

# Naloxon

Synonym:

L-17- Allyl-4,5-epoxy-3,4-dihydroxy-6-morphinanon

Vorkommen:

*Dosierung:* 0,005-0,01 mg/kg KG

Narcanti (Winthrop) Amp. ä 0,4 mg; Neonatal (Winthrop)

Wirkungscharakter:

Naloxon ist ein synthetisches Oximorphondenvat (N-Allylnoroxymorphon). Es ist ein starker Morphinantagonist ohne agonistische Wirkungen. Der Wirkungsmechanismus wird durch eine Konkurrenz mit Opioiden für enkephalinerge Rezeptoren erklärt. Die Wirkung von Morphinantagonisten wie Pentazocin wird nur durch Naloxon aufgehoben. Naloxon hebt die Atemdepressionen, die durch die Gabe natürlicher oder synthetischer Opiate und Opiode verursacht werden auf, wie z. B. durch Alphaprodin, Anüeridin, Codein, Diphenoxylat, Fentanyl, Heroin, Hydromorphon, Levorphanol, Methadon, Morphin, Oxymorphon, konzentrierte Opiumalkaloide und Pethidin, ebenso durch Pentazocin, Propoxyphen oder Cyclazocin, Levallorphan oder Nalorphin. 1 mg Naloxon i.v. blockiert vollständig die Wirkung von 25 mg Heroin bzw. Morphin. 5 mg/kg KG Naloxon entsprechen in ihrer Wirksamkeit etwa 30 mg/kg KG Levallorphan oder 150 mg/kg KG Nalorphin (parenteral). Der  $pK_a$  beträgt 7,9. Naloxon wird nach p.o. Gabe rasch resorbiert. Die systemische Bioverfügbarkeit nach p.o. Gabe beträgt maximal bis 20 %, da ein ausgeprägter »First-pass«-Effekt (wahrscheinlich in der Leber) vorliegt. Maximale Plasmaspiegel treten 0,5-1 h nach p.o. Gabe auf. Naloxon wird in der Leber rasch und extensiv metabolisiert. 59-76 % der Gesamtdosis werden metabolisiert über die Nieren ausgeschieden. Die Plasma-HWZ während der Verteilungsphase beträgt 4 min, anschließend 1-1,5 h. Naloxon ist nach p.o. Gabe wesentlich schwächer wirksam (1/50 und weniger). Wirkungen treten erst nach oralen Gaben von 10 mg auf, auch durch 30 mg läßt sich nur ein leichtes Entzugssyndrom auslösen. 3000 mg Naloxon p.o. waren nötig, um die Wirkungen von 25 mg Heroin über 24 h zu blockieren.

*Wechselwirkungen:* Naloxon kann bei Drogenabhängigen ein akutes Entzugssyndrom auslösen. Die Entzugssymptome beginnen nach 20-40 min abzunehmen und verschwinden in der Regel innerhalb von 90 min. Die Patienten sollten nach einer Naloxonbehandlung, unabhängig von der Besserung der Symptome, einen Tag oder länger überwacht werden.

**Symptome:**

Krämpfe, Schock, Herzrhythmusstörungen.

**Nachweis:**

DC.GC

**Therapie:**

Plasmaexpander im Schock; Beatmen.

**Literatur:**

s. Gegengift G 32.