

Každý živý organismus neustále přijímá mnoho signálů, které musí vyhodnocovat a zvažovat, aby na ně mohl adekvátně reagovat. Aby bylo možné zajistit přesnou kontrolu homeostázy a komunikaci s okolním prostředím, jsou vnější signály rozpoznávány a převáděny na změny uvnitřbuněčných signálních drah. Tyto dráhy zprostředkovávají jak odpověď na extracelulární podněty, tak mezibuněčnou komunikaci.

Buněčná komunikace je zajišťována několika typy receptorů, které se nacházejí buď uvnitř buňky (včetně jaderných receptorů), kde ovlivňují transkripci genů, nebo na buněčné membráně. Receptory v buněčné membráně jsou transmembránové proteiny, které se podle své struktury a principu přenosu signálu dělí do tří hlavních superrodin: receptory spojené s iontovými kanály, receptory spojené s enzymy a receptory spojené s G-proteiny (GPCRs). Receptory spojené s G-proteiny tvoří největší rodinu membránových receptorů a zároveň patří k nejrozsáhlejším genovým rodinám vůbec. V savčím genomu je jejich kódování zajištěno přibližně 1 % genů.

Mnohé z těchto receptorů vážou senzoričké ligandy (například rodopsin, receptory pro chuť a čich), jiné rozpoznávají ionty, aminokyseliny, nukleotidy, peptidy nebo velké glykoproteiny (1). Hrají zásadní roli v širokém spektru fyziologických funkcí – od chemotaxe u kvasinek až po neurotransmisi u savců. Více než 50 % terapeutických látek na trhu působí právě prostřednictvím některého z GPCR receptorů. Není tedy překvapivé, že tyto receptory jsou intenzivně zkoumány.

Metabotropní glutamátový receptor 1 (mGluR1) hraje klíčovou roli v nervové signalizaci v několika oblastech mozku, které řídí pohyb, paměťové procesy a vyšší kortikální analytické funkce, a v neposlední řadě také přežití neuronů. Porucha signalizace zprostředkované mGluR1 může významně přispět k závažným neurologickým poruchám, nebo je dokonce přímo způsobit.