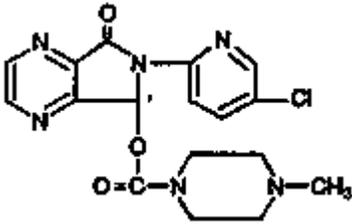


## Zopiclon

### Synonym:

6-(5-Chlor-2-pyridin)-7-[(4-methyl-1-piperazin)-carboxyloxy]-6-7-dihydro-[5-H]-pyrrol[3,4-b]-pyrazin-5-on

### Chemische Formel:



### Beschaffenheit:

Weißes oder fast weißes, feines, kristallines Pulver. Schmelzpunkt ca. 177 °C.

### Handelspräparate:

#### *Declime d:*

Desizop iclon

#### *esparma:*

espa-dorm

#### *Dologiet:*

Optidorm

#### *Hormosan:*

Somnosan

#### *Aventis Pharma:*

Ximovan

#### *Merck dura:*

Zopiclodura

#### *ratiopharm:*

Zopiclon-ratiopharm

#### *Stada:*

Zopiclon Stada

#### *ct-Arzneimittel:*

Zopiclon von ct

#### *Alind Pharma:*

Zopiclon AL

#### *Azupharma:*

Zopiclon AZU

#### *neuraxpharm:*

Zopiclon-neuraxpharm

#### *Alpharma-Isis:*

Zopi-Puren

**Vorkommen im Trinkwasser:**

Über den Urin der Anwender gelangen alljährlich große Mengen der Reinsubstanz über das Abwasser in das Grundwasser und von dort in manches Trinkwasser.

**Wirkungscharakter:**

Hypnotika/Sedativa aus der Klasse der Cyclopyrrolonen. Sie sind strukturell weder mit den Benzodiazepinen noch mit den Barbituraten verwandt. Zopiclon moduliert die hemmende Wirkung des Neurotransmitters  $\gamma$ -Aminobuttersäure (GABA) und wirkt im Vergleich zu den Benzodiazepinen auf eine separate Bindungsstelle des GABA-Rezeptor-Komplexes ein.

**Stoffwechselverhalten:**

Nach oraler Gabe von 3,75, 7,5 oder 15 mg werden nach 1-2,5 Stunden maximale Serumspiegel von ca. 30, 60 oder 115 ng/ml erreicht. Die Plasmaeiweißbindung beträgt etwa 45%. Die Eliminationshalbwertszeit beträgt ca. 5 Stunden, bei älteren Patienten ca. 7 Stunden. Bei der hepatischen Metabolisierung entstehen im Wesentlichen zwei Metaboliten: Das pharmakologisch aktive Zopiclon-N-oxid und das nicht aktive N-Desmethyl-Zopiclon. Die Ausscheidung der Substanz und der bekannten Metaboliten erfolgt zu 80% mit dem Urin und zu ca. 16% mit den Faeces. Bioverfügbarkeit nach Gabe von Filmtabletten 80%.

**Indikationen:**

Zur symptomatischen Behandlung von Ein- und Durchschlafstörungen.

**Kontraindikationen:**

Myasthenia gravis, schwere respiratorische Insuffizienz, schwere Leberinsuffizienz, schweres Schlaf-Apnoe-Syndrom. Kinder.

**Toxizität:**

Humantherapeutische Einzeldosis: 0,1(-0,2) mg/kg KG

LD50	Tier	orale Dosis (mg/kg)	Sicherheitsfaktor
akute Toxizität (Einzeldosis)	Hund	>1.500	15.000
	Ratte	582	5.820
subakute Toxizität (bis zu 3 Monaten)	Hund	72	720
	Ratte	120	1.200

Bei Kindern sind Dosen von 1 mg/kg Körpergewicht als behandlungsbedürftige Intoxikation anzusehen.

**Nebenwirkungen:**

Gelegentlich, vorwiegend zu Beginn der Therapie, Schläfrigkeit während des Tages, Benommenheit, verminderte Aufmerksamkeit, Verwirrung, Mattigkeit, Kopfschmerzen, Schwindel, Muskelschwäche, Bewegungs- und Gangunsicherheit. Gelegentlich gastrointestinale Störungen, Mundtrockenheit oder Hautreaktionen, z. B. Pruritus, Erytheme, Urticaria, Angioneurotisches Ödem. Häufig bitterer bis metallischer Geschmack. Bei hoher Dosierung anterograde Gedächtnisstörungen. In Einzelfällen psychiatrische und paradoxe Reaktionen, physische oder psychische Abhängigkeit, Entzugs- oder Reboundeffekte, vereinzelt Missbrauch. Ein Manifestwerden einer vorbestehenden Depression ist grundsätzlich möglich.

**Symptome bei Überdosierung:**

Sedierung, metallischer Geschmack, Mundtrockenheit, Übelkeit, Bewusstseinsstörungen, Unruhezustände oder Halluzinationen, Tiefschlaf bis hin zum Koma, Hypotension, Sinusbrady-/tachykardie, kardiale Reizleitungsstörungen.

Erste Symptome der Überdosierung sind ab einer Dosis von 22,5 mg (3 Tabl.) feststellbar. Komatöse Zustände sind bisher nur in Dosen über 100 mg (mehr als 14 Tabl.) und/oder in Verbindung mit anderen

Hypnotika/Sedativa aufgetreten. Auffällige Laborbefunde waren meist eine Hypokaliämie und eine Hyperglykämie, in seltenen Fällen kam es auch zu einer vorübergehenden und mäßigen Verlängerung der PTT oder zu einer leichten Hyperbilirubinämie.

**Therapie:**

Primäre Giftentfernung durch Magenspülung, Gabe von Medizinalkohle, ggf. Intubation, Beatmung, Kreislaufüberwachung.

Antidot: Flumazenil kann gegeben werden, da es der schlaffördernden Wirkung entgegenwirkt (noch wenig Erfahrung, vom BGA deshalb noch nicht anerkannt).