本連載第3回(本誌2006年10月号)では、抗炎症薬を示すシステムとして、

- 「-profen」：イブプロフェン系抗炎症薬
- 「-metacin」：インドメタシン系抗炎症薬
- 「-icam」：イソキシカム系抗炎症薬
- 「-nixin」：アニリノニコチニン酸系抗炎症薬
- 「-ac」：イブフェナック系抗炎症薬
- 「-butazone, -buzone(-azone)」：フェニルブタゾン系抗炎症薬
- 「-bufen」：アリールブタン酸系抗炎症薬
- 「-fenamic acid, -fenamate」：アントラニル酸系抗炎症薬

を紹介した。

今回は、中枢神経系に作用する薬のシステムを紹介する。

### 「-flurane」：ハロゲン化アルキル系一般吸入麻酔薬

「-flurane」は、ハロゲン化アルキル系一般吸入麻酔薬を示すシステムである。「-flurane」をシステムとする医薬品には、Enflurane(エンフルラン)、Isoflurane(イソ

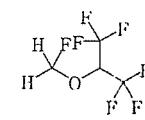
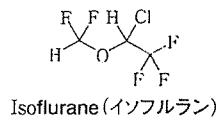
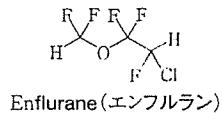


図1 ハロゲン化アルキル系一般吸入麻酔薬を示すシステム「-flurane」を持つ医薬品

フルラン), Sevoflurane(セボフルラン)があり、これらのうちEnflurane(エンフルラン)とIsoflurane(イソフルラン)は、日局に収載されている(図1)。

なお、ハロゲン化アルキル系一般吸入麻酔薬でありながら、「-flurane」をシステムとしない医薬品としてHalothane(ハロタン)がある。

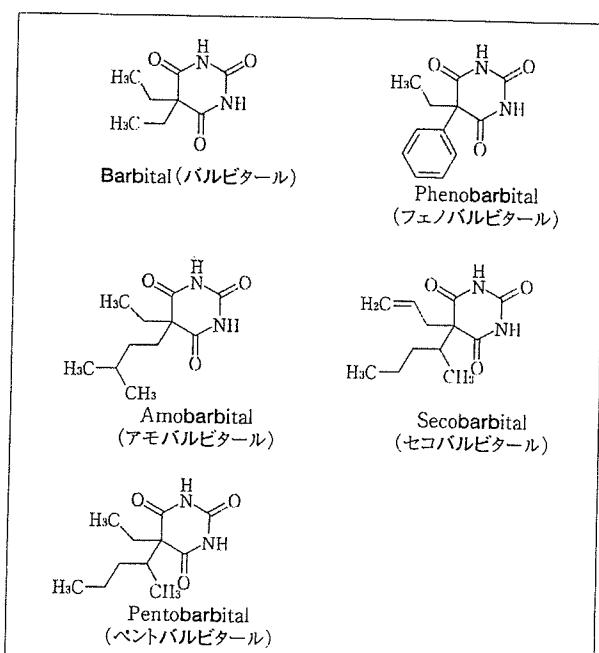


図2 バルビツール酸系催眠薬を示すステム「-barb-」を持つ医薬品

### 「-barb-」:バルビツール酸系催眠薬

「-barb-」は、バルビツール酸系催眠薬を示すシステムである。Barbital(バルビタール)は、1956年にpINNとして、1959年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された。日本では、大正9年の第4改正日局に収載され現在も日局に収載されている。

バルビツール酸系催眠薬を示すシステム「-barb-」を持つ医薬品の例を図2に示す。これらのうち、Barbital(バルビタール)、Amobarbital(アモバルビタール)およびそのナトリウム塩、Pentobarbital(ペントバルビタール)のカルシウム塩、Phenobarbital(フェノバルビタール)は日局に収載されている。

