

Doc. MUDr. **Martin Anders**, PhD.

Psychiatrická klinika 1. LF UK a
VFN



PSYCHOFARMAKOLOGIE

Hlavní skupiny psychofarmak

- antipsychotika
- antidepresiva
- anxiolytika
- hypnotika
- nootropika
- kognitiva
- psychostimulancia

Přehled antipsychotik

konvenční antipsychotika - bazální

<i>Chem. skupina</i>	<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Dávka (mg)</i>
fenothiaziny	chlorpromazin	CHLORPROMAZIN, LARGACTIL, PLEGOMAZIN, MEGAPHEN, THORAZIN	200-800
	levomepromazin	TISERCIN, NOZINAN	50-400
	thioridazin	THIORIDAZIN, MELLERIL	100-600
	periciazin	NEULEPTIL	10-40
thioxanteny	chlorprothixen	CHLORPROTHIXEN, TRUXAL	100-600
	clopenthixol	CISORDINOL, CLOPIXOL	20-100

Přehled antipsychotik

konvenční antipsychotika - incizivní

<i>Chem. skupina</i>	<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Dávka (mg)</i>
fenothiaziny	perfenazin	PERFENAZIN, TRILAFON, PERATSIN	16-24
	prochlorperazin	PROCHLORPERAZIN, STEMETIL	20-80
	flufenazin	MODITEN	2-16
	trifluoperazin	STELAZIN	10-50
thioxanteny	flupenthixol	FLUANXOL	6-18
butyrofenony	haloperidol	HALOPERIDOL, HALDOL, APO-HALOPERIDOL	2,5-10
	melperon	BURONIL	50-300
difenylbutyl-piperidiny	pimozid	ORAP	2-10
	fluspirilen	IMAP	2-10
	penfluridol	SEMAP	2-60
perathiepiny	oxyprothepin	MECLOPIN	5-20

Antipsychotics of the 2nd Generation

<i>generic name</i>	<i>trade mark</i>	<i>doses (mg)</i>
D2, D3 selective antagonist		
sulpirid	DOGMATIL, PROSULPIN	50-1200
amisulprid	SOLIAN, DENIBAN	50-1200
SDA		
risperidon	RISPERDAL, RISPEN, RISPERDAL QUICKLET	4-8
ziprasidon	ZELDOX	40-160
sertindol	SERDOLECT	12-20
MARTA		
clozapin	LEPONEX	200-600
olanzapin	ZYPREXA i.m. inj. 10 mg	5-20
quetiapin	SEROQUEL	300-600
zotepin	ZOLEPTIL	75-300

Antipsychotics of the 2nd Generation

Efficacy

1. Positive symptoms are influenced significantly better than placebo, and equally or more then by the classical antidopaminergic neuroleptics.
2. Negative symptoms are reduced significantly better than by placebo or classical antidopaminergic neuroleptics.
3. Affective symptoms are influenced better than by placebo or classical antidopaminergic neuroleptics.
4. They significantly reduce or prevent the cognitive impairment. The reduction is higher in comparison to classical antidopaminergic neuroleptics.
5. The treatment resistant patients with schizophrenia are improved significantly better than by placebo and at least equally as by clozapine.
6. Maintenance treatment is more effective than maintenance on placebo and at least as effective as maintenance on classical neuroleptics.

Antipsychotika 3. generace

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Dávka (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
aripiprazol	ABILIFY	15-30	dopamino-serotoninový stabilizátor parciální agonista D2 a 5-HT _{1A} receptorů antagonista 5-HT _{2A} receptorů

