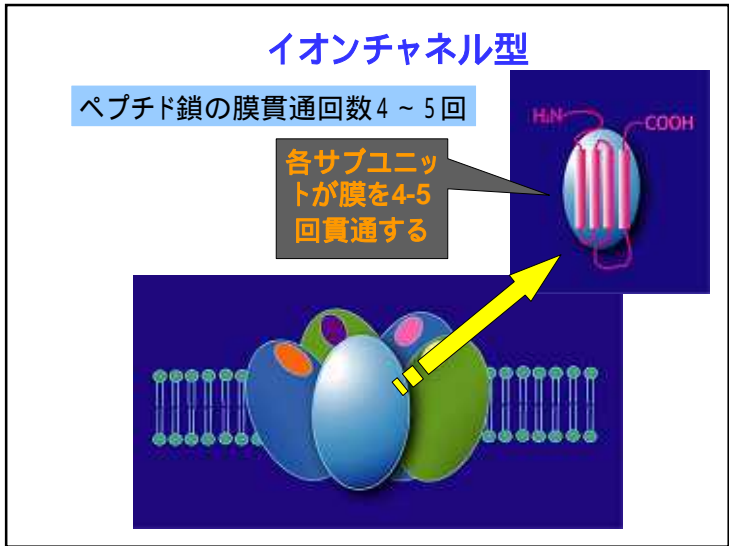


受容体の分類

受容体の種類と細胞内情報伝達機構

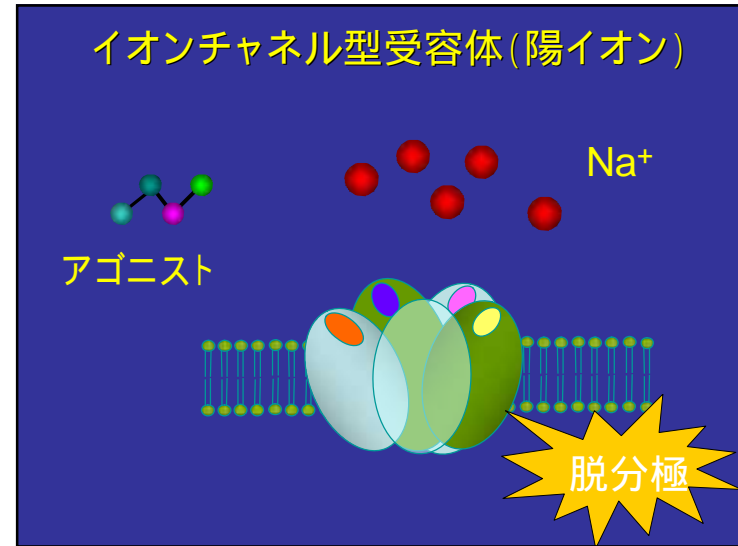
- イオンチャネル型
- Gタンパク質共役型
- 細胞増殖因子型



イオンチャネル内蔵型受容体

受容体	透過するイオン	機能
ニコチン性アセチルコリン受容体 (NM, NN)	Na ⁺	脱分極
グルタミン酸受容体 NMDA型 non-NMDA型	Ca ²⁺ Na ⁺ , K ⁺	脱分極
GABA _A 受容体	Cl ⁻	過分極
グリシン受容体	Cl ⁻	過分極