### 「-clone」:睡眠性精神安定薬

「-clone」は、睡眠性精神安定薬を示すシステムである。睡眠性精神安定薬を示すシステム「-clone」を持つ医薬品の例を図3に示す。

この中で、日本ではZopiclone(ゾピクロン)が販売さ

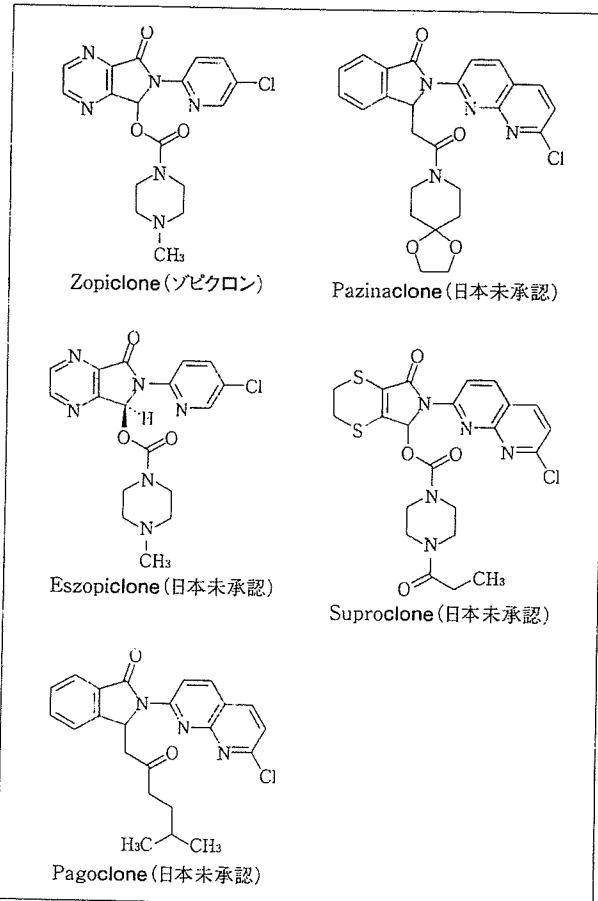


図3 睡眠性精神安定薬を示すシステム「-clone」を持つ医薬品

れている。なお、Zopiclone(ゾピクロン)の光学活性体であるEszopicloneは日本未承認である。

これらの医薬品は、ベンゾジアゼピン受容体に結合し、GABA受容体に影響を及ぼすことでGABA系の抑制機構を増強すると考えられている。

### 「-plon」:ピラゾロピリミジン系抗不安薬・鎮静薬・催眠薬

「-plon」は、ピラゾロピリミジン系抗不安薬・鎮静薬・催眠薬を示すシステムである。システム「-plon」を持つ医薬品の例を図4に示す。

Zaleplon(ザレプロン)を含むこれらの非ベンゾジアゼピン系睡眠薬は、すべて日本では未承認である。

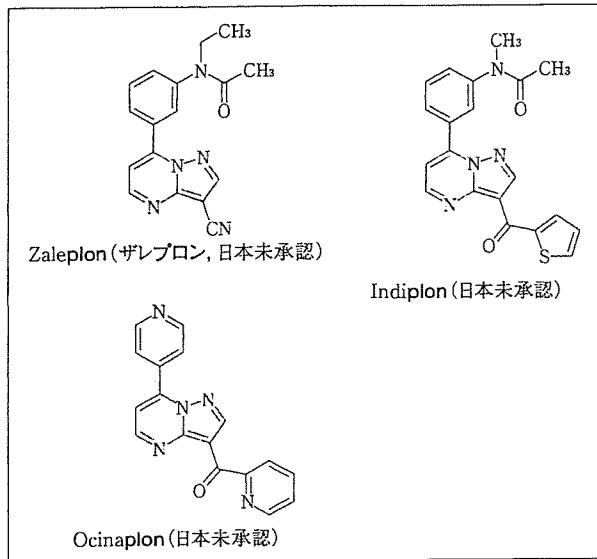


図4 ピラゾロピリミジン系抗不安薬・鎮静薬・催眠薬を示すシステム「-plon」を持つ医薬品

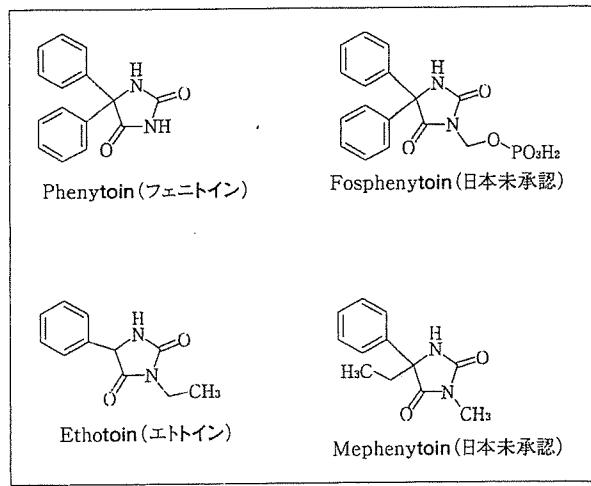


図6 ヒダントイン系鎮痙薬を示すシステム「-toin」を持つ医薬品

### 「-bersat」：ベンゾイルアミノ ベンゾピラン系鎮痙薬

「-bersat」は、ベンゾイルアミノベンゾピラン系鎮痙薬を示すシステムである。「-bersat」をシステムとする医薬品としては、図5に示すCarabersatとTidembersatなどがあるが、いまだ日本では認可されていない。

