

CLASIFICACION DE RECEPTORES

FGB - UAH - 1999 (1/4)

	Agonista selectivo	Antagonista selectivo (pA ₂)	Efectores predominantes'	Orden potencia
ACETILCOLINA (MUSCARINICOS)	oxotremorina-M (respecto a N)			
M ₁	-	pirenzepina (8.0), telenzepina (9.1)	IP ₃ /DG	
M ₂	-	metoctramina (7.9), galamina (no compet.)	↓ AMPc, ↑ K'	
M ₃	-	p-fluoro-hexahidrosiladifenidol (7.8)	IP ₃ /DG	
M ₄	-	tropicamida (7.8)	↓ AMPc	
M ₅	-			
ACETILCOLINA (NICOTINICOS)				
Músculo	-	α-bungarotoxina (pseudoirreversible)	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺ , Ca ²⁺ (conductancia 35-50 pS; bloqueados por decametonio, gallamina)	
Neurona (ganglionar)	-	neosurugatoxina	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺ , Ca ²⁺ (conductancia 15-55 pS; bloqueados por hexametonio, mecamilamina)	
Neurona (SNC)	-	neosurugatoxina	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺ , Ca ²⁺ (bloqueados por hexametonio, mecamilamina)	
neuronal α7	-	α-bungarotoxina (pseudoirreversible), metillicaconitina	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺ , Ca ²⁺ (alta permeabilidad a Ca ²⁺)	
ADENOSINA (Purinoceptores P ₁)				
A ₁	N ⁶ -ciclopentiladenosina	DPCPX (8.3-9.3), 8-ciclo- pentilteofilina (7.4)	↓ AMPc, ↑ K', ↓ Ca ²⁺	
A _{2A}	CGS-21680, PAPA-APEC	CP-66713 (7.7), KF-17837 (K _s ~ 8 nM)	↑ AMPc	
A _{2B}	-	-	↑ AMPc	
A ₃	APNEA, 2-Cl-IB-MECA	I-ABOPX (8.1)	↓ AMPc	
ADRENOCEPTORES				
α _{1A}	A61603, SDZNV1085	KMD3213(10.4), (+)niguldipina (10.0)	IP ₃ /DG	NA ≥ adrenalina
α _{1B}	-	espiperona (8.9), cloroetilclonidina (irrev.)	IP ₃ /DG	adrenalina = NA
α _{1C}	-	BM7378 (8.4)	IP ₃ /DG	adrenalina = NA
α _{2A}	oximetazolina (ag.parc. débil)	-	↓ AMPc, ↑ K', ↓ Ca ²⁺	adrenalina ≥ NA
α _{2B}	-	prazosina (7.5), ARC239 (8.0)	↓ AMPc, ↓ Ca ²⁺	adrenalina ≥ NA
α _{2C}	-	prazosina (7.5), ARC239 (8.0)	↓ AMPc	adrenalina ≥ NA
β ₁	NA, xamoterol	CGP20712A (8.5-9.3), atenolol (7.0)	↑ AMPc	NA ≥ adrenalina
β ₂	procaterol	ICI118551 (8.3-9.2), butoxamina (6.2), α-metilpropranolol (8.5)	↑ AMPc	adrenalina > NA
β ₃	BRL37344, CGP12177A	bupranolol (7.3)	↑ AMPc	NA > adrenalina
DOPAMINA				
D ₁ (=D _{1A})	SKF38393	SKF83566, SCH23390	↑ AMPc	
D ₂ (=D _{2A})	N0437, fenoldopam	(-)sulpirida, domperidona, haloperidol	↓ AMPc, ↑ K', ↓ Ca ²⁺	
D ₃ (=D _{2B})	bromocriptina	-	↓ Ca ²⁺	
D ₄ (=D _{2C})	-	-	↓ AMPc	
D ₅ (=D _{1B})	-	-	↑ AMPc	