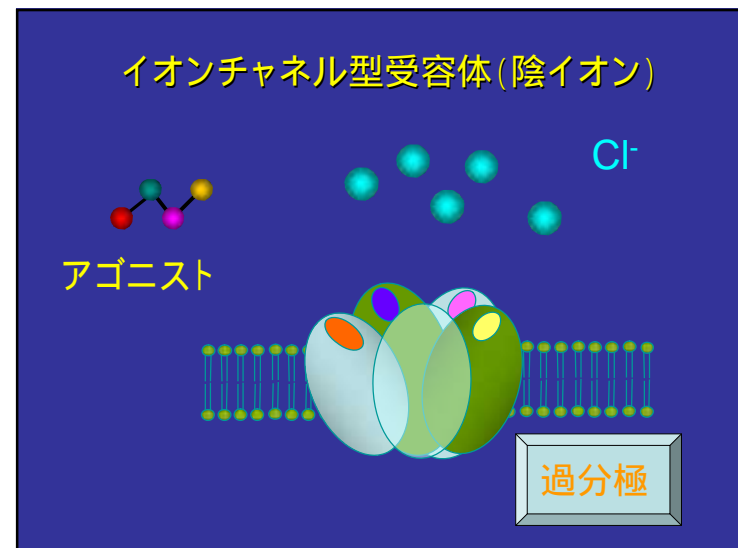
イオンチャネル型受容体 (陽イオン)

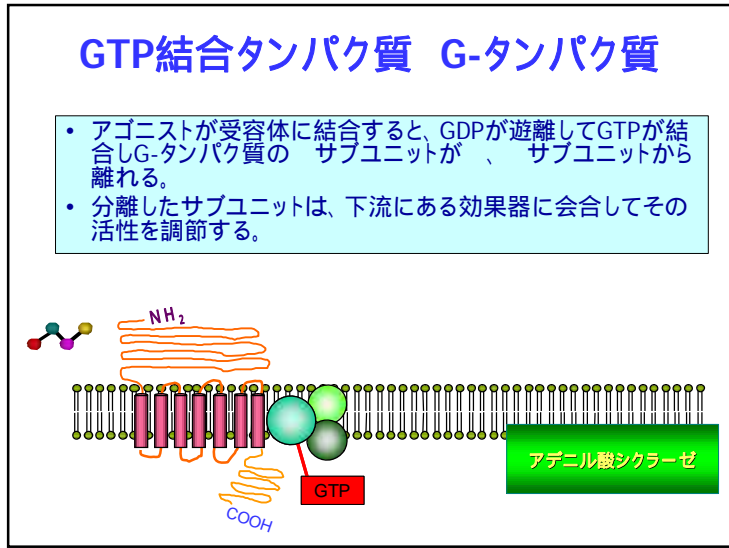