### 「-toin」：ヒダントイン系鎮痙薬

「-toin」は、ヒダントイン系鎮痙薬を示すシステムであり、Phenytoin(フェニトイント)に由来する。Phenytoin(フェニトイント)は、日本では1949年に医薬品として認可され、現在も日局に収載され使用されている。ヒダント

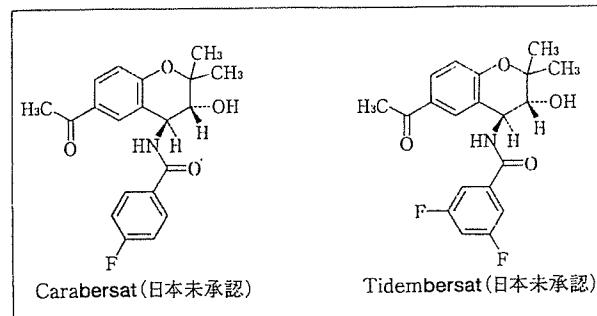


図5 ベンゾイルアミノベンゾピラン系鎮痙薬を示すシステム「-bersat」を持つ医薬品

イン系鎮痙薬は、痙攣の広がりを抑えることにより抗てんかん作用を発揮するといわれている。

ヒダントイン系鎮痙薬を示すシステム「-toin」を持つ医薬品を図6に示す。これらのうち、Phenytoin(フェニトイント)、Phenytoin(フェニトイント)のナトリウム塩は日局収載品である。また、FosphenytoinとMephentytoinは、米国薬局方収載品目であるが、日本ではまだ承認されていない。

なお、化粧品などに配合され消炎・鎮静効果があるといわれているAllantoin(アラントイン)はヒダントイン系鎮痙薬ではない。

### 「-azocine」：6,7-ベンゾモルファン 系麻薬性拮抗／作動薬

「-azocine」は、6,7-ベンゾモルファン系麻薬性拮抗／作動薬を示すシステムである。1960年にWHOのINN委員会は、Phenazocineを命名した。Phenazocineは鎮痛作用を示すが、日本では承認されていない。

その後、Phenazocineと同様に6,7-ベンゾモルファンを母核とする鎮痛薬が開発され、INN委員会は6,7-ベンゾモルファン系麻薬性拮抗／作動薬を示すシステムとして、「-azocine」を決めた。6,7-ベンゾモルファン系麻薬性拮抗／作動薬は、非麻薬性鎮痛薬として使用されている。

6,7-ベンゾモルファン系麻薬性拮抗／作動薬を示すシステム、「-azocine」を持つ医薬品の例を図7に示す。Pentazocine(ペントゾシン)は日局に収載されている。

