

Ein langer Weg

Das Antihistaminikum Loratadin darf schon lange ohne Rezept bei Heuschnupfen und allergischen Hautausschlägen abgegeben werden. Jetzt wird auch **Desloratadin** aus der Rezeptpflicht entlassen. Was sind die Hintergründe?

Antihistaminika bewirken eine selektive Hemmung von Histamin- H_1 -Rezeptoren. Die Substanzen der ersten Generation, wie Diphenhydramin, Doxylamin oder Dimenhydrinat, wirken

auch an zentralen Histaminrezeptoren, weshalb sie müde machen und gegen Übelkeit wirken. Sie werden heute ausschließlich als Schlafmittel oder gegen Reiseübelkeit eingesetzt, obwohl auch sie antiallergisch wirken. Auch Clemastin und

Dimetinden zählen zur ersten Generation. Sie finden noch Einsatz bei allergischen Reaktionen, Dimetinden vor allem bei akut auftretenden Hautreaktionen. Der Nachteil an Clemastin ist, dass es zweimal täglich eingenommen werden

muss. Antihistaminika der zweiten Generation wurden chemisch so verändert, dass sie die Blut-Hirn-Schranke nicht oder nur in geringem Maße überwinden können, sodass die zentrale Wirkung entfällt. Loratadin und Cetirizin sind typische Vertreter, die kaum noch müde machen. Durch ihre lange Plasmahalbwertszeit müssen sie nur einmal täglich eingenommen werden.

Die dritte Generation Letztes Jahr wurde bereits ein anderes Antihistaminikum, nämlich Levocetirizin, für die Selbstmedikation zugelassen. Es ist das R-Enantiomer des Cetirizins. Cetirizin ist das Razemat aus dem links- und rechtsdrehenden Enantiomer. Da aber nur das eine Enantiomer für die Wirkung verantwortlich ist, sein Spiegelbild hingegen nichts zur Wirkung beiträgt, kann man auch auf die unwirksame Form verzichten. Dadurch war es in diesem Fall möglich die Dosierung zu halbieren. Cetirizin wird in Tabletten zu 10 Milligramm angeboten, Levocetirizin in Tabletten zu 5 Milligramm.

Bei Desloratadin verhält es sich chemisch gesehen ein bisschen anders. Mit der Vorsilbe „Des-“ oder manchmal auch „De-“ wird angegeben, dass dieser Substanz gegenüber der Stammverbindung etwas fehlt. Das ▶



© Jevtic / iStock / Getty Images

Wenn die neue Zahnprothese schmerzt

Was man in der Eingewöhnungszeit gegen Entzündungen im Mundraum tun kann.



Lidocain stoppt den Schmerz, die Kamille wirkt zusätzlich beruhigend, entzündungshemmend und fördert so die Heilung der entzündeten Mundschleimhaut. Kamistad® wirkt punktgenau am Entzündungsherd und bietet dank seiner einzigartigen 2-fach-Wirkung Schmerzbehandlung plus Entzündungshemmung in einem Produkt!

Ideal für jede Hausapotheke.

Kamistad®, der überlegene Marktführer mit 48% Marktanteil, ist bei Zahnfleischentzündungen, Entzündungen der Mundschleimhaut und besonders schmerzhaften Aphten seit über 40 Jahren die bewährte Sofort-Hilfe für Jung und Alt. ■

Entzündungen in Mund- und Rachenraum treten meist in Form von Schwellungen und Rötungen auf. Diese gehen oft einher mit zum Teil heftigen Schmerzen und schränken deshalb das Leben der Betroffenen stark ein, da Sprechen, Kauen und Schlucken nur noch beschwerlich möglich sind.

Viele verschiedene Ursachen. Für diese Entzündungen gibt es eine ganze Reihe an Auslösern: Druckstellen durch Prothesen oder Zahnspangen, Aphten aufgrund eines geschwächten Immunsystems sowie durch Vitamin- oder Eisenmangel, trockene

Mundschleimhaut, eine unzureichende Mundhygiene, allergische Reaktionen auf Nahrungsmittel, Medikamente oder Piercing-Schmuck bis hin zu Beschwerden der Weisheitszähne und kleinen Verletzungen durch zahnärztliche Behandlungen, heißes Essen oder spitze Nahrungbestandteile.

