



Universiteit
Leiden
The Netherlands

Non-ribose ligands for the human adenosine A1 receptor

Klaase, E.C.

Citation

Klaase, E. C. (2008, June 10). *Non-ribose ligands for the human adenosine A1 receptor*. Retrieved from <https://hdl.handle.net/1887/12936>

Version: Corrected Publisher's Version

License: [Licence agreement concerning inclusion of doctoral thesis in the Institutional Repository of the University of Leiden](#)

Downloaded from: <https://hdl.handle.net/1887/12936>

Note: To cite this publication please use the final published version (if applicable).

STELLINGEN

behorende bij het proefschrift

Non-ribose Ligands for the Human Adenosine A₁ receptor

Affinities, activities, allosteric modulation & internalization

1. Hoewel de fusie eiwitten tussen de adenosine A₁R en de G_iα subunits al in de actieve staat zijn voor wat betreft agonist binding, weet de allosterische enhancer PD81,723 de affiniteit van agonisten voor de fusie eiwitten nog te vergroten. Dit is dus een additief effect, onafhankelijk van G-eiwit koppeling.
Dit proefschrift, met name hoofdstuk 3.
2. De aanwezigheid van de allosterische enhancer PD81,723 versnelt het internalisatie proces niet, echter, verlaagt wel de concentratie agonist waarbij internalisatie geïnduceerd wordt.
Dit proefschrift, met name hoofdstuk 4.
3. Het feit dat relatief kleine verschillen in de R-groepen van de non-ribose liganden leiden tot grote verschillen in affiniteit en effectiviteit, wijst erop dat deze liganden een interactie aangaan met een eng gedefiniëerde bindingsplaats van de receptor.
Dit proefschrift, met name hoofdstuk 5.
4. De nieuwe non-ribose agonisten hebben, in combinatie met de internalisatie experimenten, bewezen dat het concept 'collateral efficacy' óók voor de adenosine receptoren geldt.
Dit proefschrift, met name hoofdstuk 6.
5. Het is zeer uitzonderlijk maar wel verklaarbaar dat een agonist als radioligand in staat is om de gehele receptor populatie te labelen, daar dit normaalgesproken alleen is weggelegd voor antagonistische radioliganden.
Dit proefschrift, met name hoofdstuk 7.
6. Het inschatten van expressieniveaus van o.a. receptoren op basis van immunoblots leidt veelal tot een overschatting van de functionele expressieniveaus.
André S et al. (1998) J. Virol 72:1497-1503.
7. All you need is 'LUF'.
8. Een geheim, houd je het beste geheim, door geheim te houden dat het een geheim is. *JSK*
9. Het is wetenschappelijk onverklaarbaar waarom een kind dat slechts voor 50% uit jouw genetisch materiaal bestaat, toch voor 100% 'eigen' voelt.
10. Originaliteit en logica van kinderen is vaak groter dan die van volwassenen.

Elisabeth Klaasse

Leiden, 10 juni 2008