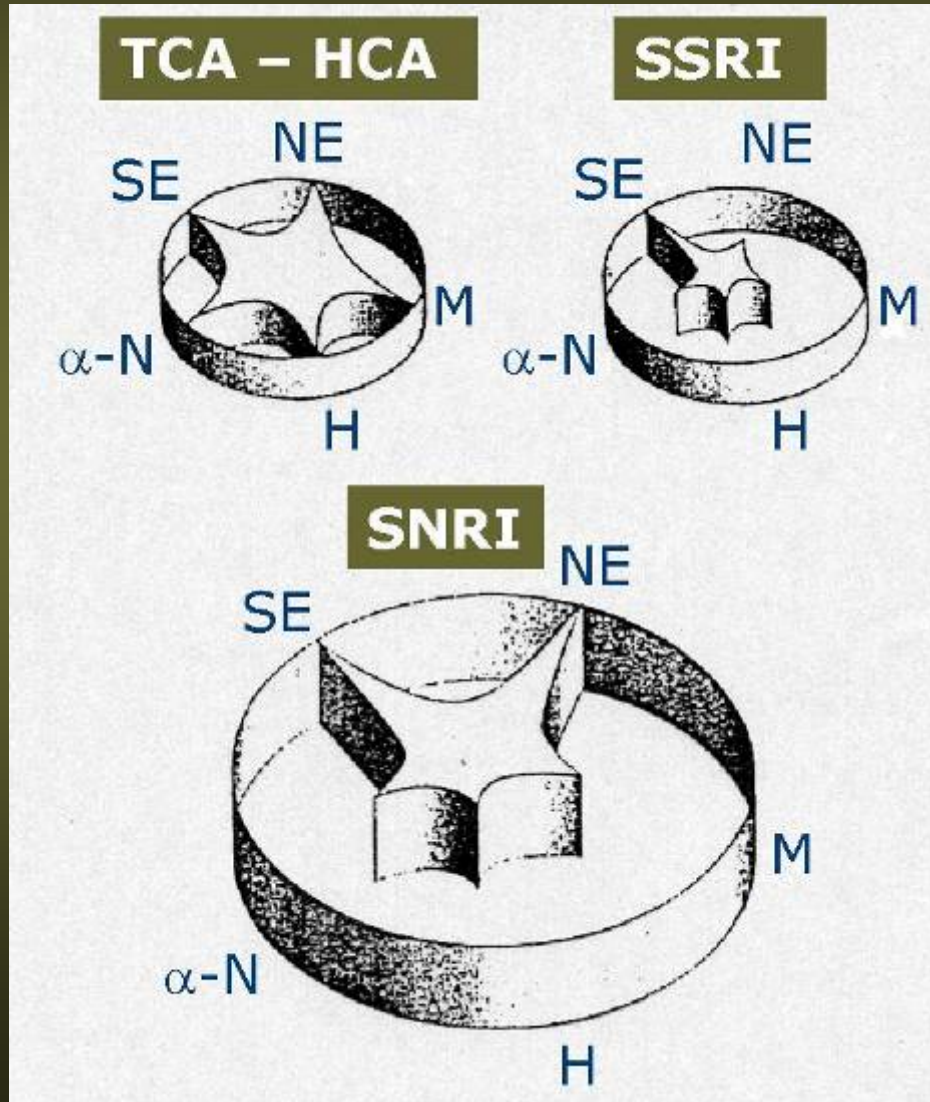
Depotní neuroleptika

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrná dávka (mg)</i>	<i>Interval</i>
flufenazin	MODITEN DEPOT	25	14-28 dnů
oxyprothepin	MECLOPIN	25	
haloperidol	HALDOL DEPOT	100	
flupenthixol	FLUANXOL DEPOT	40	
zuclopenthixol	CISORDINOL DEPOT	200	
fluspirilen	IMAP	6	7 dní !!
risperidon	RISPERDAL CONSTA	20-30	14 dnů

Terapie psychotického neklidu

	<i>pro dosi (mg)</i>	<i>pro die (mg)</i>
chlorpromazin	100-200	800-1200
levopromazin (TISERCIN)	50-100	500-600
haloperidol	5-10	40-100
chlorprothixen	100-150	500-600
zuclopenthixol (CISORDINOL ACUTARD)	50-150	(24-72 hod.)
tiaprid (TIAPRIDAL)		600-1200

Inhibice zpětného vychytávání neurotransmitterů a vazebná afinita k receptorům



Receptorové systémy:

- SE serotonergní
- NE noradrenergní
- M muskarinový
- H histaminergní
- α -N alfa noradrenergní

Indikace antidepresiv

- Depresivní epizoda monopolární i bipolární
- Afektivní poruchy
- Obsedantně kompulzivní poruchy
- Panická porucha
- Poruchy příjmu potravy
- Psychosomatická onemocnění
- Posttraumatické stresové poruchy
- Abstinenční syndromy
- Algické syndromy
- Hyperkinetické a emoční poruchy u dětí
- Enuréza
- Narkolepsie

Antidepresiva

Inhibitory zpětného vychytávání monoaminů

1. generace antidepresiv (TCA, TeCA)

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
amitriptylin	AMITRIPTYLIN	75-200	inhibice serotoninu a noradrenalinu s následným zvýšením jejich koncentrace v synaptické šterbině
nortriptylin	NORTRILEN	50-150	
imipramin	MELIPRAMIN	75-250	
klomipramin	ANAFRANIL, HYDIPHEN	75-225	
dosulepin	PROTHIADEN	100-300	
dibenzepin	NOVERIL	240-720	
maprotilin	LUDIOMIL, MAPROTILINE	75-150	

1. generace antidepresiv

- blokují muskarinové receptory
 - histaminové H1 receptory
 - alfa 1 adrenergní receptory
 - alfa 2 adrenergní receptory
-
- mnoho nežádoucích účinků
 - nebezpečí intoxikace
 - četné interakce
 - účinek za 3 - 6 týdnů

2. generace antidepresiv

2. generace antidepresiv			
<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
viloxazin	VIVALAN	100-300	inhibice zpětného vychytávání noradrenalinu

3. generace antidepresiv

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
SSRI			
fluvoxamin	FEVARIN	100-300	inhibice zpětného vychytávání serotoninu
fluoxetin	DEPREX, DEPRENON, PROZAC, PORTAL, FLOXET, FLUXONIL, MAGRILAN	20-60	
citalopram	SEROPRAM, CITALEC, CEROTER, PRAM	20-60	
escitalopram	CIPRALEX	10-20	
paroxetin	SEROXAT, PAROLEX, APO-PAROX, REMOOD	20-60	
sertralin	ZOLOFT, SERLIFT, ASENTRA, STIMULOTON	50-200	

3. generace antidepresiv

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
SARI			
Antidepresiva se zdvojeným serotoninovým působením			
trazodon	TRITTICO AC	4-8	antagonista serotoninu 2A a 2C, inhibitor zpětného vychytávání serotoninu a noradrenalinu
nefazodon	SERZONE, DUTONIN	100-300	
NARI			
reboxetin	EDRONAX	4-8	inhibice zpětného vychytávání noradrenalinu
tianeptin	COAXIL	75	zvyšuje zpětné vychytávání serotoninu

4. generace antidepresiv

Dual acting antidepressants

Mixed reuptake inhibitors

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
SNRI			
venlafaxin	EFFECTIN, EFFEXOR	75-375	inhibuje v malých dávkách jen zpětné vychytávání serotoninu,
venlafaxin ER (extended relesase)	EFFECTIN ER	75-225	ve středních pak také noradrenalinu a ve vyšších dávkách ještě slabě dopaminu
milnacipran	IXEL, DALCIPRAN	50-100	poněkud intenzivněji inhibuje zpětné vychytávání noradrenalinu než serotoninu

4. generace antidepresiv

Dual acting antidepressants

Mixed reuptake inhibitors

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
DNRI			
bupropion	WELLBUTRIN ZYBAN	150-300	zvyšuje koncentraci dopaminu a noradrenalinu v CNS jejich slabou inhibicí zpětného vychytávání

4. generace antidepresiv

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>	<i>Mechanismus účinku</i>
Blokující α_2-receptory			
mianserin	LERIVON, MIABENE	60-90	zvyšují syntézu a uvolňování noradrenalinu blokují alfa 2 zakončení na serotoninových neuronech se zvyšující se tvorbou a uvolňováním serotoninu
mirtazapin	REMERON, ESPRITAL, REMERON sol. tab.	15-45	
Jiné inhibitory zpětného vychytávání monoaminů			
hypericum perforatum	JARSIN	900	slabý inhibitor NA, 5-HT, DA