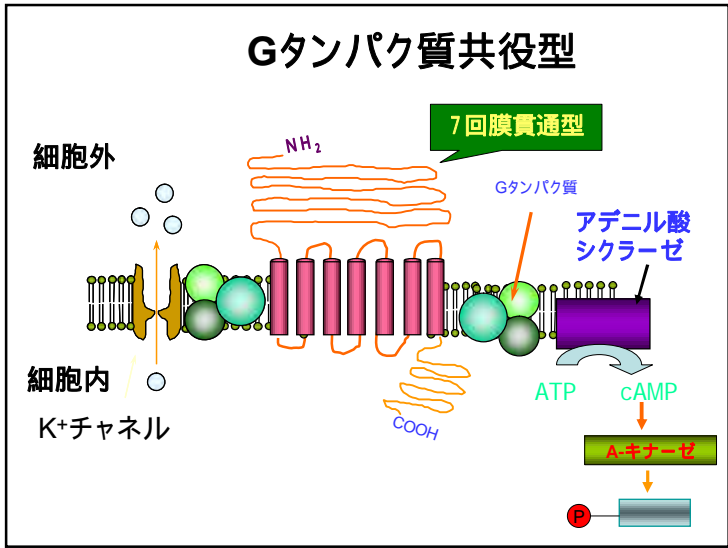
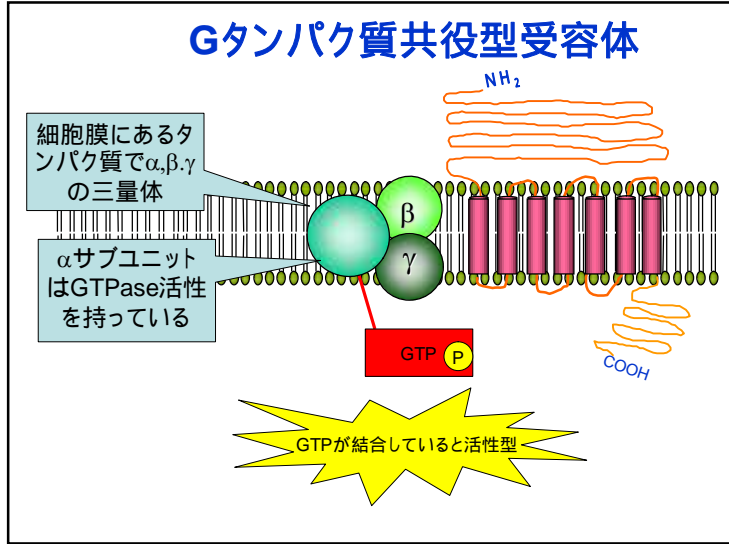
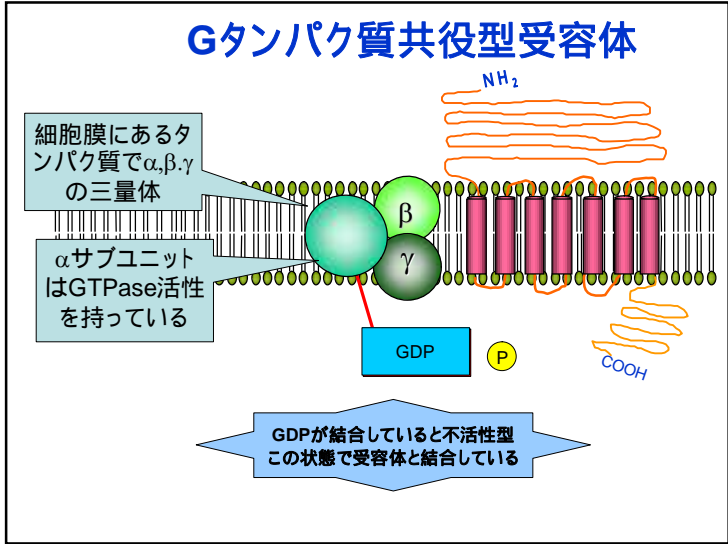


