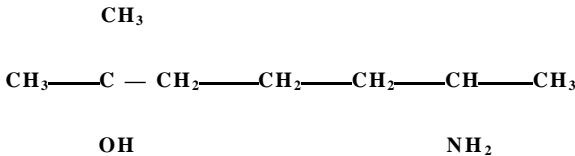


Heptaminol

Synonyma:

6-Methyl-2-amino-6-heptanol; 6-Amino-2-methyl-heptanol; 2-Methyl-6-amino-2-heptanol;

Chemische Formel:



Beschaffenheit:

Farblose, kristalline Substanz; gut löslich in Wasser, in niederen Alkoholen, schlecht löslich in Aceton und Chloroform; MG = 145,24; SP = 162-164° C; trocken lagern!

Verwendung:

Kardiale Indikation: Überleitungsstörungen, partieller AV-Block, Bradykardie, latente Insuffizienz, Koronarinsuffizienz, Digitalisintoxikation; als Adjuvans in der Digitalistherapie besonders bei Digitalisunverträglichkeit oder Herzdekompensation trotz Volldigitalisierung

Bronchopulmonale Indikation: Chronische Bronchitis, Asthma bronchiale, Emphysem, chronisches Cor pulmonale

Kreislaufindikation: Hypotonie infolge verminderter Herzleistung, orthostatische Dysregulation

Kontraindikation: Maligne Hypertonie, schwere Tachykardie; Vorsicht bei Epilepsie und frischem Herzinfarkt!

Vorkommen:

Dosierung: 50 mg i.v. sehr langsam (10 mg/30 sec.) 75-100 mg i.m. 2 x/d 200 mg als Retardkapsel Bayrotren® Kps.: 1 Kps. enthält 100 mg Heptaminol-HCl + 10 mg Norfenefrin-HCl (Bayropharm)

eoden retard® Kps.: 1 Kps. enthält 200 mg Heptaminol-HCl (Woelm Pharma)

Heptaminol Diffules® Kps.: 1 Kps. enthält 200 mg Heptaminol-HCl (Schwarzhaupt)

Heptylon® Amp.: 1 Amp. à 5 ml enthält 313 mg Heptaminol-HCl (Delalande)

Heprylonret. Retard-Tbl.: 1 Tbl. enth. 75,6 mg Heptaminol-HCl + Glycerinpalmitostearat (Delalande)

Heptylon Tbl.: 1 Tbl. enthält 187,8 mg Heptaminol-HCl (Delalande)

Heptylon Tropfen: 25 Tropfen entsprechen 305 mg Heptaminol-HCl + K⁺-Sorbit (Delalande)

Theo-Heptylon® Amp.: 1 Amp. à 5 ml enthält 500 mg Heptaminoltheophyllin-7-acetat (Delalande)

Theo-Heptylon Tbl.: 1 Tbl. enthält 500 mg Heptaminoltheophyllin-7-acetat (Delalande)

Theo-Heptylon Tropfen: 1 ml (= 20 gt) enthält 400 mg Heptaminoltheophyllin-7-acetat + p-Aminobenzoesäuremethylester + 5 mg p-Hydroxybenzoesäurepropylester (Delalande)

Orthoheptamin® Perlen: 1 Perle enthält 20 mg Heptaminol-HCl + 5 mg Etifelmin-HCl (Guilini Pharma)

Orthoheptaminretard Drg.: 1 Drg. enth. 40 mg Heptaminol-HCl + 10 mg Etifelmin-HCl (Guilini Pharma)

Wirkungscharakter:

Zwei Wirkmechanismen werden für den aliphatischen Aminoalkohol Heptaminol diskutiert: 1. indirekt sympathomimetische Wirkung, d. h. Freisetzung endogener Katecholamine, 2. direkte Wirkung auf den

Herzmuskel durch Beeinflussung der Koppelung von Membrandepolarisation und Kontraktion; die intra- oder extrakardiale K^+ -Konzentration wird nicht verändert;

Die Wirkungen im einzelnen:

- Herz-Kreislauf-System: positiv chronotrop, inotrop, dromotrop; es kommt zu flüchtigem, systolischem Blutdruckanstieg durch die Mehrarbeit des Herzens; der periphere Widerstand bleibt unbeeinflusst; es erfolgt Koronardilatation mit dadurch bedingtem erhöhten Durchfluß. Das kardiotope Wirkprofil ähnelt dem des g-Strophantins bei allerdings unterschiedlichem Wirkmechanismus;
- Lungenkreislauf: Dilatation der Pulmonalgefäße, Verminderung des rechtsventrikulären Drucks, erhöhte Lungenventilation durch Zunahme des Atemvolumens
- Niere: Erhöhte Durchblutung und dadurch Diureseanstieg

Interaktionen: Heptaminol verstärkt die Glykosidwirkung durch agonistische Wirkung bei unterschiedlichem Angriffspunkt; gleichzeitig werden dann weniger Glykoside für die gleiche Wirkung benötigt; Wirkungsabschwächung durch Cocain, Atropin, Antihistaminika

EKG-Veränderungen: Verkürzung des Vorkammerkomplexes, Verlängerung der diastolischen Phase; Erhöhung der R-Voltage bei ermüdetem Muskel

Pharmacofunctio:

Metabolismus: Schnelle Resorption im Magen-Darm-Trakt; nur kurze Wirkung, deshalb wurde eine Reihe von Retardpräparaten entwickelt, die den Wirkstoff über mehrere Stunden kontinuierlich freisetzen; innerhalb von 24 Std. werden 85% als 6-Amino-2-methyl-1,2-heptandiol renal ausgeschieden; die biliäre Ausscheidung liegt unter 1%; nach i.v.-Injektion ist ein biphasischer Abfall des Plasmaspiegels zu beobachten: HWZ 1 = 10-12min., HWZ 2 = 1!/2-2Std. Maximale Plasmaspiegel werden 30 min. nach peroraler Aufnahme erreicht. Es herrscht vollständige Bioverfügbarkeit; die Plasmaproteinbindung ist gering.

Toxizität:

LD₅₀ Maus 2000 mg/kg i.v.

Subakute toxische Erscheinungen konnten nach 12-tägiger i.v.-Applikation von 100 mg/kg tgl. bei Hunden nicht festgestellt werden. Beim Menschen gibt es keine Angaben über schwere Heptaminol-Überdosierungserscheinungen.

Symptome:

Tachykardie, Hypertonie; Flush, allergisches Exanthem; Venenreizung nach i.v.-Applikation

Nachweis:

Dünnschichtchromatographie, Massenspektrometrie

Therapie:

Meist genügt Reduktion der Dosis oder Absetzen des Präparates bei starker Tachykardie Propanolol; nach versehentlicher massiver oraler Aufnahme Kohle-Pulvis evtl. Magenspülung

Literatur:

ALBACH, E.: Versuch der Beurteilung eines Kardiotonikums durch den Sequentialtest nach Wald. Zeitschr. Therapie 5; 271-8(1972)

BEKKERING, Th.: Eine Alternative zur konventionellen Herztherapie. Therapiewoche 31; 6561-7 (1981)

BRAUN, H.: Erfahrungen mit Heptaminol. Zeitschr. Therapie 6; 345-51 (1972)

SCHÜREN, K. P., HÖTTEMANN, U., RAMDOHR, B., LOHMANN, F. W.: Lungenkreislauf und kontraktile Funktion des rechten Ventrikels bei chronischem Cor pulmonale; vergleichende Untersuchung über den Einfluß von Aminophyllin und Heptaminol. Therapie Gegenw.; 489-501 (1973)