Inhibitory MAO

Neselektivní a ireverzibilní: (IMAO A a IMAO B)

fenelzin

NARDIL

isocarboxazid

MARPLAN

nialamid

NIAMID, NUREDAL

tranylcyppromin

PARNATE

Selektivní a reverzibilní

MAO A

moklobemid

AURORIX

brofaromin

CONSONAR

toloxaton

HUMORYL

MAO B

selegilin (L-deprenyl)

SEPATREM, JUMEX

Jiná psychofarmaka s antidepresivním účinkem

Tymoprofylaktika

	lithium	LITHIUM CARBONICUM, CONTEMNOL
antiepileptika II. generace	karbamazepin	BISTON, TEGRETOL, FINLEPSIN, TIMONIL
	solí kyseliny valproové	EVERIDEN, CONVULEX, ORFIRIL, DEPAMID
antiepileptika III. generace	lamotrigin	LAMICTAL
	gabapentin	GABAPENTIN, NEURONTIN
	topiramát	TOPAMAX

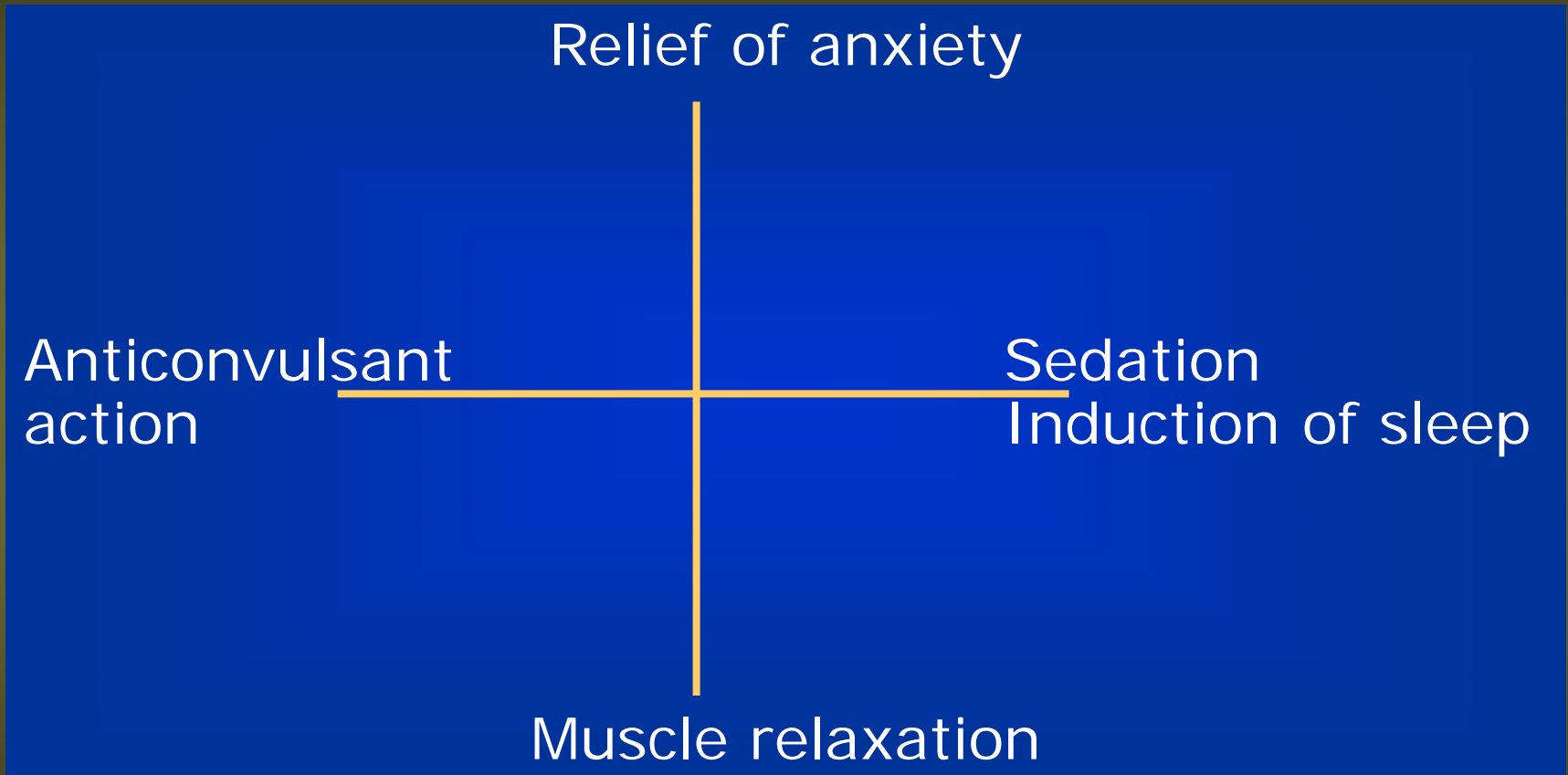
Atypická antipsychotika (neuroleptika) - SDA