イオンチャネル内蔵型受容体

受容体	透過するイオン	機能
ニコチン性アセチルコリン受容体 (NM, NN)	Na ⁺	脱分極
グルタミン酸受容体 NMDA型 non-NMDA型	Ca ²⁺ Na ⁺ , K ⁺	脱分極
GABA _A 受容体	Cl ⁻	過分極
グリシン受容体	Cl ⁻	過分極

イオンチャネル型受容体 (陰イオン)





- アゴニストが受容体に結合すると、GDPが遊離してGTPが結合しG-タンパク質のαサブユニットがβγサブユニットから離れる。
- 分離したαサブユニットは、下流にある効果器に会合してその活性を調節する。

G-タンパク質の分類

Gs	コレラ毒素感受性	アデニル酸シクラーゼ	活性化
Gi	百日咳毒素感受性	アデニル酸シクラーゼ	抑制
Gq	毒素非感受性	ホスホリパーゼC	活性化

Gs と共役する受容体

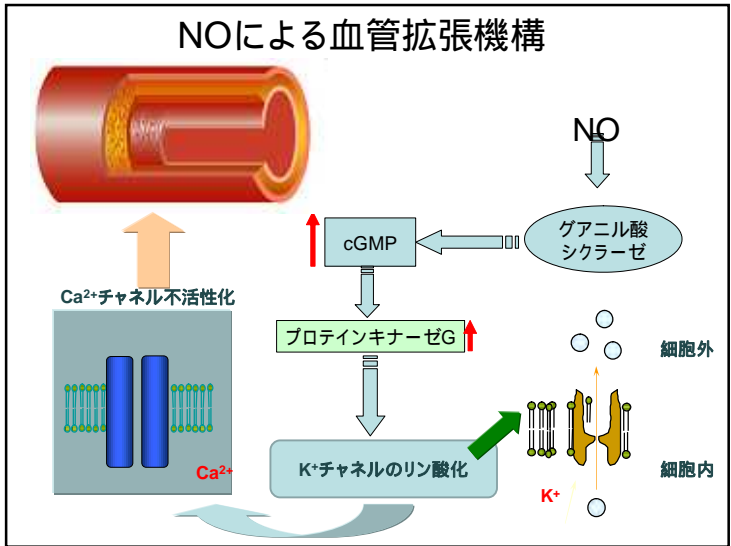
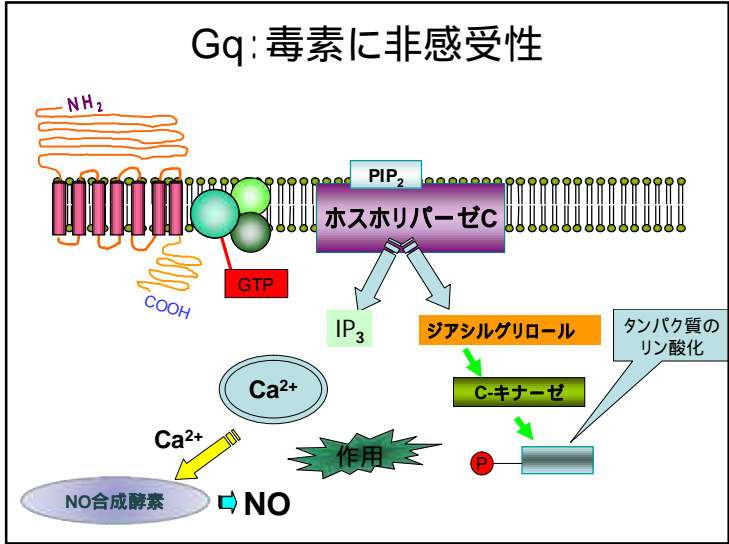
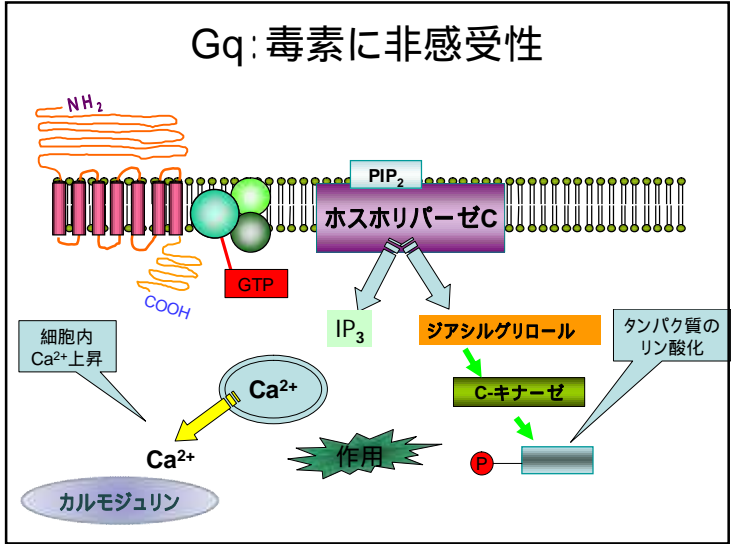
アドレナリン β ₁ 受容体 β ₂ 受容体	心収縮力増大 気管支拡張
ヒスタミン H ₂ 受容体	胃酸分泌抑制
ドパミン D ₁ 受容体	神経生理学的効果、運動 活性制御
グルカゴン受容体 TSH受容体	

Gi と共役する受容体

アドレナリン α ₂ 受容体	NE遊離抑制(シナプス前部)
ムスカリン性ACh M ₂ 受容体	心房のアデニル酸シクラーゼ抑制 (サブユニット)
ドパミン D ₂ 受容体	錐体外路調節 精神機能 プロラクチン遊離抑制
GABA _B 受容体	脊髄反射調節・抑制
セロトニン 5-HT ₁	1Aアゴニスト: 抗不安薬