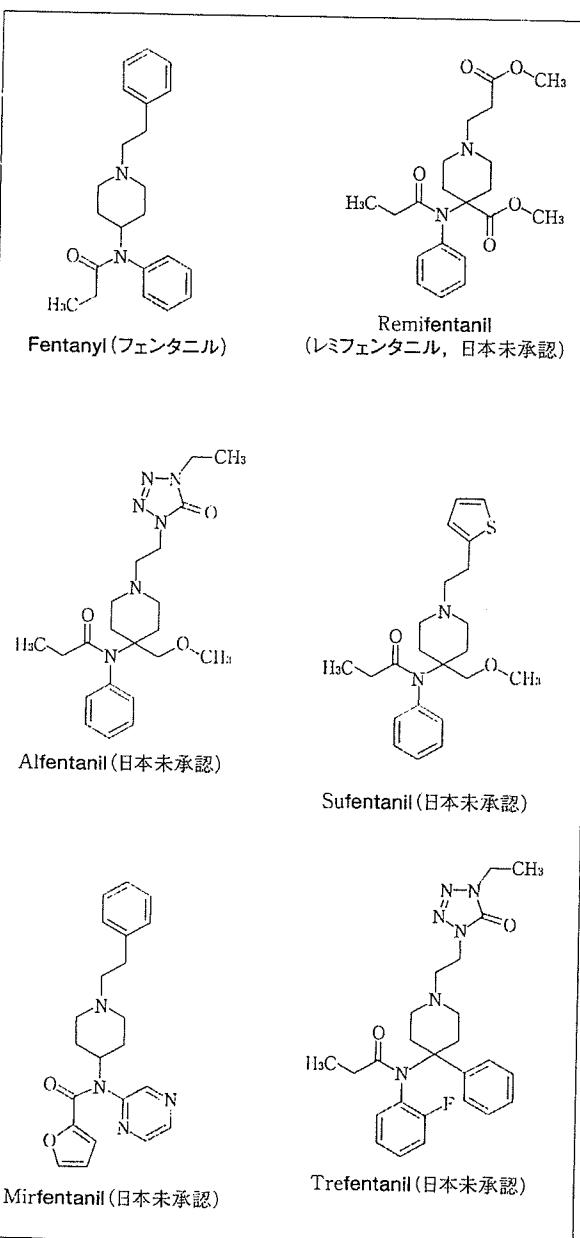
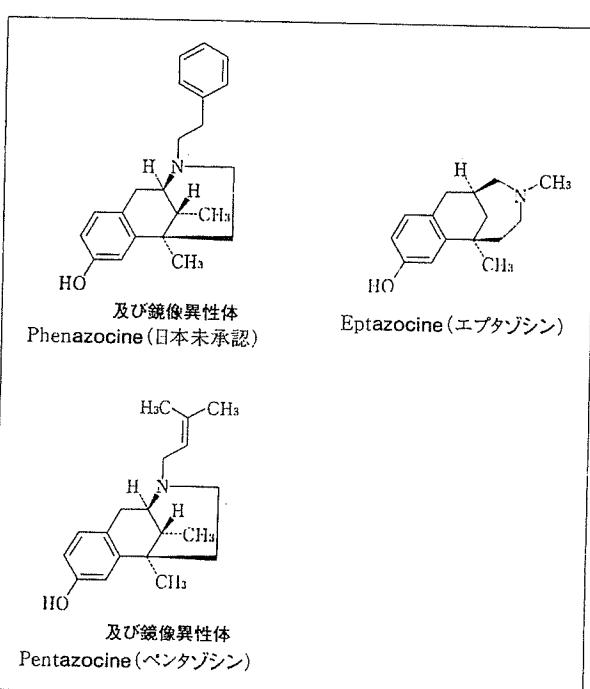


