

## Isradipin

### Synonym:

Isopropylmethyl-4-(2,1,3-benzoxadiazol-4-yl)-1,4--dihydro-2,6-dimethyl-3,5-pyridindicarboxylat  
4-(4-Benzofurazanyl)-1,4-dihydro-2,6-dimethyl-3,5-pyridindicarbonsäureisopropyl-methyl-ester, Isradipinum, DCI rec.

### Chemische Formel:



### Summenformel:

C<sub>19</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O<sub>5</sub>

### Handelspräparate:

*Novartis:*

Lomir

*Schwarz Pharma:*

Vascal

### 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.

### Beschaffenheit:

gelbes, feinkristallines Pulver (lichtempfindlich)

Schmelzpunkt: zwischen 166 und 170 °C

Molmasse: 371,39

### Wirkungscharakter:

Erstzulassung 10/1990, Calciumantagonist. Isradipin entfaltet seine Wirkung über eine Hemmung des Calcium-Ionen-Einstroms in die glatten Gefäßmuskelzellen. Die Kontraktilität der medialen Gefäßmuskulatur nimmt ab und der periphere Gefäßwiderstand verringert sich.

Isradipin zeigt im Gegensatz zu anderen Calciumantagonisten keine negative inotrope Wirkung.

Isradipin wird nach peroraler Gabe zu 90-95% resorbiert. Es unterliegt einem ausgeprägten First-pass-Effekt; die Bioverfügbarkeit beträgt ca. 16-18%.

### Stoffwechselverhalten:

Isradipin wird nach oraler Gabe zu 90-95% resorbiert. Es unterliegt einem ausgeprägten First-pass-Effekt; die Bioverfügbarkeit beträgt 16-18%.

Isradipin wird zu etwa 95% an Plasmaproteine gebunden und wird in der Leber nahezu vollständig vor allem über oxidative und hydrolytische Prozesse metabolisiert.

Ca. 60-65% der verabreichten Dosis werden über den Urin, 25-30% über die Faeces ausgeschieden. Im

Urin läßt sich kein unveränderter Wirkstoff nachweisen. Die Metaboliten zeigen keine pharmakodynamische Aktivität.

Die Elimination verläuft zweiphasig; die terminale Halbwertszeit liegt bei 8,4 Std.

**Indikation:**

Essentielle Hypertonie

**Kontraindikationen:**

Schock, Hypotonie (systolisch <90 mmHg), höhergradige Aortenstenose, Schwangerschaft, Stillzeit.

**Toxizität:**

Calcium-Antagonist (Hemmung des transmembranären  $\text{Ca}^{++}$ -Ionen-Einstromes in das Myokard und die glatte Gefäßmuskulatur). Elektromechanische Entkoppelung der exzitatorischen Vorgänge. Durch negative Inotropie energetisch-dynamische Herzinsuffizienz und durch periphere Vasodilatation Blutdrucksenkung.

*Nebenwirkungen:*

Haut:	Flush (häufig), Erytheme, Erythromelalgie, Hautveränderungen (Pruritus, Urtikaria, makulopapulöse Exantheme)
Nervensystem:	Kopfschmerzen, Schwindel, Müdigkeit
Gastrointestinaltrakt:	Gingivahyperplasie, Übelkeit, Völlegefühl, Diarrhö
Leber:	Leberfunktionsstörungen (intrahepatische Cholestase, Transaminasenanstieg)
Endokrinium:	Verminderung der Glukosetoleranz
Stoffwechsel:	Gynäkomastie
Herz/Kreislauf:	Palpitationen, Tachykardie, Paradoxe Reaktionen (Zunahme pektanginöser Beschwerden), Unerwünschte Blutdrucksenkung
Gefäße:	Knöchelödeme
Blut:	Blutbildveränderungen (z.B. Anämie, Thrombopenie, thrombozytopenische Purpura)

**Symptome:**

Die akute Vergiftung ist gekennzeichnet durch kardiales Versagen, Schock, Blutdruckabfall, periphere Pulslosigkeit und (eventuell nach instabiler Tachykardie, Bradykardie (Kammerautomatie). Beschrieben wurden ferner Somnolenz, Mydriasis bei erhaltener Lichtreaktion und Erhöhung des ZVD.

**Therapie:**

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

Giftentfernung: Bei oraler Giftaufnahme Magenspülung.

Elementarhilfe: Atemhilfe, z.B. Intubation.

Herz-Kreislauf-Hilfe: Bei Herz-Kreislauf-Stillstand Reanimation.

Antidotbehandlung: Calcium gluconicum 10% langsam i.v. (meist mehrere Ampullen erforderlich). Zur Wiederherstellung der elektromechanischen Koppelung ferner Herzglykoside und  $\beta$ -Sympathikomimetika.