		Agonista selectivo	Antagonista selectivo (pA ₂)	Efectores predominantes	Orden potencia
GABA					
	GABA _A (sitio competitivo)	isoguvacina, muscimol	bicuculina (6.0)	canal de Cl ⁻ intrínseco al receptor modula canal Cl ⁻ controlado por GABA _A	
	GABA _A (sitio modulador BDZ)	flunitrazepam, zolpidem DMCM y Ro194603 = ag. inversos	flumazenilo, ZK93426		
	GABA _B	L-baclofeno, ácido 3-amino- propilfosfínico	CGP35348 (5.0), 2-hidroxi-S-(-)-saclofeno	↓ AMPc, ↑ K ⁺ , ↓ Ca ²⁺	
HISTAMINA					
	H ₁	2-(m-fluorofenil)histamina (agonista parcial)	mepiramina (9.1), triprolidina (9.9)		IP ₃ /DG
	H ₂	dimaprit, impromidina (también antagonista H ₁), amtamina	ranitidina (7.2), tiotidina (7.8)	↑ AMPc	
	H ₃	R-α-metilhistamina, imetit, immepip	tioperamida (8.4), iodofenpropit (9.6) clobenpropit (9.9)	-	
OPIOIDES					
	μ	sufentanilo, DAMGO, PL017	CTOP (K _i 0.18 nM)	↓ AMPc, ↑ K ⁺ , ↓ Ca ²⁺	β-end > dinA > met > leu
	δ	DPDPE, DSBULET [D Ala ²]deltorfina I o II	Naltrindol (9.7), TIPP (8.8)	↓ AMPc, ↑ K ⁺ , ↓ Ca ²⁺	met = leu = β-end > dinA
	κ	U69593, ICI197067, CI977	Nor-binaltorfimina (10.3)	↓ AMPc, ↑ K ⁺ , ↓ Ca ²⁺	dinA >> β-end > leu = met
PROSTANOIDES [Ligandos endógenos = PGD ₂ (D), PGE ₂ (E), PGF _{2α} (F), PGH ₂ (H), PGI ₂ (I), TXA ₂ (T)]					
	DP	BW2456, ZK110841	BWA868C (9.3)	↑ AMPc	D >> E,F,I,T
	FP	fluprostenol, latanoprost	-	IP ₃ /DG	F > D > E > I,T
	IP	cicaprost	-	↑ AMPc	I >> D,E,F > T
	TP	U46619, STA ₂ , I-BOP	GR32191 (8.0-8.8), SQ29548 (8.8)	IP ₃ /DG	T = H >> D,E,F,I
	EP ₁	iloprost, 17-fenil-ω-trinor-PGE ₂	SC19220 (5.6)	IP ₃ /DG	E > F,I > D,T
	EP ₂	butaprost, AH13205	-	↑ AMPc	E > F,I > D,T
	EP ₃	sulprostona, GR639799, SC46275	-	↓ AMPc, IP ₃ /DG	E > F,I > D,T
	EP ₄	-	AH23848 (5.4)	↑ AMPc	E > F,I > D,T
SEROTONINA					
	5-HT _{1A}	8-hidroxi-2-(di-n-propilamino)- tetralina (8-OH-DPAT)	WAY100635 (8.7)	↓ AMPc, ↑ K ⁺	
	5-HT _{1B}	-	GR55562 (7.4)	↓ AMPc	
	5-HT _{1D}	-	-	↓ AMPc	
	5-HT _{1E}	-	-	↓ AMPc	
	5-HT _{1F}	-	-	↓ AMPc	
	5-HT _{2A}	α-metil-5-HT	ketanserina (8.5-9.5), MDL100907 (9.4)	IP ₃ /DG	
	5-HT _{2B}	α-metil-5-HT, BW723C86	SB200646 (7.5), SB204741 (7.8)	IP ₃ /DG	
	5-HT _{2C} (antes 5-HT _{1C})	α-metil-5-HT	mesulergina (9.1)	IP ₃ /DG	
	5-HT ₃	2-metil-5-HT, m-cloro- fenil-biguanida	ondansetróna (8-10), granisetróna (10), tropisetróna (10-11)	canales catiónicos intrínsecos al R	
	5-HT ₄	BIMU8, RS67506	GR113808 (9-9.5), SB204070 (10.8)	↑ AMPc	
	5-HT _{5A}	-	-	-	
	5-HT _{5B}	-	-	-	
	5-HT ₆	-	-	↑ AMPc	
	5-HT ₇	-	-	↑ AMPc	

	Agonista selectivo	Antagonista selectivo (pA ₂)	Efectores predominantes [*]	Orden potencia
AMINOACIDOS EXCITATORIOS				
ionotropos				
	NMDA (sitio competitivo)	NMDA, D,L(tetrazol-5-il)glicina	D-AP5 (5.2-5.9), CGS19755 (6.0)	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺ , Ca ²⁺ (bloq. por fenciclidina y dizocilpina) para su activación es necesario que la glicina ocupe su sitio de unión
	NMDA (sitio modulador)	glicina, HA966 (ag.parcial) serina	5,7-diclorokinurenato, MNQX, L689560	
	AMPA	AMPA, 5-fluoro-willardiína	NBQX (7.1), GYKI52466 (no compet.)	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺
	kainato	kainato, domoato	NS102	canales intrínsecos de Na ⁺ , K ⁺
metabotropos				
mGlu ₁	3,5,dihidrofenilglicina (DHPG)	4CPG, MCPG	IP ₃ /DG	
mGlu ₂	DCG-IV	MCCG, MCPG	↓ AMPc	
mGlu ₃	DCG-IV	MCCG	↓ AMPc	
mGlu ₄	L-AP4	MAP4	↓ AMPc	
mGlu ₅	DHPG	4CPG	IP ₃ /DG	
mGlu ₆	L-AP4	MAP4	↓ AMPc	
mGlu ₇	L-AP4	MAP4	↓ AMPc	
mGlu ₈	L-AP4	-	↓ AMPc	
PURINOCEPTORES P₂				
ionotrópicos				
P _{2T}	2-metiltio ADP	FPL66096 (8.7), 2-Cl-ATP (5.2)	canal catiónico intrínseco	ADP
P _{2X}	α,β-metilenoATP, β,γ-metileno-L-ATP	suramina (5.0)	canal catiónico intrínseco	ATP > ADP > AMP
P _{2Z}	3'-O-benzoilbenzoilATP	-	canal catiónico intrínseco	ATP
acoplados a proteínas G				
P _{2U}	UTP-γ-S	-	IP ₃ /DG	UTP ≥ ATP > ADP > AMP
P _{2Y}	2-metiltioADP, ADPβF, ADPβS	suramina (5.0)	IP ₃ /DG	ATP = ADP > AMP

