

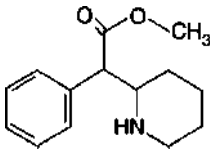
# Methylphenidat (-» Amphetamine)

Synonyma:

Amphetamin

2-Phenyl-2-(2-piperidyl)-essigsäuremethylester, Methyl [o>phenyl-a-(2-piperidyl)acetat]

Chemische Formel:



Beschaffenheit:

MG: 233,34

Verwendung:

Indikation: Hyperkinesie bei Schulkindern, Narkolepsie.

Dosierung: 5-20 mg Tagesdosen 20-60 mg

Vorkommen:

Ritalin® Tabletten, Geigy

Wirkungscharakter und Stoffwechselverhalten:

Phenethylaminderivat. Rasche Biotransfusion durch Hydrolyse des Esters. Dieser Schritt geschieht auch in wäßrigen alkalischen Vorrats-Lösungen oder im Blut. Dies kann durch Ansäuerung oder EDTA verhindert werden. (SCHUBERT, 1970; PEREL, 1970). 80% werden in 24 Std. über den Urin ausgeschieden (BARTLETT, 1972), 1% davon unmetabolisiert (FARAJ, 1974).

Therapeutische Blutkonzentration 3,3-64 mg/l nach 6 Std. und 10 mg täglich.

Urinkonzentration 0,107-0,94 mg/l nach 8 Std. nach 25 mg bei 5 Erwachsenen (DUGAL, 1978).

Toxizität:

LD<sub>50</sub> intraperitoneal Ratte: 430 mg/kg

LD<sub>50</sub> oral Maus: 190 mg/kg

LD<sub>50</sub> subcutan Maus: 218 mg/kg

Symptome und klinische Befunde:

Übelkeit, Erbrechen, Erregung, Zittern, Delir; Suizidalität, Halluzinationen, Schweißausbrüche, heiße und rote Haut, Kopfschmerzen, Tachykardie, Fieber, Herzrhythmusstörungen, Hypertonie, Krämpfe, Koma.

Nachweis:

DC (VAN BOVEN, 1979)

GC (SCHUBERT, 1970; WELLS, 1974; DUGAL, 1978; HUNGUND, 1979; RAY, 1972)

EMIT-Amphetamine

## Therapie:

Bei Überdosierung sofort Kohle-Pulvis, Klinikeinweisung unter Monitorkontrolle, Magenspülung, Kohle, Monitorkontrolle, Plasmaexpander.

Bei anticholinerger Wirkung Antidot Physostigmin (Anticholium 2 mg, Wiederholung), überwachen (Suizidalität).