図9 Fentanyl(フェンタニル)およびフェンタニル系麻薬性鎮痛薬を示すシステム「-fentanyl」を持つ医薬品

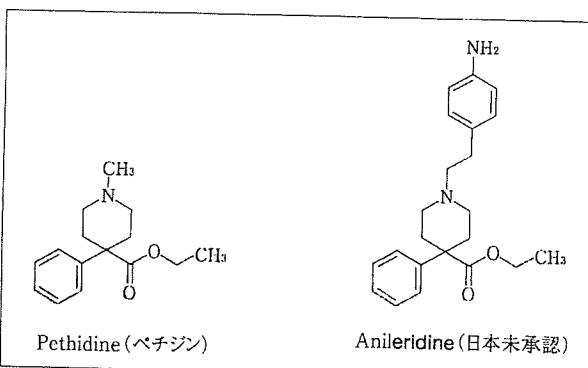


図8 Pethidine(ペチジン)およびペチジン系鎮痛薬を示すシステム「-eridine」を持つ医薬品

### 「-fentanyl」: フェンタニル系麻薬性鎮痛薬

「-fentanyl」は、フェンタニル系麻薬性鎮痛薬を示すシステムである。Fentanyl(フェンタニル)は、1964年にpINNとして、また1966年にrINNとしてWHOのINN委員会によって命名された。Fentanyl(フェンタニル)のケン酸塩は日局に収載されている。その後、fentanylの