Einzigartige 2-fach-Wirkstoffkombination hilft. Wer unter Entzündungen des Zahnfleisches oder der Mundschleimhaut leidet, ist auf der Suche nach schneller Schmerzlinderung und rascher Heilung der entzündeten Stellen. Der Marktführer* Kamistad® eignet sich für

Erwachsene und Kinder ab 12 Jahren. Denn Kamistad® enthält die zwei aufeinander abgestimmten Wirkstoffe Lidocain und Kamille. Lido-

KAMISTAD®

- Einzigartige 2-fach-Wirkung
- Lidocain lindert schnell den Schmerz
- Kamille fördert zusätzlich die Heilung
- Bewährt seit 40 Jahren – praktisch und einfach in der Anwendung
- Auch für Prothesen- und Zahnspangenträger eine gute Empfehlung

Lindert den Schmerz.
Fördert die Heilung.



*IQVIA 01/2020 nach Umsatz und Absatz Stomatologika

Kamistad® Gel 20 mg Lidocain-HCl/185 mg Auszug aus Kamillenblüten/1 g Gel zur Anwendung in der Mundhöhle. Wirkstoffe: Lidocainhydrochlorid und Auszug aus Kamillenblüten. Zus.: 1 g Gel enth. 20 mg Lidocainhydrochlorid 1H₀ u. 185 mg Auszug aus Kamillenblüten (1.4–5). **Auszugsm.:** Ethanol 50% (V/V) mit 1,37% Trometamol (eingestellt m. Methansäure 98% auf pH 7,3). **Sonst. Bestandt.:** Benzalkoniumchlorid, Ethanol 96%, Methansäure, Polyacrylsäure, Saccharin-Na, Trometamol, Gerein. Wasser, Wasser, Zimtöl. **Anw.:** Traditionell angew. als mild wirkendes AM b. leichten Entzünd. d. Zahnfleisches u. d. Mundschleimhaut. **Gegenanz.:** Überempf. gg. d. Wirkstoffe, and. Lokalanästhetika v. Amid-Typ od. e. d. sonst. Bestandt. **Schwangersch./Stillz.:** Nur nach sorgfält. Nutzen-Risiko-Abwäg. **NW:** Vorübergeh. leichtes Brennen; allerg. Reakt. (z.B. Kontaktallergie), auch b. Überempf. gg. Korbblütler (z.B. Beifuß) u. Perubalsam (sog. Kreuzreakt.); Überempf.reakt. an Haut u. Schleimhäuten. **Warnhinw.:** Enthält Benzalkoniumchlorid. **Hinw.:** Bei fehlender Besserung d. Entzündungszeichen innerhalb 1 Wo. sowie beim Auftret. unklarer Beschwerden sollte ein Arzt aufgesucht werden. Angaben gekürzt – Weitere Einzelheiten entnehmen Sie bitte d. Fach- bzw. Gebrauchsinformation. Stand: September 2013. STADA GmbH, Stadastraße 2–18, 61118 Bad Vilbel

► was fehlt, wird im Anschluss angegeben. Hier wäre der vollständige Name Descarboethoxyloratadin, das klingt aber etwas sperrig, daher kurz: Desloratadin. Es handelt sich also nicht um Bild und Spiegelbild beziehungsweise Enantiomer und Racemat, sondern um eine Abwandlung des Moleküls, um

Rechtsstreit voraus. Genau genommen gab es schon seit seiner Einführung Streitigkeiten. Denn bereits 2001, kurz vor Ablauf des Patents für Loratadin, stoppte der Hersteller die Produktion und brachte Desloratadin auf den Markt, um den Generika-Markt für Loratadin zu behindern. Die Pa-

theitsministerium (BMG) folgte der Empfehlung nicht, sondern verwies darauf, dass es auf dem deutschen Markt neben national zugelassenen Arzneimitteln mit Desloratadin auch welche mit einer zentralen europäischen Zulassung gebe. Eine Entlassung aus der Verschreibungspflicht sei daher erst dann

nicht, denn es solle aus Gründen der Arzneimittelsicherheit keinen gespaltenen Markt für identische Produkte in der EU geben. Dass Produkte mit gleicher Risikolage in einigen Ländern verschreibungspflichtig seien und in anderen OTC-Produkte, sei nicht vermittelbar. Also handelte das BMG nicht.

