

Famotidin – ein neuer kompetitiver H₂-Blocker

Härtetest für Säurehemmer: das Zollinger-Ellison-Syndrom

In den letzten fünfzehn Jahren wurden über zehntausend Substanzen mit H₂-antagonistischer Aktivität synthetisiert, für über zweihundert dieser Substanzen wurde ein Patent beantragt, und zwei H₂-Blocker waren bislang auf dem Markt – jetzt sind es drei. Seit Mai bietet die Firma Frosst Pharma, München, Famotidin unter dem Warenzeichen Pepdul® als Filmtabletten (40 und 20 mg) sowie als i. v.-Lösung an. Wie Prof. Dr. Dr. med. W. Schunack vom Institut für Pharmazie der Freien Universität Berlin bei der Einführungspresskonferenz Anfang Mai in München erklärte, liegt den H₂-Blockern bei aller Strukturvielfalt ein gemeinsames Bauprinzip zugrunde: Ein aromatischer Ring ist über eine flexible Kette mit einer polaren, nicht protonierbaren Gruppe verbunden, wobei es – je nachdem, inwieweit die Substanzen dem Histamin chemisch ähnlich sind – kompetitive und nichtkompetitive Hemmer gibt.

Unter anderem weist ein kürzlich veröffentlichter Bericht von J. W. Black, einem der Väter der H₂-Rezeptor-Forschung, Famotidin als einen Histamin-Agonisten aus, welcher keine signifikanten Abweichungen von einer einfachen kompetitiven Bindungscharakteristik zeigt. Dies wurde in München ausdrücklich betont, um anderslautenden Pressemitteilungen entgegenzutreten, die Famotidin in die Nähe von Substanzen wie Lamtidin rücken wollten. H₂-Blocker

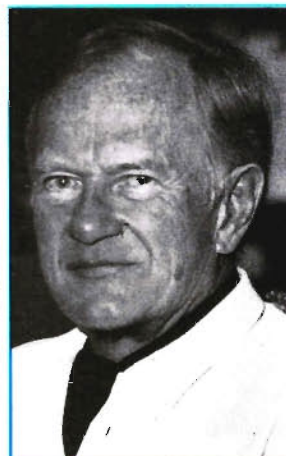
dieses Typs wirken nicht kompetitiv und können durch irreversible Bindung an den Rezeptor zu unerwünschten Langzeiteffekten führen. Unabhängig davon bedingen diese Substanzen aufgrund ihrer extrem langen Wirkungsdauer eine permanente Achlorhydrie im Magen und begünstigen so die Bildung von Karzinoiden.

Famotidin dagegen besitzt zwar unter den derzeit verfügbaren H₂-Blockern den auf Gewichtsbasis stärksten antisekretorischen Effekt – als therapeutische Dosis bei Ulcus duodeni und Ulcus ventriculi genügen einmal täglich 40 mg –, die Wirkdauer beträgt jedoch nur zehn bis zwölf Stunden. Erwiesenermaßen werden nach diesem Zeitraum auch bei mehrmaliger Gabe wieder physiologische Säuresekreptionswerte erreicht. Die Nicht-Kanzerogenität der neuen Wirksubstanz ist darüber hinaus in tierexperimentellen Studien gut dokumentiert. Die mit der genannten Tagesdosis Famotidin erzielten Heilerfolge bei Ulcus duodeni und Ulcus ventriculi sind denen unter Ranitidin (300 mg) vergleichbar. Entsprechend dem aktuellen Konzept der H₂-Blocker-Therapie wird die Wirksubstanz einmal abends verabreicht, um gezielt die nächtliche Säuresekretion einzudämmen.

Beim Zollinger-Ellison-Syndrom (ZES) sei Famotidin bereits heute das Mittel der Wahl, erklärte Prof. Dr. med. H. G. Dam-

man, Chefarzt am Krankenhaus Bethanien in Hamburg, und bezeichnete das Zollinger-Ellison-Syndrom als Härtestest für säurehemmende Substanzen – sowohl was die Wirksamkeit als auch was die Verträglichkeit anbelangt.

In einer von Damman zitierten Studie wurden sechzehn ZES-Patienten, die zum Teil mit den herkömmlichen H₂-Blockern nur ungenügend eingestellt werden konnten, bis zu 24 Monate lang mit Famotidin behandelt. Die mittlere Tagesdosis, die zur adäquaten Kontrolle der Hypersekretion der Magensäure notwendig war, betrug 240 mg. Einmal mehr bewies sich in diesem Hochdosis-Langzeit-Versuch die gute Verträglichkeit von Famotidin. Insgesamt wurden bislang weltweit mehrere tausend Patienten mit dem neuen H₂-Blocker behandelt. Antiandrogene Effekte und Interaktionen mit anderen Arzneimitteln werden nicht gesehen. vi



Curt Engelhorn, seit 1960 Geschäftsführender Gesellschafter und seit 1985 Aufsichtsrats-Vorsitzender von Boehringer Mannheim, wurde 60 Jahre.

Schnell informiert

Neuer Hersteller – Als Ergänzung ihres Präparate-sortiments zur Venen- und Hämorrhoiden-Verödung hat die Firma Kreussler, Wiesbaden, die Herstellung von Varigloban® (bisher Hormon-Chemie) und Varicocid® (bisher Combustin-Werk) übernommen. kr

Innovatives Dihydroergotoxin-Präparat – Dacoren® special Tabs heißt ein innovatives Dihydroergotoxin-Präparat, das die Firma Rhône-Poulenc, Norderstedt, zur Therapie von zerebraler Insuffizienz und Altershochdruck eingeführt hat; die Patienten können die Pastillen, die 4,5 mg lyophilisiertes Dihydroergotoxin für die einmal tägliche Einnahme enthalten, entweder auf der Zunge zergehen lassen oder in Flüssigkeit aufgelöst trinken. rp

Acemetacin-Retardform – Das nichtsteroidale Antirheumatikum Acemetacin steht jetzt auch als Retardform unter dem Warenzeichen Rantudil® retard zur Verfügung; wie die Herstellerfirma Tropon, Köln, erklärt, ist der Therapieerfolg in der Regel bei einmal täglicher Gabe einer Rantudil-Retardkapsel (90 mg Acemetacin) garantiert. tp

Glucophage retard weiterhin verfügbar – Die Firma Lipha, Essen, hat den Vertrieb der Glucophage retard Filmtabletten (vorher Degussa, Frankfurt) übernommen; versehentlich ist dieses Präparat, das einzige derzeit in der Bundesrepublik noch verfügbare Biguanid-Derivat, nicht in die Rote Liste 1986 aufgenommen worden. lp

Foto: Boehringer Mannheim