

# Rezeptorbindungsprofile der Antipsychotika

Farben sind relativ zur Wirkung und Verfügbarkeit

Medikament	D2 VIVO	D2	D3	D4		D1	D5		5-HT1A	5-HT2A	5-HT2C	5-HT7		M1	H1	Alpha-1	nAChR α7	Sigma-1	Anmerkungen
Wirkung	AP	Antipsychotisch	Emotionen, Motivation	Therapieresistenz		Kognitiv	Lern-, Gedächtnis		Angst, Depression	Wirkverstärker, Wahrnehmung	Appetit, Stimmung, Angst	Schlaf, Kog., Circadian		Anticholinerge	Sedierung, Gewichts	Schwindel, erhöhter Herzschlag	Kog., Neuroprotektion	Schmerz, Stimmung	
Aripiprazol	85-95%	9,5 (PA)	8,8 (PA)	8,2		6,7	7,0		8,7 (PA)	8,5	7,5	7,3		6,0	6,4	7,3	5,5	6,8	Partialagonist an D <sub>2</sub> /D <sub>3</sub> und 5-HT <sub>1A</sub> ; stabilisiert Dopamin
Brexipiprazol	80-90%	9,1 (PA)	8,6 (PA)	8,0		6,4	6,5		8,6 (PA)	9,1	7,8	7,0		5,8	6,2	7,0	5,2	6,5	Ähnlich wie Aripiprazol, höhere Affinität zu 5-HT <sub>2A</sub>
Cariprazin	70-85%	8,7 (PA)	9,9 (PA)	7,5		5,9	6,0		7,9 (PA)	8,2	6,8	6,5		5,5	5,9	6,8	5,0	6,2	Hohe D <sub>3</sub> -Affinität, wirkt auf Negativsymptome
Ziprasidon	65-75%	8,5	7,6	7,2		7,1	7,3		7,5 (PA)	9,0	8,0	8,2		6,0	7,2	7,9	5,8	6,4	Partieller Agonist an 5-HT1A und NET-Wiederaufnahmehemmer
Lurasidon	70-85%	8,7	7,9	6,7		6,7	6,1		6,7 (PA)	9,2	7,5	8,1		5,4	6,1	8,0	4,7	6,0	Wirkt auf 5-HT <sub>7</sub> -Rezeptoren, geringes metabolisches Risiko
Risperidon	70-80%	8,6	7,9	7,7		7,4	7,3		6,8	9,4	8,0	6,9		5,5	6,8	8,2	4,8	6,3	Stark D <sub>2</sub> - und 5-HT <sub>2A</sub> -wirksam
Paliperidon	70-80%	8,5	7,8	7,6		7,1	7,1		6,5	9,3	7,9	6,8		5,2	6,5	8,0	4,5	6,0	Hauptmetabolit von Risperidon
Sertindol	70-80%	8,8	7,6	7,0		6,6	6,7		6,4	9,3	7,6	6,9		5,5	6,0	8,5	4,6	6,2	Kann QT-Intervall verlängern
Quetiapin	30-50%	7,3	6,7	6,5		6,8	6,9		7,3 (PA)	7,7	7,1	6,7		7,5	8,5	7,6	6,0	6,5	Partieller Agonist an 5-HT1A; Sedierend
Olanzapin	60-80%	8,9	7,5	7,2		7,8	7,6		7,5	8,9	8,1	7,2		7,4	8,7	7,8	6,1	6,7	Breites Rezeptorprofil, Gewichtszunahme möglich
Clozapin	40-60%	7,6	7,5	8,4		7,2	7,2		8,0	9,0	8,2	7,5		8,3	9,0	8,0	6,5	7,5	Wirksam bei Therapieresistenz, Agranulozytose-Risiko
Amisulprid	85-90%	9,3	8,7	5,6		5,1	5,3		6,0	6,1	5,8	5,5		5,0	5,6	6,2	4,5	5,8	Selektiv für D <sub>2</sub> /D <sub>3</sub> , wirkt auf Negativsymptome
Haloperidol	>90%	9,5	8,2	7,0		5,0	5,2		5,0	7,9	6,0	6,2		5,1	5,3	7,2	5,0	8,2	Hohes EPS-Risiko, typisches Antipsychotikum
Flupentixol	80-90%	9,0	7,9	6,2		6,1	5,6		5,8	8,0	6,4	6,0		5,3	6,2	7,5	5,0	6,0	Aktivierend, höheres EPS-Risiko