Das Prodrug Loratadin wird fast vollständig in Desloratadin umgewandelt, was den beschleunigten Wirkungseintritt des neueren Arzneimittels erklärt.

ein Derivat. Man spricht wie beim Levocetirizin von der dritten Generation der Antihistaminika.

Höhere Rezeptoraffinität

Desloratadin besitzt eine etwa drei- bis vierfach höhere Affinität zum H_1 -Rezeptor als Loratadin, hat eine längere Plasmahalbwertszeit und einen schnelleren Wirkungseintritt. Auch hier konnte die Dosierung von 10 auf 5 Milligramm reduziert werden. Allerdings gilt der therapeutische Vorteil von Desloratadin als begrenzt, denn Loratadin wird in der Leber fast vollständig zu Desloratadin umgewandelt. Loratadin ist also quasi das Prodrug, Desloratadin der eigentliche Wirkstoff. Dies erklärt den schnelleren Wirkungseintritt. In Untersuchungen besserten sich die allergischen Symptome nach der Gabe von Desloratadin innerhalb von durchschnittlich 48 Minuten, nach Gabe von Loratadin erst nach 70 Minuten.

Langer Rechtsstreit Dem OTC-Switch von Desloratadin ging ein bemerkenswerter

tienten sollten auf Desloratadin umgestellt werden, bevor die preiswerteren Generika auf den Markt kommen. Außerdem würden nach Meinung des Herstellers Generika das Patent von Loratadin verletzen, weil Desloratadin ein Metabolit des Loratadins sei und das neue Patent dadurch auch wieder für Loratadin gelte. Also klagte der Originalhersteller gegen den Generikahersteller. Den Prozess verlor er allerdings vor einem US-amerikanischen Gericht.

EU-Kommission oder BMG

Auch der OTC-Switch landete vor Gericht. Allerdings nicht aus medizinischen Gründen, denn dass es sich um einen sicheren Arzneistoff handelt, steht außer Frage. Als der Antrag 2013 beim Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte (BfArM) gestellt wurde, wurde er wie vorgeschrieben geprüft und mit einer wissenschaftlichen Stellungnahme an den Sachverständigenausschuss für Verschreibungspflicht weitergegeben. Dieser empfahl den OTC-Switch, aber das Bundesgesund-

möglich, wenn die EU-Kommission dies auch für die zentral zugelassenen Arzneimittel anordne.

Der Antragsteller ließ nicht eher locker, bis das BMG eine Stellungnahme von der EU-Kommission erbat. Diese erklärte daraufhin, dass die EU-Mitgliedsstaaten das Recht hätten, selbst über die Verschreibungspflicht in ihrem Land zu entscheiden. Das gefiel dem BMG allerdings auch

Und dann doch der OTC-Switch

Das Pharmaunternehmen klagte gegen das BMG, was sich in einem langwierigen Prozess in mehreren Instanzen bis zum September 2019 zog. Das Unternehmen gewann vor dem Bundesverwaltungsgericht und das BMG hat inzwischen den Entwurf einer Verordnung zur Änderung der Arzneimittelverschreibungsverordnung vorgelegt. Ausgenommen von der Verschreibungspflicht ist Desloratadin nun in der oralen Anwendung zur symptomatischen Behandlung bei allergischer Rhinitis und Urtikaria bei Erwachsenen, Jugendlichen und Kindern ab zwei Jahren, es sei denn, es handelt sich um von der Europäischen Kommission als verschreibungspflichtig zugelassene Arzneimittel. Lesen Sie online unter www.diepta.de/pta-plus, wie so ein OTC-Switch genau funktioniert. ■

Sabine Breuer,
Apothekerin/Chefredaktion

EVERGREENING

Der Patentschutz für Arzneimittel gilt 20 Jahre. Diese Zeit dient zur Refinanzierung der Forschungskosten. Eine geringe Molekülabwandlung erspart zum einen die aufwändige Suche nach einem ganz neuen Arzneistoff. Zum anderen bietet sie die Möglichkeit, dadurch eine Verlängerung des Patentschutzes zu erreichen. Dies wird auch als Evergreening bezeichnet.

