

Receptor bindingsprofielen van antipsychotica

Receptoren die waarschijnlijk betrokken zijn bij klinisch relevante effecten staan vermeld. Het receptor systeem waaraan het sterkst wordt gebonden, staat voorop.

	Antagonist	Agonist
Amisulpride	D2/D3 (P?*)	D2/D3 (P?*)
Aripiprazol	5HT2a, 5HT2c	D2 (P), 5HT1a (P)
Broomperidol	D2, ?	
Chloorprotixeen	D2, ?	
Clozapine	Alfa1, M1, H1 5HT2a, 5HT2c, 5HT7, D2	
Flufenazine	D2, D1	
Flupentixol	D2, H1	
Haloperidol	D3, D2, D4	
Lurasidon	5HT7, D2	5HT1a (P)
Olanzapine	5HT2a, H1, D2, 5HT7, 5HT2c, M1	
Paliperidon	5HT2a, 5HT7, D2, 5HT2c	(5HT1a)
Penfuridol	D2, ?	
Perfenazine	D3, D2, 5HT2a	
Pimozide	D2, D3, 5HT7, D4	
Pipampiron	5HT2a, D4, D2	
Quetiapine	H1, alfa1, 2HT2a, 5HT7, D3, D2, M1,	5HT1a (P)
Risperidon	5HT2a, D2, alfa1, 5HT2c	
Sulpiride	D2/D3 (P?*)	D2/D3 (P?*)
Zuclopentixol	D2, D1, 5HT2a, 5HT2c	
? Bij langer beschikbare middelen is vaak geen gedetailleerd receptor profiel onderzocht of beschikbaar. 5HT = serotonerg Alfa = adrenerg D = dopaminerg H = histaminerg M = cholinerg (P) = partiële agonist (P?*) amisulpride en sulpiride zijn mogelijk vooral partiële agonisten op receptoren op het cellichaam (autoreceptoren). © Rikus Knegtering 2016		

Bronnen

- Sumiyoshi T. Possible Dose-Side Effect Relationship of Antipsychotic Drugs: Relevance to Cognitive Function in Schizophrenia. *Expert Rev Clin Pharmacol.* 2008;1(6):791-802.
- Murasaki M, Nishikawa H, Ishibashi T. Dopamine-serotonin antagonist: receptor binding profile of a novel antipsychotic blonanserin. *Jpn. J. Clin. Psychopharmacol.* 11,845–854 (2008).
- Goldstein JM. Atypical antipsychotic drugs: beyond acute psychosis, new directions. *Expert Opin. Emerg. Drugs* 4(1),127–151 (1999).
- Lako IM, van den Heuvel ER, Knegtering H, Bruggeman R, Taxis K. Estimating dopamine D₂ receptor occupancy for doses of 8 antipsychotics: a meta-analysis. *J Clin Psychopharmacol.* Oct;33(5):675-81. (2013).
- Stahl S.M. Antipsychotic agents. In: *Stahl's Essential Psychopharmacology*, 4th Edition. Chapter 5. (2013)

Aangrijpingspunten van psychofarmaca en daarmee samenhangende klinische effecten

Effecten op neurotransmitter of receptor	Mechanisme	Mogelijke klinische effecten
Dopaminerg D ₂	Partieel agonism	antipsychotisch, prolactine verlaging, antidepressief(?), toename seksueel verlangen(?)
	Antagonisme	antipsychotisch, rustgevend, anti-manisch, anti-agressief, remming seksueel verlangen en gedrag, bewegingsstoornissen (EPS), prolactine verhoging, vervlakking gevoelsleven.
Dopaminerg D ₃	Antagonisme	verbetering cognitie(?), antipsychotisch effect(?), vermindering negatieve symptomen zoals initiatiefverlies (?)
Serotonerg 5HT _{1A}	Agonisme of partieel agonisme (presynaptisch)	antidepressief, anxiolytisch (angst remmend), verbeteren cognitie, afname seksuele remming.
	Antagonisme	Anxiolytisch
Serotonerg 5HT _{2A}	Antagonisme of inverse agonisme	antidepressief, vermindering bewegingsstoornissen bij toediening van een D2 antagonist
Serotonerg 5HT _{2C}	Antagonisme	verbetering cognitie?, eetlust toename, gewichtstoename.
Serotonerg 5-HT ₇	Antagonisme	antidepressief, verbetering cognitie(?)
Histaminerg H ₁	Antagonisme	sedatie (slaperigheid), vermindering allergische reacties, eetlust en gewichtstoename.
Histaminerg H ₃	Antagonisme of inverse agonisme	antipsychotisch effect(?), cognitie verbetering(?)
Noradrenaline	Antagonisme (beta blokkers)	vermindering angst, bloeddrukdaling.
Adrenaline (epinephrine)	Antagonisme (beta blokkers)	vermindering angst, bloeddrukdaling.
Adrenerg α ₁	Antagonisme	verwijding bloedvaten, bloeddruk daling, orthostatische hypotensie, verhoging hartfrequentie.
Adrenerg α ₂	Agonisme	cognitie verbetering(?), sedatie, vermindering pijngevoel
	Antagonisme	antidepressief, toename alertheid, toename bloeddruk
Cholinerg M ₁	Partieel agonisme	antipsychotisch effect(?), verbetering cognitie(?)
	Antagonisme	vermindering bewegingsstoornissen bij D2 antagonisme, droge mond, accommodatieproblemen (minder scherp van dichtbij zien), urine retentie (moeite met plassen), obstipatie (trage stoelgang)
EPS=extrapiramidale bijwerkingen. (?) bestaat discussie over in wetenschappelijke literatuur		
© Rikus Knegtering 2016		