

제 목	항 Histamine제의 H ₁ -Receptor와 Muscarinic Receptor에 대한 상대적 역가
연구자	이 신용* . 박 영주
소 속	영남대학교 약학대학
내 용	<p>항 Histamine제의 효과적인 응용과 그 개발을 위한 자료를 얻고자 이들 약물의 H₁-receptor와 muscarinic receptor에 대한 작용의 상대적 역가를 비교하였다. 본 실험에 이용된 기니픽 회장에는 [³H]QNB에 대한 단일 muscarinic receptor가 존재하였으며 [³H]QNB의 affinity와 결합부위농도는 각각 54 pM 및 156 fmol/mg 이었다.</p> <p>항 histamine제는 muscarinic receptor에 대한 [³H]QNB결합을 억제하였으며 [³H]QNB결합억제로 부터 추정된 항 histamine제의 K_i치가 0.008μM - 1.6μM로서 항 histamine제의 종류에 따라 현저한 차이가 있었고, 이 결과는 carbachol반응억제로 부터 추정된 각 항 histamine제의 muscarinic receptor에 대한 affinity(K_M)와 유사하였다. 한편 histamine수축반응 억제제로 부터 추정된 항 histamine제의 H₁-receptor에 대한 affinity(K_H) 역시 0.15nM - 56.5nM로서 약물에 따라 차이가 있었고 각 약물의 K_M/K_H비가 3 - 2300으로 H₁-receptor에 대한 역가와 muscarinic receptor에 대한 역가 사이에는 상관성이 없었다. 즉 유사한 항 allergy작용을 일으킬 수 있는 치료혈중농도에서도 muscarinic receptor차단작용이 다르며 본 실험에 사용한 13종의 기존 항 histamine제중 triprolidine이 K_M/K_H비가 가장 높았고 diphenidol이 가장 낮았다. 이상의 결과로 보아 항 histamine제의 muscarinic receptor차단작용은 이들 약물의 항 allergy효과에 필요한 작용이 아니며 본 실험에서 추정된 항 histamine제의 H₁-receptor와 muscarinic receptor에 대한 상대적 역가는 이들 약물의 선택과 평가에 중요한 지표가 될수 있을 것으로 생각된다.</p>