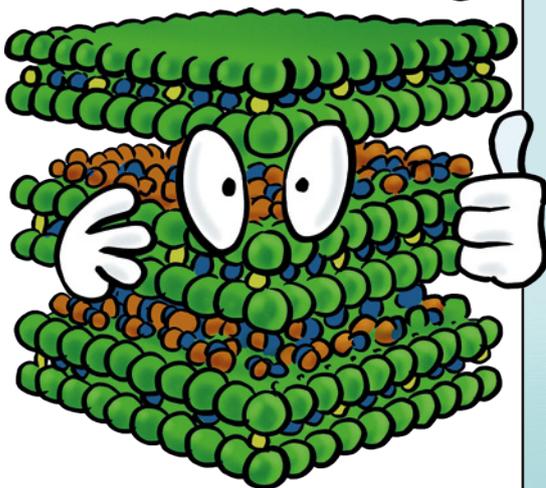
– DER RETTUNGSSCHWIMMER VOM MAGENSÄURESEE



Schon gewusst?

Talcid® ist ein »Schichtgitter-Antazidum« und enthält als Wirkstoff Hydrotalcit, das auch als natürliches Mineral vorkommt. Hydrotalcit besteht aus zwei gitterförmig aufgebauten Schichten. Eine Schicht besteht aus Aluminium- und Magnesium-Hydroxid, die zweite aus Carbonat-Ionen und Wasser. Diese Schichten sind mehrfach übereinander gelagert und werden durch elektrostatische Kräfte zusammengehalten.

Die Schichtgitterstruktur von Hydrotalcit ermöglicht eine rasche, kontrollierte Neutralisation überschüssiger Magensäure. Bis zu einem pH-Wert von 4,5 werden Magnesium- und Aluminium-Hydroxid-Teilchen aus der Hydrotalcit-Struktur gelöst. Die Säure wird rasch entsprechend der Menge der gelösten Teilchen neutralisiert. Durch den steigenden pH-Wert im Magen verringert sich die Löslichkeit von Hydrotalcit und die Neutralisationsreaktion kommt zum Stillstand. Außerdem kann Hydrotalcit die Magenschleimhaut durch seine mukosaprotektiven Eigenschaften schützen. Sinkt der pH-Wert wieder ab, wird der Lösungsprozess von Hydrotalcit erneut in Gang gesetzt. Dieser Prozess wird immer wieder durchlaufen, bis der Wirkstoff aufgebraucht ist oder den Magen verlassen hat. Der pH-Wert bleibt so im therapeutisch günstigen Bereich. Bei Bedarf kann Talcid mehrfach am Tag entsprechend den Empfehlungen der Packungsbeilage eingenommen werden.



Talcid® Kautabletten, Talcid® Liquid, Wirkstoff: Hydrotalcit, **Zusammensetzung:** 1 Kautablette Talcid enthält: Wirkstoff: 500 mg Hydrotalcit, sonstige Bestandteile: Mannitol, Maisstärke, Magnesiumstearat, Saccharin-Natrium, Aromastoffe. 10 ml Talcid Liquid (1 Portionsbeutel) enthalten: Wirkstoff: 1000 mg Hydrotalcit, sonstige Bestandteile: Gereinigtes Wasser, Carmellose-Natrium, hochdisperses Siliciumdioxid, Bentonit, Zimtöl, Saccharin-Natrium, Aromastoff.

Anwendungsgebiete: Zur symptomatischen Behandlung von Erkrankungen, bei denen die Magensäure gebunden werden soll: Magen- und Zwölffingerdarmgeschwüre (Ulcus ventriculi und Ulcus duodeni); Sodbrennen und säurebedingte Magenbeschwerden. **Gegenanzeigen:** Überempfindlichkeit gegen Hydrotalcit oder einen der sonstigen Bestandteile. Schwere Nierenfunktionsstörungen, Myasthenia gravis und Hypophosphatämie. Bei eingeschränkter Nierenfunktion nur unter ärztlicher Kontrolle des Serumspiegels von Magnesium und Aluminium. **Nebenwirkungen:** Magen-Darm-Trakt: Bei hoher Dosierung kann es zu Verstopfung, breiigem, bis hin zu dünnflüssigem Stuhl und erhöhter Stuhlfrequenz sowie Erbrechen kommen. **Blut:** Bei Niereninsuffizienz und langfristiger Einnahme hoher Dosen kann es zu Hypermagnesiämie, Aluminiumeinlagerung vor allem in das Nerven- und Knochen-gewebe und zur Phosphatverarmung kommen. **Immunsystem:** Allergische Reaktionen sind möglich.

Bayer Vital GmbH, 51368 Leverkusen, Deutschland Stand:11/2014