## Legende zur Tabelle:

### Hinweise:

**pKi-Wert:** Ein höherer pKi-Wert weist auf eine stärkere Affinität des Wirkstoffs zum jeweiligen Rezeptor hin.

**(PA):** Bedeutet, dass der Wirkstoff als **partieller Agonist** an diesem Rezeptor wirkt.

**Anmerkungen:** Wichtige Hinweise zur Wirkweise oder besonderen Eigenschaften des Medikaments.

### Dopaminrezeptoren (D1-D5):

**D2 VIVO:** Reale D2-Rezeptorbelegung im lebenden Organismus; zeigt, wie stark D2 in vivo blockiert wird – entscheidend für Antipsychosetext & EPS.

**D2:** Dopamin-D2-Rezeptor, primäres Ziel antipsychotischer Medikation; Blockade reduziert Psychosen, birgt aber EPS-Risiko.

**D3:** Dopamin-D3-Rezeptor, vorwiegend im limbischen System; reguliert Emotionen, Belohnung und beeinflusst negative Symptome sowie Sucht.

**D4:** Dopamin-D4-Rezeptor, involviert in exekutive Funktionen und Aufmerksamkeit; Ziel bei therapieresistenten Psychosesymptomen, z. B. mit Clozapin.

**D1:** Dopamin-D1-Rezeptor, fördert kognitive Prozesse, Lernen und Arbeitsgedächtnis; meist weniger blockiert, um kognitive Defizite zu vermeiden.

**D5:** Dopamin-D5-Rezeptor, unterstützt Lernprozesse und neuronale Plastizität; seine Rolle ergänzt D1, klinisch ist sie weniger klar definiert.

### Serotoninrezeptoren (5-HT):

**5-HT1A:** Serotonin-1A-Rezeptor, als Autorezeptor & postsynaptisch aktiv; reguliert Stimmung, Angst und den Hormonhaushalt – Ziel von Partialagonisten.

**5-HT2A:** Serotonin-2A-Rezeptor, steuert Wahrnehmung, Kognition und Emotion; Blockade mildert Psychosen und senkt das EPS-Risiko.

**5-HT2C:** Serotonin-2C-Rezeptor, reguliert Appetit, Angst und Stoffwechsel; Blockade kann zu Gewichtszunahme und metabolischen Nebenwirkungen führen.

**5-HT7:** Serotonin-7-Rezeptor, verantwortlich für circadiane Rhythmen, Schlaf und Stimmung; Blockade stabilisiert den Schlaf-Wach-Zyklus.

**M1:** Muskarinischer M1-Rezeptor, zentral für Gedächtnis, Lernen und Aufmerksamkeit; Blockade führt zu anticholinergen Nebenwirkungen.

**H1:** Histamin-H1-Rezeptor, reguliert Schlaf, Appetit und allergische Reaktionen; Blockade bewirkt Sedierung und oft Gewichtszunahme.

**Alpha-1:** Alpha-1-Adrenozeptor, steuert Blutdruck und Gefäßtonus; Blockade kann Schwindel und orthostatische Hypotonie auslösen.

**nAChR α7:** Nikotinerger Acetylcholinrezeptor α7, wichtig für Kognition, Lernen und Gedächtnis; potenzielles Target für neuroprotektive Therapien.

**Sigma-1:** Sigma-1-Rezeptor, moduliert neuronale Signalwege, Stress und Neuroprotektion; Ziel neuartiger Ansätze in der Neuropsychiatrie.

## Anmerkungen

**Rezeptorprofil und klinische Relevanz:** Das Wirkprofil und die Nebenwirkungen eines Antipsychotikums resultieren aus seiner spezifischen Affinität zu diesen Rezeptoren.

Eine hohe D2-VIVO-Besetzung (und damit D2-Blockade) korreliert beispielsweise mit antipsychotischer Wirksamkeit, birgt aber auch das Risiko von extrapyramidalen Symptomen.

**Balance zwischen Dopamin- und Serotoninwirkungen:** Atypische Antipsychotika kombinieren oft D2-Blockade mit 5-HT2A-Antagonismus, um psychotische Symptome zu reduzieren und gleichzeitig motorische Nebenwirkungen zu minimieren.