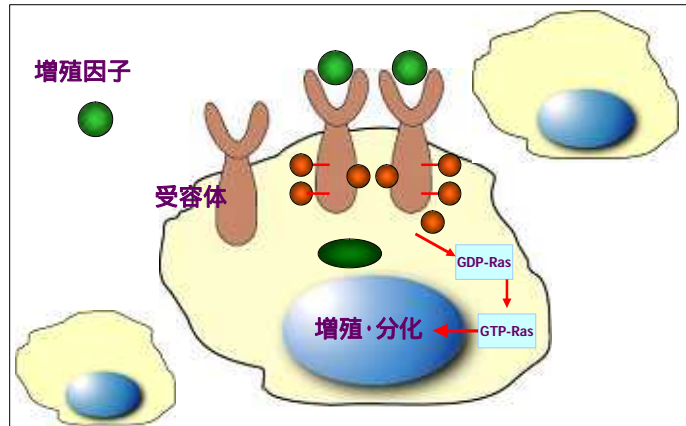
Gq と共役する受容体

アドレナリン α ₁ 受容体	血管平滑筋収縮
ムスカリン M ₁ , M ₃ 受容体	平滑筋収縮 腺分泌
ヒスタミン H ₁ 受容体	平滑筋収縮、アレルギー 中枢作用(覚醒、食欲、体温)
セロトニン 5-HT _{2A} , 2B, 2C アンジオテンシン (AT ₁)	中枢作用、平滑筋収縮、血小板 凝集(5-HT _{2A}) 血管収縮、アルドステロン分泌



- ### 一回膜貫通型受容体
- 1) チロシンキナーゼ関連受容体
 - 2) ナトリウム利尿ペプチド受容体 GC-A

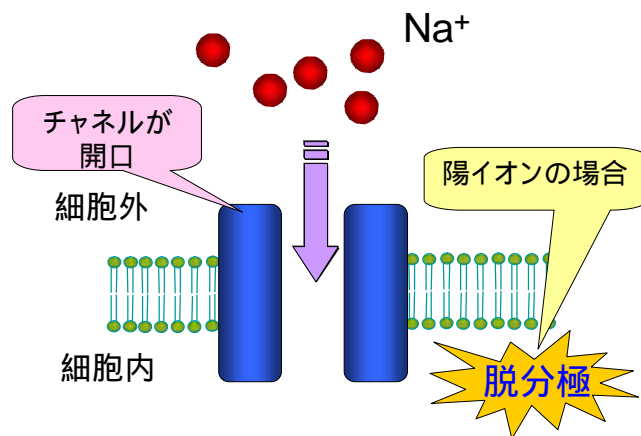
受容体型チロシンキナーゼの活性化機構



イオンチャネル

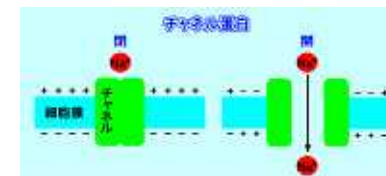
- 細胞内外の濃度イオン勾配を利用してイオンを輸送する機構。
- イオンチャネル型受容体
- 単独のイオンチャネル分子

イオンチャネル



Na⁺チャネル

- **電位依存性Na⁺チャネル**
神経インパルスの伝導において重要な役割を果たしている。局所麻酔薬の項参照
- **遠位尿細管・集合管Na⁺チャネル**
アルドステロン受容体の刺激で活性化(抗利尿)する。アミロライドやトリウムテレンは、この受容体機能を遮断し、利尿作用を引き起こす。



