

# Metoprolol

## Synonym:

1-Isopropylamino-3-[4-(2-methoxyethyl)-phenoxy]-2-propanol

## Chemische Formel:

OH

$\text{OCH}_2 \text{ CHCH}_2\text{NJHCH}(\text{CH}_3)_2$

$\text{CH}_2 \text{ CH}_2 \text{ OCH}_3$

## Vorkommen:

Seit 1975 im Handel.

*Dosierung:* 100-450 mg

Beloc-Duriles Filmtabletten, i.v. Ampullen, mit Tabletten, Tabletten (Astra Chemicals); Lopresor i.v. Injektionslösung, Lacktabletten, mit Lacktabletten (Geigy); Prelis Retardtablette (Brunnengräber)

## Wirkungscharakter:

Betablocker. Antihypertonikum. Halbwertszeit 2,5-7,5 Std., Plasmaproteinbindung 11 %. Rasche orale Resorption, durch den raschen Metabolismus jedoch nur eine Bioverfügbarkeit von 40-50 %. 99,6 % werden innerhalb von 72 Std. über den Urin ausgeschieden, darunter jedoch nur 3 % als Reinsubstanz (Regardh). Die Hauptmetaboliten entstehen durch O-Demethylierung, Oxidation, oxidative Desaminierung und aliphatische Hydroxylierung (Borg).

## Toxizität:

Therapeut. Dosis: 0,035-0,125 mg/l im Blut (Regardh, Bengtson)

Tox. Dosis: 12,2 mg/l im Blut (10 g, Moller)

## Symptome:

Müdigkeit, Benommenheit, Kurzatmigkeit, Bradykardie, Durchfälle, Bronchospasmus, Depression, Zyanose, Schock, Herzrhythmusstörungen.

## Nachweis:

DC (Lefebvre), GC (Ervik; Wood; Zak; Kinney)

## Therapie:

Kohle-Pulvis (10 g) nach oraler Aufnahme, Magenspülung, Kohle, Natriumsulfat, Plasmaexpander im Schock, Natriumbikarbonat-Infusion zum Azidoseausgleich. Alupent bei Bradykardie, Glukagt n im Schock.

## Literatur:

- BENGTSSON, C., JOHNSON, G., REGARDH, C. G.: Plasma levels and effects of metoprolol on blood pressure and heart rate in hypertensive patients after an acute dose and between two doses during long-term treatment. *Clin. Pharm. Ther.* 17: 400-408, 1975.
- BORG, K. O., CARLSSON, E., HOFFMANN, K. J.: Metabolism of metoprolol-(<sup>3</sup>-H) in man, the dog and the rat. *Acta Pharm. Tox.* 36: 125-135, 1975.
- ERVIK, M.: Quantitative determination of metoprolol in plasma and urine by gas chromatography. *Acta Pharm. Tox.* 36: 136-144, 1975.
- ERVIK, M., HOFFMANN, K. J., KYLBERGHANSEN, K.: Selected ion monitoring of metoprolol and two metabolites in plasma and urine using deuterated internal Standards. *Biomed. Mass Spec.* 8: 322-326, 1981.
- KINNEY, C. D.: Determination of metoprolol in plasma and urine by gas-liquid chromatography with electron-capture detection. *J. Chrom.* 225: 213-218, 1981.
- LEHEVRE, M. A., GIRAULT, J., FOURILLAN, J. B.:  $\beta$ -Blocking agents: determination of biological levels using high Performance liquid chromatography. *J. Liquid Chrom.* 4: 483-500, 1981.
- MOLLER, B. H. J.: Massive intoxication with metoprolol. *Brit. Med. J.* 24: 222, 1976.
- REGARDH, C. G., JOHNSON, G., JORDO, L., SOLVELL, L.: Comparative bioavailability and effect studies on metoprolol administration as ordinary and slow-release tablets in single and multiple doses. *Acta Pharm. Tox.* 36: 45-58, 1975.
- VON BAHR, C., COLLSTE, P., FRISK-HOLMBERG, M.: Plasma levels and effects of metoprolol on blood pressure, adrenergic beta receptor blockade, and plasma renin activity in essential hypertension. *Clin. Pharm. Ther.* 20: 130-137, 1976.