	klozapin	LEPONEX, CLOZARIL, ALEMOXAN
	olanzapin	ZYPREXA
	quetiapin	SEROQUEL

Tymoprofylaktika

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Denní dávka (mg)</i>	<i>Sérové koncentrace</i>
lithium carbonicum	LITHIUM CARBONICUM	900 – 1000	0,5 - 0,8 mmol/l
	CONTEMNOL	1000 - 1500	0,8 - 1,2 mmol/l
karbamazepin	BISTON, TEGRETOL, TIMONIL	400 - 1500	5 - 10 ng/ml
kyselina valproová	EVERIDEN, ORFIRIL,	900 - 2000	50 -100 ng/ml

Action profiles of benzodiazepines



Ansseau, M., Doumont, A., Diricq, S.: Methodology required to show clinical differences between benzodiazepines. *Curr Med Res Opin* 8, Suppl. 4, 108-114 (1984). (Except <Dormicum> and <Dalmadorm>)

Benzodiazepinová anxiolytika

Indikace:

- anxiózní stavy
- insomnie
- abstinenční syndromy
- depresivní stavy
- epilepsie
- křečové stavy (febrilní, eklampsie)
- tetanus neonatorum
- zvýšený svalový tonus a spasmy (kromě tofizopamu)
- expy nežádoucí účinky neuroleptik
- premedikace v anestezii
- panické stavy (alprazolam, bromazepam, klonazepam) ve vyšších dávkách
- algické syndromy (stomatodynie, neurologie trigeminu, cefalgie)
- krátkodobé nepříjemné chirurgické výkony a kardioverze (využití amnestického účinku benzodiazepinů)

