

Buprenorphin

Als Partialagonist an zentralen Opioid-Rezeptoren hat das starkwirkende Opioid Buprenorphin ein besseres **Sicherheitsprofil** als Morphin, denn Nebenwirkungen und Abhängigkeitsrisiko sind geringer.

Wie Morphin ist Buprenorphin bei starken akuten und chronischen Schmerzen im therapeutischen Einsatz. Außerdem ist es zur Substitutionstherapie bei Opioidabhängigkeit im Rahmen medizinischer, sozialer und psychotherapeutischer Maßnahmen von Erwachsenen angezeigt. Retardierte Darreichungsformen und transdermale therapeutische Systeme werden vorrangig in der Schmerztherapie, Schmelztabletten wegen der raschen Freisetzung eher in der Substitutionstherapie oder zur Behandlung von akuten Schmerzspitzen verwendet.

Ceiling-Effekt bei hoher Dosierung Buprenorphin bindet mit hoher Bindungsaffinität partialagonistisch an μ -Opioid-Rezeptoren im zentralen Nervensystem. Damit wird die maximale Wirksamkeit des Morphins auch bei weiterer Dosissteigerung von Buprenorphin nicht erreicht. Dies wird Ceiling-Effekt genannt. Dieses Wirkprinzip ist besonders günstig, wenn alte Menschen ein Opioid benötigen, denn das Sicherheitsprofil mit weniger unerwünschten Wirkungen, zum Beispiel der Atemdepression, ist aus diesem Grund besser. Auch bei Überdosierungen, zum Beispiel bei Menschen mit Drogenabhängigkeit, gilt Buprenorphin als sicher und hat ein geringeres Risiko für die tödliche Atemdepression. In der Substitutionstherapie ist Buprenorphin neben Methadon ein pharmakokinetisch gut geeigneter Wirkstoff. Die hohe Affinität an den μ -Rezeptoren ver-

hindert die Bindung von zeitgleich konsumiertem Heroin, sodass keine oder nur eine geringe euphorisierende Wirkung entsteht. Auch die fixe Kombination mit dem Antagonisten Naloxon ist verfügbar. So soll der intravenöse Missbrauch, wenn Schmelztabletten aufgelöst und gespritzt werden, verhindert werden. Buprenorphin zeigt nach Anwendung die typischen analgetischen, antitussiven und sedierenden Wirkungen, sowie die üblichen häufigen Nebenwirkungen Übelkeit, vermehrtes Schwitzen, Obstipation, Juckreiz und Schwindel.

Pharmakokinetik Der Wirkstoff ist lipophil, wird nach oraler Einnahme zunächst gut resorbiert, hat aber dann eine geringe Bioverfügbarkeit und unterliegt einem First-Pass-Effekt. In der analgetischen Therapie wird Buprenorphin überwiegend als transdermales therapeutisches System (TTS) eingesetzt. Zunächst sollte mit der niedrigsten Dosierung begonnen werden. Es stehen TTS in Dosierungen von fünf, zehn und 20 Mikrogramm pro Stunde zur Verfügung. Bis ausreichende Plasmaspiegelspitzen über die Haut erreicht werden, dauert es etwa zwölf bis 24 Stunden. Anschließend bleiben diese Niveaus konstant über die Zeit bis zum nächsten Pflasterwechsel, der gewöhnlich nach drei bis sieben Tagen, je nach Präparat, erfolgt. Zur Dosissteigerung sollte das aktuelle Pflaster durch ein Pflaster mit höherer Wirkstärke ersetzt werden. Auch die Kombination zweier Pflaster unterschiedlicher Stärken ist möglich. Nach Entfernen des Pflasters klingen

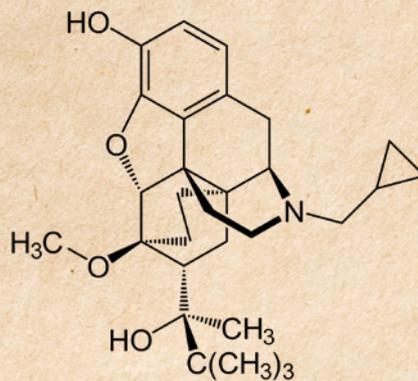
die Serumkonzentrationen und damit der analgetische Effekt langsam ab. Dies ist zu bedenken, wenn die Opioid-Therapie gewechselt werden soll. Bei der Pflaster-Therapie sollten Sie den Kunden darauf hinweisen, starke Wärmeeinwirkung zu vermeiden, weil sonst erhöhte Resorptionsraten und verstärkte Opioidwirkungen möglich sind. Buprenorphin wird zum Teil biliär und zum Teil über die Niere eliminiert, sodass bei Patienten mit Niereninsuffizienz eine Dosisanpassung vorzunehmen ist.

Pharmakodynamik Bei Buprenorphin sind die üblichen Wechselwirkungen der Opioiden mit zentral wirkenden Arzneistoffen, wie Benzodiazepinen, Psychopharmaka, Antihistaminika, Antidepressiva und Alkohol, zu beachten. Die gleichzeitige Anwendung von Buprenorphin mit anderen serotonergen Arzneimitteln wie MAO-Hemmern, SSRN oder SSNRI kann zu einem Serotoninsyndrom führen. Buprenorphin wird zu 30 Prozent über CYP 3A4 metabolisiert und kann deshalb potenziell mit Induktoren und Inhibitoren in Wechselwirkung treten. Diese scheinen aber laut Fachinformation nicht relevant zu sein. Bei Erstverordnung sollten die Patienten auf die Einschränkung der Reaktionsfähigkeit, zum Beispiel im Straßenverkehr oder beim Bedienen von Maschinen, hingewiesen werden. In Schwangerschaft und Stillzeit ist Buprenorphin kontraindiziert. ■

Dr. Katja Renner,
Apothekerin

Wanted

Buprenorphin



Wirkung

durch partialagonistische Wirkung an Opioid-Rezeptoren Hemmung der Schmerzweiterleitung

Hauptindikationen

Analgetikum bei starken akuten und chronischen Schmerzen, zur Substitutionstherapie

Einnahme

oral, transdermal

Nebenwirkungen

Schwindel, Benommenheit, gastrointestinale Beschwerden (Übelkeit, Obstipation und Erbrechen), Atemdepression, vermehrtes Schwitzen, Müdigkeit und Kopfschmerzen, Miktionsstörungen, Urtikaria, Juckreiz, Miosis

Kontraindikationen

Schwangerschaft und Stillzeit, Drogenmissbrauch, Leberinsuffizienz, chron. Darmerkrankungen, Abhängigkeitserkrankung, Asthma, Schwangerschaft und Stillzeit, gleichzeitige Einnahme von MAO-Hemmern

Wechselwirkungen

Zentralwirkende Wirkstoffe wie Benzodiazepine, Sedativa, Antidepressiva, Alkohol, Anticholinergika, Antihistaminika, serotonerge Arzneimittel