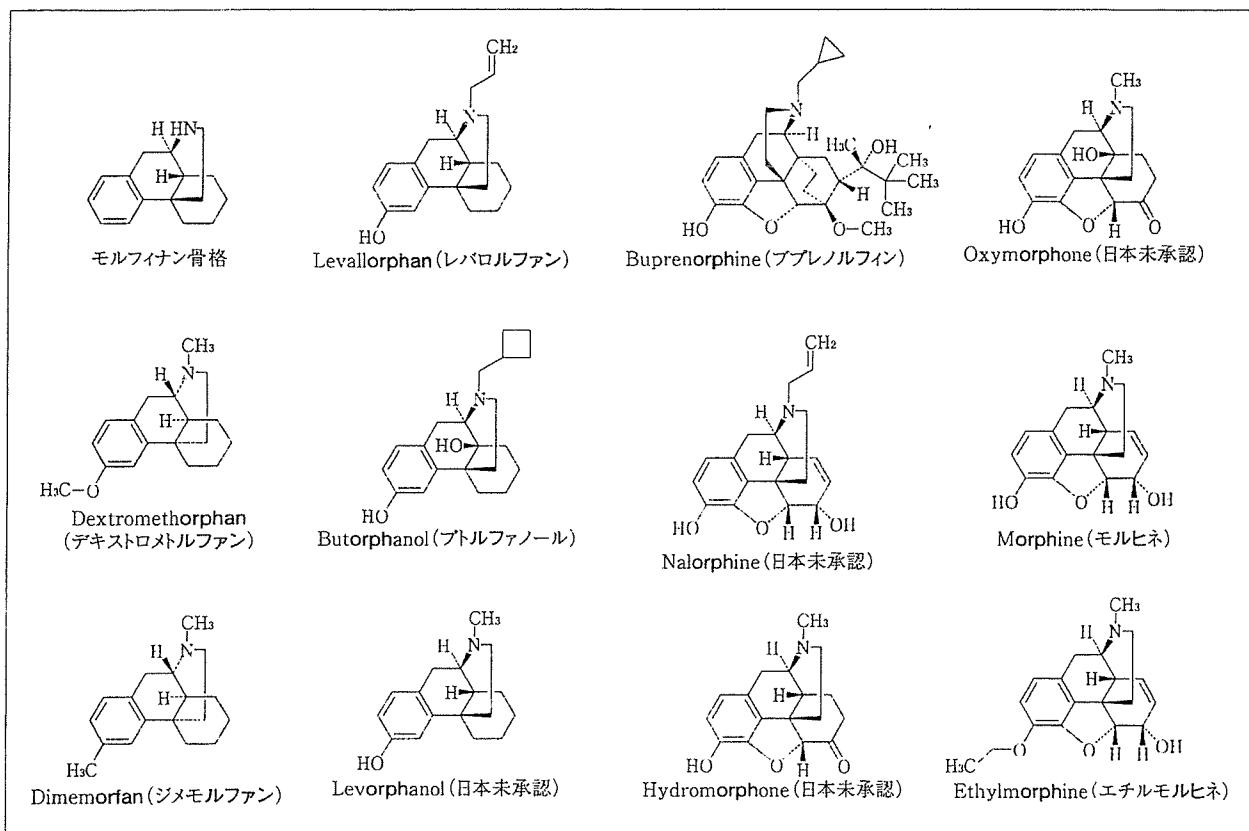


図10 モルフィナン骨格およびモルフィナン系麻薬性拮抗／作動薬を示すシステム「-orphan, -orph-」を持つ医薬品

yをiに換えた「-fentanyl」が、フェンタニルに類似する構造を持つ麻薬性鎮痛薬のシステムとして決められた。

システム「-fentanyl」を持つ医薬品の例を図9に示す。Alfentanil(日本未承認)の塩酸塩の水和物およびSufentanil(日本未承認)のクエン酸塩は、米国薬局方に収載されている。Remifentanil(レミフェンタニル)の塩酸塩は欧米では承認されているが日本では未承認である。

### 「-orphan, -orph-」: モルフィナン系麻薬性拮抗／ 作動薬

「-orphan, -orph-」は、モルフィナン系麻薬性拮抗／作動薬を示すシステムである。モルフィナン骨格およびシステム「-orphan, -orph-」を持つ医薬品の例を図10に示した。

Dextromethorphan(デキストロメトルファン)の臭化水素酸塩の水和物、およびDimemorfan(ジメモルファン)とLevallorphan(レバロルファン)のリン酸塩は、日本に収載されている。また、Butorphanol(ブトルファ

## ステムを知れば薬がわかる

EDIT

ノール)の酒石酸塩とBuprenorphine(ブレノルフィン)の塩酸塩が、JAN品目であり日本で使用されている。また、米国薬局方には、Levorphanolの酒石酸塩の水和物、およびHydromorphoneとOxymorphoneの塩酸塩が収載されている。なお、Dimemorfanのスペルは、phではなくfである。

最後に記載したMorphine(モルヒネ)とEthyl morphine(エチルモルヒネ)は、ともに塩酸塩の水和物が日局に収載されている。これらもステム「-orph-」に属すると考えられるが、WHOが決めたINNではない。

### 「nal-」:ノルモルヒネ系 麻薬性拮抗／作動薬

「nal-」は、ノルモルヒネ系麻薬性拮抗／作動薬を示すステムである。「nal-」は、モルヒネ拮抗薬 Nalorphineに由来する。ステム「nal-」を持つ医薬品の例を図11に示す。

