

Phentolamin

Synonym:

3-[N-(2-Imidazolin-2-yl-methyl)-4-toluidino]-phenol

Vorkommen:

Regitin 50 Ampullen (CIBA); Regitin Ampullen (CIBA)

Wirkungscharakter:

Phentolamin ist ein adrenerger α -Rezeptorenblocker mit Imidazolin-Struktur. Es hemmt kompetitiv u.a. die vasokonstriktorischen Wirkungen von Katecholaminen und anderen Sympathomimetika. Experimentell läßt sich auch eine Blockade präsynaptischer α -Rezeptoren an adrenergen Neuronen nachweisen. Diese Blockade fördert die Noradrenalin-Freisetzung und stimuliert damit die (nicht blockierten) β -Rezeptoren. Eine weitere Zunahme des Sympathikustonus erfolgt wahrscheinlich auch auf reflektorischem Wege. Insgesamt kommt es zu einer Drucksenkung in den Widerstandsgefäßen (Reduktion der kardialen Nachbelastung, »afterload«) und in der A. pulmonalis. Am Herzen zeigen sich positiv chronotrope und antiarrhythmische Wirkungen. Die Koronarperfusion kann sich erhöhen, der linksventrikuläre Füllungsdruck absinken. Die Bronchialmuskulatur kann u. U. erweitert werden. Die Pharmakokinetik von Phentolamin ist nur unvollständig untersucht. Der pK_a von Phentolamin beträgt 8,1. Es wird nach p.o. Gabe resorbiert. Der Metabolismus ist weitgehend unbekannt. Etwa 5 % einer p.o. Dosis und etwa 10 % einer parenteralen Dosis erscheinen pharmakologisch aktiv im Urin. Phentolamin ist nach parenterale Gabe etwa 4mal so stark wirksam wie nach p.o. Gabe.

Symptome:

Reflextachykardie, Schock. Übelkeit, Erbrechen, Bauchschmerzen, Durchfall. Angina pectoris.

Nachweis:

DC, HPLC

Therapie:

Infusion von Plasma(-expandem). Evtl. Infusion von Noradrenalin.