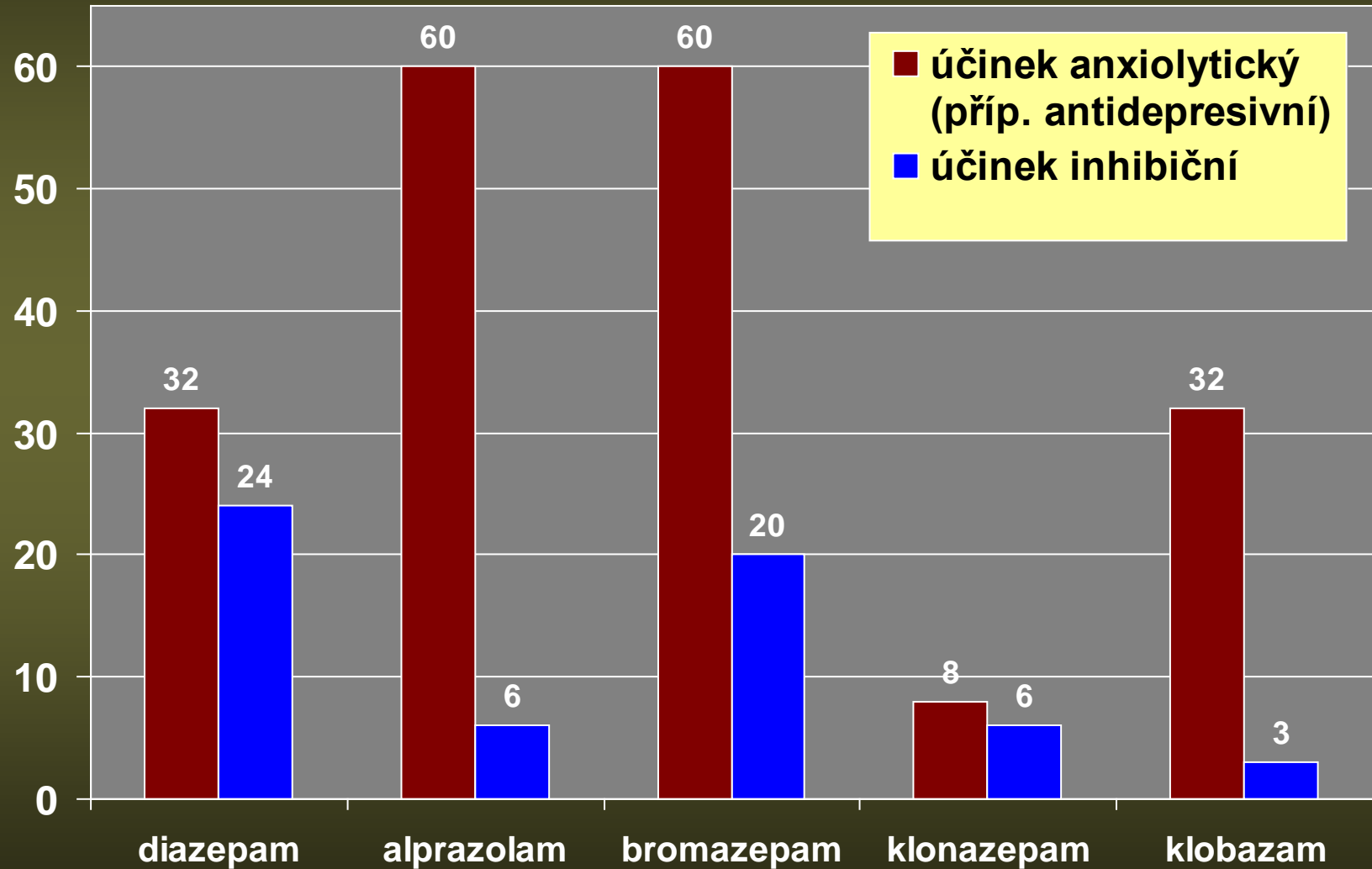
Anxiolytika

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Forma</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>
■ propandiolové deriváty			
guaifenesin	GUAJACURAN	drg. 200,400mg inj. 1 g	400 - 3000
mefenoxalon	DORSIFLEX, DIMEXOL	tbl. 200 mg	400 - 1200
meprobamat	MEPROBAMAT LÉČIVA	tbl. 400 mg	800 - 2400
■ piperazinový derivát			
hydroxyzin	ATARAX	tbl. 10, 25 mg inj. 100 mg sir.	20 – 100 300 - 400
■ azapironový derivát			
buspiron	ANXIRON, BUSPIRON-EGIS	tbl. 5, 10 mg	15-30

Anxiolytika (benzodiazepinové deriváty)