Naloxone(ナロキソン)の塩酸塩は日局に収載されている。また、NalorphineおよびNaltrexoneの塩酸塩が米国薬局方に収載されている。

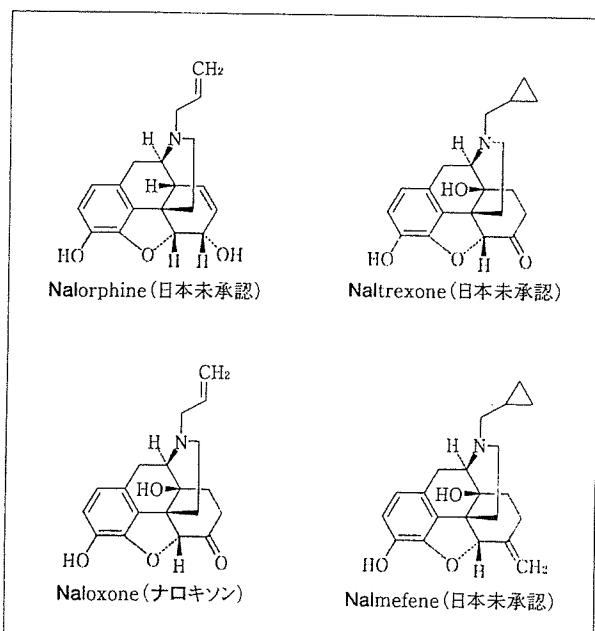


図11 ノルモルヒネ系麻薬性拮抗／作動薬を示すステム「nal-」を持つ医薬品

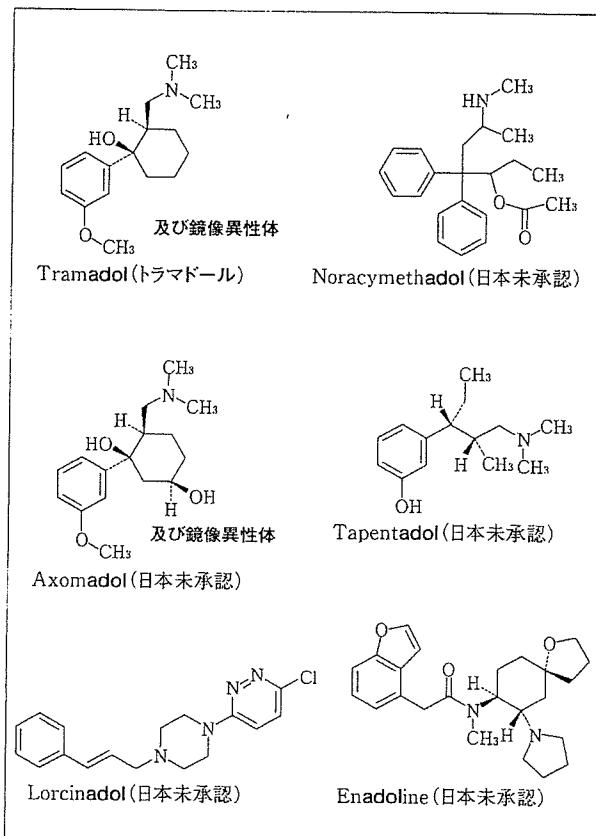


図12 鎮痛薬を示すステム「-adol, -adol-」を持つ医薬品

### 「-adol,-adol-」:その他の鎮痛薬

「-adol, -adol-」は、今まで紹介してきた鎮痛薬に属さない鎮痛薬を示すステムとして使われる。ステム「-adol, -adol-」を持つ医薬品の例を図12に示す。

Tramadol(トラマドール)は、塩酸塩が非麻薬性鎮痛薬として承認されている。Axomadol, Noracymethadolの塩酸塩、Enadolineの塩酸塩は、アメリカで承認されている。

### 「-adom」: Tifluadom系鎮痛薬

「-adom」は、Tifluadom系鎮痛薬を示すステムであり、図13に示すような化合物に「-adom」を用いたINNが付けられているが、いまだ医薬品として承認されていない。