Ca²⁺チャネル

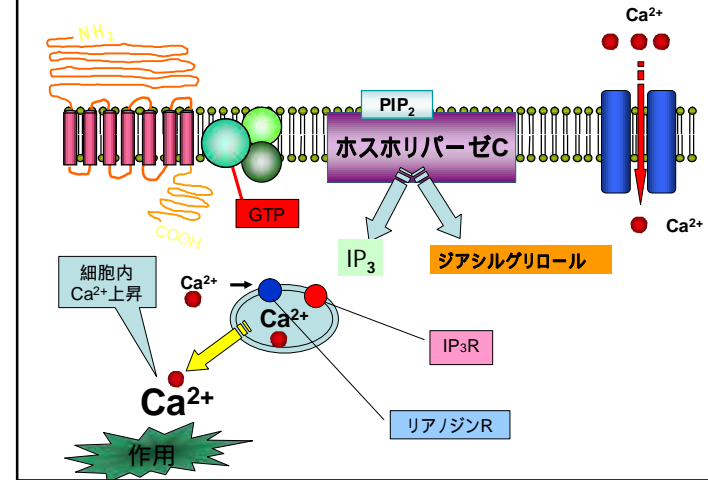
- 電位依存性Ca²⁺チャネル

カルシウムに選択性をもつチャネルで、細胞膜には電位依存性Ca²⁺チャネルが存在している。

- Ca²⁺放出チャネル

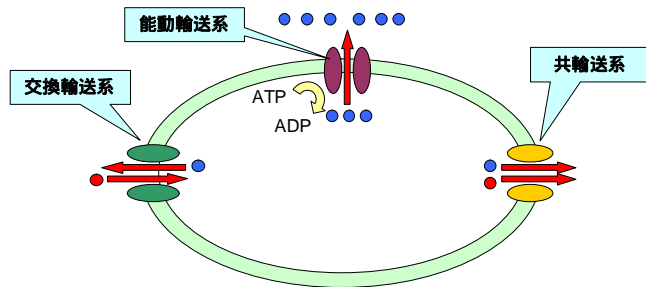
細胞内の小胞体に存在しており、小胞体からのCa²⁺放出に参与している。

Ca²⁺放出チャネル



イオントランスポーター

- イオン輸送系には能動輸送系、共輸送系、交換輸送系がある。これらの中には薬物の作用点として重要なものがある。



薬物の作用点としての酵素

- 受容体やトランスポーターだけではなく、種々の酵素に直接作用して薬理作用を発現する薬物がある。
- 酵素に直接作用する場合であっても、酵素の活性中心に作用する場合や、アロステリックな部位に作用する場合もある。

酵素	薬物	作用	作用機序	適用
コリンエステラーゼ	ネオスチグミン ドネペジル	阻害	AChの分解抑制	重症筋無力症 認知症
Na ⁺ , K ⁺ -ATPase	強心配糖体	阻害	細胞内Na ⁺ の上昇	うっ血性心不全
H ⁺ , K ⁺ -ATPase	オメプラゾール	阻害	胃酸分泌抑制	消化性潰瘍
シクロオキシゲナーゼ	NSAID	阻害	プロスタグランジン生成抑制	抗炎症・鎮痛
ホスホジエステラーゼ	アムリノン ベスナリノン	阻害	心筋でのcAMPの分解抑制	急性心不全
ホスホジエステラーゼ5	シルденаフィル ベルデナフィル	阻害	陰茎海綿体におけるcGMP分解抑制	勃起不全
-グルコシダーゼ	アカルボース ボグリボース	阻害	腸管での単糖類への分解抑制	糖尿病
チミジル酸合成酵素	5-フルオロウラシル	阻害	DNA合成に必要なチミン合成抑制	悪性腫瘍
炭酸脱水酵素	アセタゾラミド トルゾラミド	阻害	H ⁺ とCO ₂ の産生抑制によるNa ⁺ 輸送抑制	緑内障
HMG-CoAレダクターゼ	スタチン類	阻害	コレステロール合成阻害	高脂血症
グアニル酸シクラーゼ	ニトログリセリン イソソルビド	促進	NOを遊離し、NOが活性を増大	狭心症