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Forma</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>
diazepam	DIAZEPAM SLOVAKOFARMA APO-DIAZEPAM APAUIN, SEDUXEN DIAZEPAM DESITIN DIAZEPAM DESITIN SUPP.	tbl. 2,5; 10 mg inj. 10 mg supp. 5 mg	10 - 60
chlordiazepoxid	DEFOBIN, ELENIUM RAPEDUR	tbl. a drg. 10 mg	20 - 60
oxazepam	OXAZEPAM LÉČIVA	tbl. 10 mg	10 - 60
alprazolam	NEUROL XANAX FRONTIN, HELEX	tbl. 0,25 mg ; 1 mg tbl. 0,25; 0,5; 1; 2 mg	1 - 10
bromazepam	LEXAURIN	tbl. 1; 5; 3 mg	3 - 36
medazepam	ANSILAN, RUDOTEL	tbl. 10 mg	20 - 40
tofisopam	GRANDAXIN	tbl. 50 mg	100 - 400
klorazepát draselný	TRANXENE	tbl. 5; 10; 50 mg inj. 20; 50; 100 mg	15 - 30 50 - 300
lorazepam	TAVOR	tbl. 1; 2,5 mg	2
klobazam	FRISIUM	tbl. 10 mg	20 - 60
prazepam	DEMETRIN	tbl. 10 mg	20 - 40
klonazepam	RIVOTRIL ANTELEPSIN	tbl. 0,5 ; 2 mg gttae 10-25 mg/ml inj. 1 mg tbl. 0,25; 1 mg	1 - 4

Anxiolytika



Hypnotika

	<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Forma</i>	<i>Průměrné dávky (mg)</i>
1. generace	barbituráty			
	chloralhydrát	CHLORALOURAT		500 – 1000
	glutethimid	NOXYRON	tbl. 250 mg	250 - 500
2. generace	nitrazepam	NITRAZEPAM SLOVAKOFARMA FORTE	tbl. 5; 10 mg	5 - 20
	flunitrazepam	ROHYPNOL, SOMNUBENE	tbl. 1 a 2 mg inj. 2 mg	0,5 – 2 1 - 2
	triazolam	HALCION	tbl. 0,125 mg	0,125 - 0,5
	midazolam	DORMICUM	tbl. 7,5 a 15 mg inj. 5 mg	7,5 – 15
	cinolazepam	GERODORM	tbl. 40 mg	20 – 40
3. generace	zolpidem	STILNOX, HYPNOGEN, EANOX	tbl. 10 mg	10 - 20
	zopiklon	IMOVANE	tbl. 7,5 mg	3,75 – 7,5
	zalepton	SONATA	tbl. 10 mg	5 – 10
Jiná psychofarmaka s hypnotickým účinkem	Antihistaminika (promethazin – PROTHAZIN)			
	Antidepresiva (mirtazapin, trazodon)			
	Antipsychotika			
	Melatoniny			

Kognitíva

INBITORY ACETYLCHOLINESTERÁZY

rivastigmin

EXELON

8 - 12 mg

donepezil

ARICEPT

5 - 10 mg

galantamin

REMINYL

8 - 24 mg

ANTAGONISTA NMDA (N-methyl-D-aspartát) RECEPTORU

memantin

EBIXA

10 - 30 mg

Nootropika

Indikace: organické poruchy paměti, intelektu; počínající stadia, latence účinku 2-3 měsíce

pyritinol	ENERBOL ENCEPHABOL	300 - 900
piracetam	NOOTROPIL, PYRAMEM, KALICOR	3000 - 9000

Nootropika a vasodilatancia

(zlepšují reologické vlastnosti krve a mozkovou perfuzi)

cinarizin	STUGERON	50-100
vinpocetin	CAVINTON	15- 30
flunarizin	SIBELIUM	10
natridrofuryl	ENELBIN DUSODRIL	200-300
pentoxifylin		
xanthinol		

Námelové alkaloidy

dihydroergotoxin	SECATOXIN	
nicergolin		

Psychostimulancia

<i>Generický název</i>	<i>Firemní název</i>	<i>Denní dávky (mg)</i>
amfetamin	PSYCHOTON, ADDERAL	5 – 50
dexamfetamin	DEXEDRON	5 – 30
efedrin	EPHEDRIN	12,5 – 50
mezokarb	SYDNOCARB	5 – 50
metylfenidat	RITALIN, CENTEDRIN	10 – 40
modafinil	VIGIL, PROVIGIL	200 – 400