Además: angiotensina, bombesina, bradiquinina, cannabinoide, colecistoquinina, endotelina, galamina, gastrina, glicina, leucotrienos, melatonina, neuropéptido Y, neurotensina, PAF, péptido natriurético auricular, purinoceptores P₂ (ATP,ADP,AMP,UTP), quimioquina (IL8) α y β, somatostatina, taquikinina, vasopresina y oxitocina, VIP, etc.

Véanse: **TiPS Receptor Nomenclature Supplements 1993, 1994, 1995, 1996, 1997, 1998, y siguientes.**

^{*} La modificación de los niveles intracelulares de segundos mensajeros está relacionada, bien con la modulación de la apertura de canales iónicos intrínsecos al receptor, bien con una actividad guanilato ciclasa intrínseca al receptor, o bien con la activación de sistemas enzimáticos por parte de otras proteínas que funcionan acopladas al receptor, como son las distintas familias de proteínas G: G_s (↑ AMPc), G_{i/o} (↓ AMPc, ↑ K⁺, ↓ Ca²⁺) y G_{q/11} (metabolismo de fosfoinosítidos).

	Tipo	Conductancia	Bloqueantes	Localización/función
CALCIO				
- activados por alto voltaje inactivación lenta	L	25 pS	dihidropiridinas antagonistas (e.g. nifedipino), fenilalquilaminas (e.g. diltiazem), benzotiazepinas (e.g. verapamilo) <u>toxina:</u> calciseptina	acoplamiento excitación-contracción acoplamiento excitación secreción
vel. inactivación moderada	N	12-20 pS	<u>toxinas:</u> ω -conotoxinas (GVIA)	identificados sólo en neuronas; liberación neurotransmisores
- activados por voltaje moderado no se inactivan	P	10-12 pS	<u>toxinas:</u> FTX, ω -agatoxina IVa	células Purkinje y otras neuronas SNC
- activados por bajo voltaje inactivación lenta	T	8 pS	octanol, flunarizina (no selectivos)	activación marcapasos SA corazón
POTASIO				
- dependientes de voltaje	K_v	5-60 pS	margatoxina, Zn^{2+} , forskolina, faloidina anestésicos locales, 9-aminoacridina	
	K_{VR}	?	Dofetilida, sotalol, quinidina	
	K_A	<1-20 pS	fenciclidina, quinidina, dendrotoxina	
	K_{VR}^*	?	LY97241, NE10118	
	K_{TR}	5-30 pS	Sr^{2+} , TEA, Cs^+ , Ba^{2+} , pero no Zn^{2+} ó 4AP.	
	K_{SR}	180 pS	decametonio, hexametonio, Cs^+ , 4AP, TEA (débil)	
- dependientes de Ca^{2+}	BK_{Ca}	100-250 pS	tubocurarina, penitrem-A	
	IK_{Ca}	18-50 pS	nitrendipina, clotrimazol, antagonistas de calmodulina (pimozida, haloperidol, trifluoperazina)	
	SK_{Ca}	6-14 pS	quinina, mepacrina	
- acoplados a receptores	K_M	5-18 pS	W7, Ba^{2+}	
	K_{ACh}	7-50 pS	Cs^+ , Ba^{2+} , 4AP, TEA, quinina	
	K_{S-HT}	55 pS	Ba^{2+} , TEA (débil), 4AP (débil), Cs^+ (bloq. parcial)	
- otros				
sensibles a ATP	K_{ATP}	5-90 pS	sulfonilureas, lidocaína, fentolamina	
activados por Na^+	K_{Na}	220 pS	TEA (~20 mM), 4AP (~4 mM)	
sensibles al volumen celular	K_{Vol}	16-40 pS	quinidina, lidocaína, cetiedilo, gadolinium	
SODIO				
	I	-	tetrodotoxina, saxitoxina	
	II	20 pS	tetrodotoxina, saxitoxina	
	III	16 pS	tetrodotoxina, saxitoxina	
	$\mu 1$	-	tetrodotoxina, μ -conotoxina	
	h1	-	tetrodotoxina, saxitoxina (200 veces < afinidad que otros canales Na)	