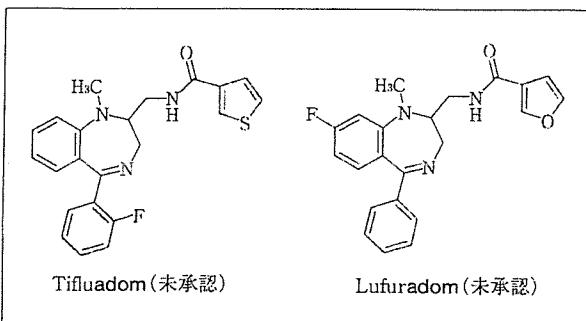


図13 Tifluadom系鎮痛薬を示すステム「-adom」を持つ化合物

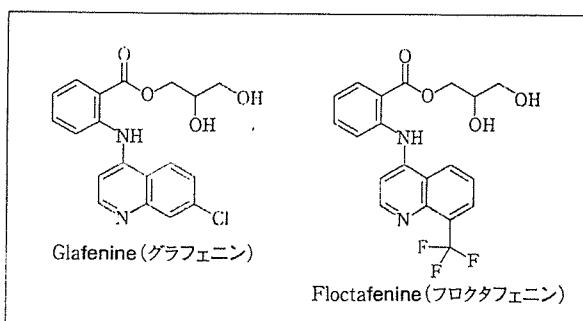


図14 グラフェニン系鎮痛薬を示すステム「-fenine」を持つ医薬品

## 「-fenine」：グラフェニン系 鎮痛薬

「-fenine」は、グラフェニン系鎮痛薬を示すステムである。「-fenine」は、Glafenine(グラフェニン)に由来する。Glafenine(グラフェニン)は、日本では1966年に医薬品として承認されている。ステム「-fenine」を持つ医薬品の例を図14に示す。

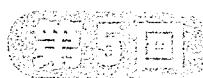
以上、今回は、中枢神経系に作用する薬を示すステム「-flurane」、「-barb-」、「-clone」、「-plon」、「-bersat」、「-toin」、「-azocine」、「-eridine」、「-fentanyl」、「-orphan, -orph-」、「nal-」、「-adol, -adol-」、「-adom」、「-fenine」について紹介した。

なお、本稿作成に際して、第1回(本誌2006年8月号)および第2回(本誌2006年9月号)に記載した参考資料を使用した。



# システムを理解すれば薬がわかる

Stems used in drug names : For the better understanding of pharmacological actions of drugs



国立医薬品食品衛生研究所

内田恵理子, 川崎ナナ

ERIKO UCHIDA, NANA KAWASAKI

National Institute of Health Sciences

名古屋市立大学大学院薬学研究科

宮田直樹

NAOKI MIYATA

Faculty of Pharmaceutical Sciences, Nagoya City University

## はじめに

本連載では、これまで化学薬品のシステムについて紹介してきたが、今回から数回に分けて、生物薬品のシステムを紹介する。生物薬品の第1回目は、生物薬品の一般名の命名に関する基本的ルールを紹介するとともに、サイトカイン類のシステムについて紹介する。

生物薬品の国際一般名(INN)は、化学薬品と同様にWHOのINN委員会で決定される。生物薬品でも多くの場合、医薬品の分類ごとにシステムが与えられ、システムを用いて一般名が命名される。例えば、「som-」は成長ホルモンに関連する医薬品、「-stim」はコロニー刺激因子類、「-mab」はモノクローナル抗体などである。表1に、生物薬品の主な分類とシステムの例を示した。一方、表1に示したインスリン類やインターフェロン類などにはシステムがなく、学術用語と同じ「insulin」、「interferon」が命名に用いられている。命名ルールには統一されていない部分もあるが、本連載では、「insulin」や「interferon」もシステムとして扱うこととする。

医薬品の分類をさらに小分類に分ける必要がある場合

表1 生物薬品の主な分類とシステムの例

成長ホルモン類(growth hormones)	som-
ホルモン放出促進／抑制ペプチド (hormone-release stimulating/inhibiting peptides)	-relin/relax
サイトカイン／インターロイキン類 (cytokines/interleukins)	-kin
コロニー刺激因子類(colony stimulating factors)	-stim
エリスロポエチン類(erythropoietin type blood factors)	-poetin
モノクローナル抗体類(monoclonal antibodies)	-mab
成長因子類(growth factors)	-ermin
酵素類(enzymes)	-ase
血液凝固因子類(blood coagulation factors)	-cog
血液凝固スケード阻害剤 (blood coagulation cascade inhibitors)	-cogin
ペプチド、糖ペプチド類 (peptides and glycopeptides)	-tide
受容体分子類 (receptor molecules, native or modified)	-cept (pre-stem)*
ヒルダントイン類(hirudin derivatives)	-irudin
ヘパリン誘導体類/heparin derivatives)	-parin
インスリン類(insulins)	insulin
インターフェロン類(interferons)	interferon

\*1:暫定システム

は、システムから派生したサブシステム(sub-stem)を用いる。表2に、インターロイキン類のサブシステムの例を示す。