Entwöhnung siehe Amphetamine

## Besonderheiten:

Wurde früher als Analeptikum nach schweren Krankheiten therapeutisch eingesetzt

## Literatur:

- BARTLETT, M.E., EGGER, H.P.: Disposition and metabolism of methylphenidate in dog and man. *Fed. Proc.* 31: 537, 1972.
- BECKETT, A.H., ROWLAND, M., TURNER, P.: Influence of urinary pH on excretion of amphetamine. *Lancet* 1965; i: 303.
- VAN BOVEN, JVL, DAENENS, P.: Determination at the nanogram range of ritalinic acid in urine after ion-pair extraction. *J. For. Sci.* 24: 55-60, 1979.
- CRADDOCK, D.: Anorectic drugs. *Drugs* 1976; 11: 378-93.
- DALY, D.D., YOSS, R.E.: The treatment of narcolepsy with methyl phenylpiperidylacetate; a preliminary report. *Proceedings of the Staff Meeting of the Mayo Clinic* 1956; 31: 620-5.
- DAYTON, P.E., READ, J.M., ONG, V.: Physiological disposition of methylphenidate C-14 in man. *Fed. Proc.* 29: 345, 1970.
- DUGAL, R., ROULEAU, M.A., BERTRAND, M.J.: The nitrogen-phosphorus detector in the gas Chromatographie assay of unmetabolized methylphenidate. *J. Anal. Tox.* 2: 101-106, 1978.
- EDITORIAL: Freedom from Amphetamines. *Brit. med. J.* 1971/11, 133, 176.
- EISENBERG, L.: Hyperkinesis revisited. (1978) *Pediat.* 61, 319
- FARAJ, B.A., ISRAILI, Z.H., PEREL, J.M.: Metabolism and disposition of methylphenidate-<sup>14</sup>C: studies in man and animals. *J. Pharm. Exp. Ther.* 191: 535-547, 1974.
- HUFFMAN, R., BLAKE, J.W., RAY, R.: Methylphenidate blood plasma levels in the horse determined by derivative gas-liquid chromatography-electron capture. *J. Chrom. Sci.* 12: 383-384, 1974.
- HUNGUND, B.L., HANNA, M., WINSBERG, B.G.: A sensitive gas Chromatographie method for the determination of methylphenidate (Ritalin) and its major metabolite a-phenyl-2-piperidine acetic acid (ritalinic acid) in human plasma using nitrogen-phosphorus detector. *Comm. Psychopharm.* 2: 203—208, 1978.
- HUNGUND, B.L., PEREL, J.M., HURWIC, M.J.: Pharmacokinetics of methylphenidate in hyperkinetic children. *Brit. J. Clin. Pharm.* 8: 571-576, 1979.
- IDEN, CR., HUNGUND, B.L.: A chemical ionization selected ion monitoring assay for methylphenidate and ritalinic acid. *Biomed. Mass Spec.* 6: 422-426, 1979.
- JANOWSKY et al.: *Lancet* IL 632-635, 1972.
- KOLATA, G.B.: Childhood hyperactivity: A new look at treatment and causes. (1978) *Science* 199, 515
- LEWMAN, L. V.: Fatal pulmonary hypertension from intravenous injection of methylphenidate (Ritalin) tablets. *Hum. Path.* 3: 67-70, 1972.
- MILBERG, R., RINEHART, K.L. Jr., SPRAGUE, R.L., SLEATOR, E.K.: A reproducible gas Chromatographie mass spectrometric assay for low levels of methylphenidate and ritalinic acid in blood and urine. *Biomed. Mass Spec.* 2: 2-8, 1975.
- MORUZZI, G.: The sleep-waking cycle. *Ergebnisse der Physiologie, biologischen Chemie und experimentellen Pharmakologie* 1972; 64: 1-165.
- PEREL, J.M., BLACK, N.: *In vitro* metabolism studies with methylphenidate. *Fed. Proc.* 29: 345, 1970.
- PRINZMETAL, M., BLOOMBERG, W.: The use of Benzedrine for the treatment of narcolepsy. *JAMA* 1935; 105: 2051-A.
- RAY, R.S., NOONAN, J.S., MURDICK, P.W., THARP, U.L.: Detection of methylphenidate and methamphetamine in equine body fluids by gas Chromatographie analysis of an electron-capture derivative. *Am. J. Vet. Res.* 33: 27-31, 1972.
- SCHUBERT, B.: Detection and identification of methylphenidate in human urine and blood samples. *Acta Chem. Scand.* 24: 433-438, 1970.
- SINGH, V., LING, G.M.: Amphetamines in the management of children's hyperkinesis. (1979) *Bull. Narcot.* 31, 87
- SOLDIN, S.J., CHAN, Y.P.M., HILL, B.M., SWANSON, J.M.: Liquid-chromatographic analysis for methylphenidate (Ritalin) in serum. *Clin. Chem.* 25: 401-404, 1979.
- STRUNK, P.: Zur Vermeidung von Stimulanzien bei Kindern. *Dtsch. Ärztebl.* 33, 2243-2244 (1986).
- SROUFE, L.A., STEWART, M.A.: Treating problem children with stimulant drugs. *N Engl J Med* 1973; 289: 407-13.
- WELLS, R., HAMMOND, K.B., RODGERSON, D.O.: Gas-liquid Chromatographie procedure for measurement of methylphenidate hydrochloride and its metabolite, ritalinic acid, in urine. *Clin. Chem.* 20: 440-443, 1974.